



## Risperidon



Risperidon wird vorwiegend in der Leber zu 9-Hydroxyrisperidon metabolisiert, sodass schnelle Metabolisierer eine niedrigere Risperidon- und eine höhere 9-Hydroxyrisperidon-Konzentrationen im Plasma aufweisen als Langsammetabolisierer. 9-Hydroxyrisperidon weist eine dem Risperidon vergleichbare Wirksamkeit auf, hat aber eine längere Eliminationshalbwertszeit. Risperidon wird schneller als sein Metabolit 9-Hydroxyrisperidon in die Hirngewebe verteilt und daraus wieder eliminiert. Maßgebend ist die Summe ihrer Konzentrationen.

**Präanalytik** Blutentnahme am Ende eines Dosierungsintervalls

**Material** Serum, 1 mL

**Therap. Bereich** 2 - 10 µg/L

**Tox. Bereich** > 50 µg/L



**Therap. Bereich** 20 - 60 µg/L Risperidon+ Hydroxyrisperidon

**Tox. Bereich** > 120 µg/L Risperidon+ Hydroxyrisperidon



**Methode** LC-MS/MS

**Qualitätskontrolle** Zertifikat

**Anforderungsschein** Download und Analysenposition

**Auskünfte** Klinische Chemie und Toxikologie

**Stoffgruppe** Neuroleptika

**Handelsnamen**

- ▶ Risocon
- ▶ Risperdal
- ▶ Risperidon
- ▶ Risperigamma

**Pharmakologie** Neuroleptikum zur Therapie von chronisch schizophrenen Psychosen einschließlich Exazerbationen; auch für die Erhaltungstherapie zur Rezidivprophylaxe von stabil eingestellten Patienten. Des Weiteren zur Therapie chronischer Aggressivität und psychotischen Symptome bei Demenz. Die Substanz besitzt bislang einzigartige Eigenschaften: Sie hat eine hohe Affinität zu serotoninerger 5-HT<sub>2</sub> - und dopaminerger D<sub>2</sub>-Rezeptoren und bindet ebenfalls an α<sub>1</sub>-adrenerge und mit geringerer Affinität an H<sub>1</sub>-histaminerge und α<sub>2</sub>-adrenerge Rezeptoren. Eine Affinität zu cholinergen Rezeptoren ist nicht vorhanden. Das klinische Wirkprofil ist durch antipsychotische Wirkungen gekennzeichnet. Extrapyramidale Nebenwirkungen waren in klinischen Studien im Vergleich zu klassischen Neuroleptika von geringerer Häufigkeit, was hypothetisch mit dem kombinierten Serotonin-Dopamin-Rezeptorantagonismus erklärt wird. Risperidon wird nach oraler Verabreichung unabhängig von der Einnahme von Nahrung vollständig resorbiert, Spitzenplasmaspiegel werden nach 1 - 2 Stunden gemessen. Risperidon wird über Cytochrom-P450-2D6 zu 9-Hydroxy-Risperidon metabolisiert; diese Substanz hat die gleichen pharmakologischen Eigenschaften wie Risperidon. Risperidon und 9-Hydroxy-Risperidon bilden die aktive antipsychotische Fraktion. Nach oraler Verabreichung an psychotische Patienten wird Risperidon mit einer Halbwertszeit von ungefähr 3 Stunden eliminiert. Die Eliminationshalbwertszeit von 9-Hydroxyrisperidon und der aktiven antipsychotischen Fraktion beträgt 24 Stunden. Steady state wird für Risperidon bei den meisten Patienten nach 1 Tag, für 9-



## Risperidon



Hydroxyrisperidon nach 4 - 5 Tagen Therapie erreicht. Die Risperidon-Plasmaspiegel sind innerhalb des therapeutischen Dosisbereiches dosisabhängig. Im Plasma wird Risperidon an Albumin und  $\alpha_1$ -saures Glykoprotein gebunden. Die Plasmaproteinbindung von Risperidon beträgt 88 %, die von 9-Hydroxyrisperidon 77 %. Nach 1 Woche sind 70 % der verabreichten Substanz mit dem Urin und 14 % in den Faeces ausgeschieden. Die im Urin ausgeschiedene Menge besteht zu 35 - 45 % aus unverändertem Risperidon und seinem Metaboliten 9-Hydroxyrisperidon.