

Paliperidon (Invega® / Xeplion®)

[Paliperidon](#) ist ein Arzneistoff aus der Gruppe der atypischen Neuroleptika. Unter dem Handelsnamen [Invega](#)® (Janssen Pharmaceutica) ist er seit 2007 in Form von Retardtabletten und als [Xeplion](#)® in intramuskulärer Depotform seit 2011 in der Europäischen Union zugelassen für die Behandlung der Schizophrenie. [Paliperidon](#) ist der aktive Hauptmetabolit „9-Hydroxyrisperidon“ des Antipsychotikums [Risperidon](#).

[Paliperidon](#) ist ein [Arzneistoff](#) aus der Gruppe der [atypischen Neuroleptika](#). Unter dem [Handelsnamen](#) [Invega](#)®(Janssen Pharmaceutica) ist er seit 2007 in Form von Retardtabletten und als [Xeplion](#)® in intramuskulärer Depotform seit 2011 in der Europäischen Union zugelassen für die Behandlung der [Schizophrenie](#).

[Paliperidon](#) ist der aktive Hauptmetabolit „9-Hydroxyrisperidon“ des [Antipsychotikums Risperidon](#).

Klinische Angaben

[Paliperidon](#) ist der aktive Hauptmetabolit des [Neuroleptikums Risperidon](#): Im menschlichen Organismus bildet sich nach Einnahme von [Risperidon](#) dessen Abbauprodukt [Paliperidon](#), welches [pharmakologisch](#) wirksam ist. Hinsichtlich der erwünschten und unerwünschten Wirkungen gleicht [Paliperidon](#) weitgehend dem [Risperidon](#). Allerdings wurde vom Hersteller bisher noch keine Vergleichsstudie ([Head-to-Head-Study](#)) veröffentlicht. Auf den ersten Blick fällt es schwer, den therapeutischen Mehrwert von [Paliperidon](#) zu erkennen.

Pharmakologische Eigenschaften

Wirkungsmechanismus (Pharmakodynamik)

Der [Wirkmechanismus](#) ist teilweise schon bei [Risperidon](#) beschrieben. [Paliperidon](#) bindet stark an [Serotonin-5-HT₂](#)- und [Dopamin-D₂-Rezeptoren](#). Darüber hinaus blockiert [Paliperidon](#) auch [?1-Adrenozeptoren](#) und, in geringerem Ausmaß, [Histamin-H₁-Rezeptoren](#) sowie [?2-Adrenozeptoren](#). Die pharmakologische Wirkung der (+)- und (-)-[Paliperidon-Enantiomere](#) ist qualitativ und quantitativ ähnlich.

Aufnahme und Verteilung im Körper (Pharmakokinetik)

Die [Pharmakokinetik](#) von [Paliperidon](#) unterscheidet sich in einigen Punkten von [Risperdal](#). Auf Grund der Retardform kommt es zu geringeren Schwankungsbreiten zwischen den Spitzen- und Talkonzentrationen im Vergleich zu jenen, die bei [Risperidon](#)-Präparaten mit sofortiger Freisetzung beobachtet wurden.

Die absolute orale [Bioverfügbarkeit](#) von [Paliperidon](#) beträgt 28 %. Da die Resorption auch davon abhängt, ob die Einnahme auf nüchternen Magen oder mit einer Mahlzeit erfolgt, ist es notwendig, dass die Patienten sich für eine Art der Einnahme entscheiden und dabei bleiben.

[Paliperidon](#) wird höchstwahrscheinlich nicht extensiv in der Leber metabolisiert. [In vivo](#) wurden keine Hinweise auf eine signifikante Verstoffwechslung von [Paliperidon](#) durch die Enzymformen [CYP2D6](#) und [CYP3A4](#) gefunden, obwohl [In-vitro](#)-Studien auf eine mögliche

Beteiligung hatten schließen lassen. Die [Elimination](#) von [Paliperidon](#) erfolgt hauptsächlich über die Nieren, eine Reduzierung der Dosis je nach [Nierenfunktion](#) ist erforderlich.

Indikation

Die derzeitige [Indikation](#) ist auf die Behandlung der [Schizophrenie](#) beschränkt. Seit Anfang 2011 besteht eine Indikationserweiterung zur Behandlung von psychotischen und manischen Symptomen [schizoaffektiver Störungen](#) (das erste Neuroleptikum mit dieser Indikation in der Europäischen Union). Im Dezember 2008 wurde die zuvor eingereichte Indikationserweiterung zur Behandlung von akuten manischen Episoden bei [Bipolar-I-Störungen](#) von der Firma zurückgezogen, da die klinischen Belege unzureichend waren.

Isomerie und chemische Eigenschaften

[Paliperidon](#) ist [chiral](#) und als [Racemat](#) (\pm)-[Paliperidon](#) im Handel. Es gehört zur Gruppe der Benzisoxazol-[Derivate](#). [Paliperidon](#) ist kaum löslich in 0, 1 N [Salzsäure](#) und [Dichlormethan](#); praktisch unlöslich in Wasser, 0, 1 N [Natriumhydroxid](#) und *n*-Hexan; und wenig löslich in [N,N-Dimethylformamid](#).

Zulassung, Vermarktung

[Paliperidon](#) (in oraler Form: [Invega](#)®) ist seit Juni 2007 in der ganzen EU ([zentrale Zulassung](#)) und seit Mai 2008 auch in der Schweiz zugelassen. Im Gegensatz zu Deutschland und der Schweiz ist [Paliperidon](#) in Österreich aber nicht am Markt, da der [Hauptverband der österreichischen Sozialversicherungsträger](#) die Erstattungsfähigkeit abgelehnt hat. Zunächst 2007 wegen der fehlenden Kleinpackung, die in Österreich verpflichtend ist. Nach der Zulassung einer zusätzlichen 14-Stück-Packung wurde der Antrag 2008 erneut eingereicht und Anfang 2009 endgültig abgelehnt.

Am 9. März 2011 gab Janssen-Cilag bekannt, dass die [Depotform](#) ([Paliperidon](#)-Palmitat, Handelsname [Xeplion](#)®) die Zulassung der Europäischen Kommission erhalten habe. Dosisstärken sind 25, 50, 75, 100 und 150 mg.

[Invega® - compendium.pdf](#)