

Electronic Certificate

Version: 1 . 0

Document Number: ES-RXU-2400041

Document Name: Material Rxultii Mecanismo Acción DIGITAL

Country: Spain

Product: Rxulti

Type: Material

Sub Type: Auto-published

Classification:

Material Intent: Promotional

Description: Material Rxultii Mecanismo Acción DIGITAL

Target Audience: HCP

Method of Dissemination: Sales Force

Certification Statement

We certify that the final electronic form of this material is in accordance with the regulations set forth by the health authority for the country of this document, and is a fair and truthful presentation of the facts about the product.

Role	Signature
Ana Gobartt - Certificación digital (agobartt@otsuka-europe.com)	Meaning: As the Medical, I approve this document for use. Date: 08-Apr-2024 08:30:41 GMT+0000
Alvaro de Torre - Certificación digital (adetorre@otsuka-europe.com)	Meaning: As the BUM, I approve this document for use. Date: 08-Apr-2024 14:33:55 GMT+0000



MECANISMO DE ACCIÓN
DIFERENCIAL



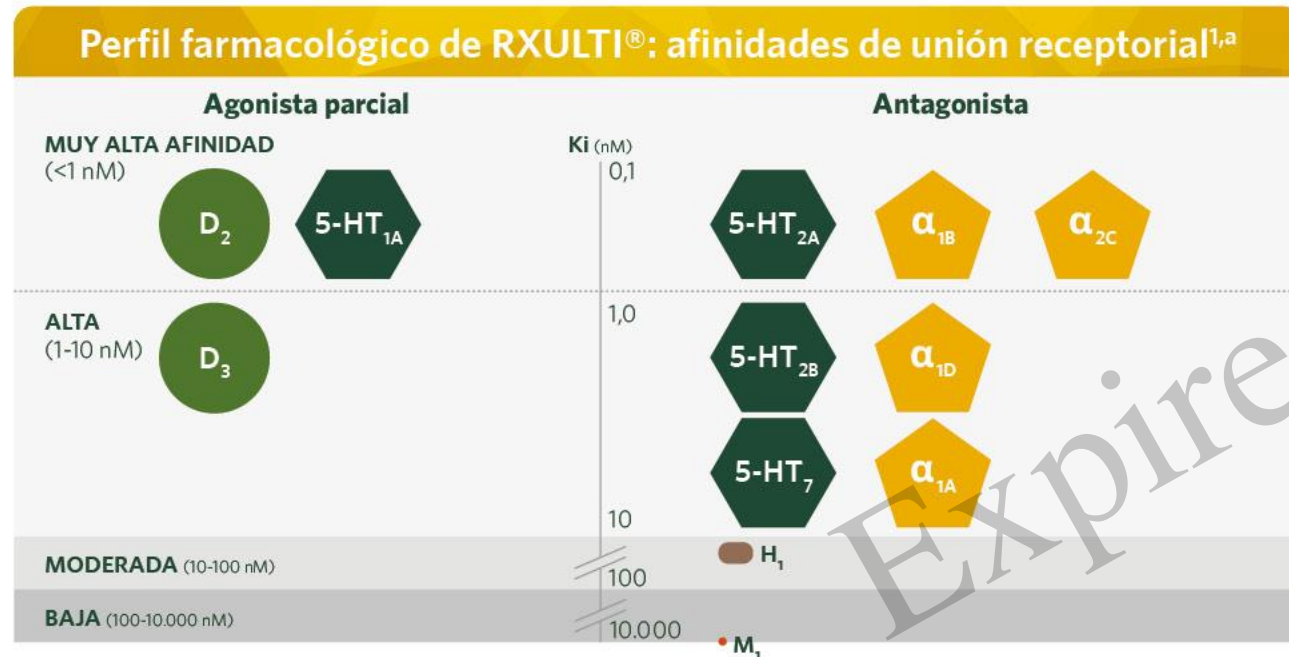
IMPLICACIONES CLÍNICAS
ESTIMADAS DEL PERFIL
RECEPTORIAL



RXULTI®,
mecanismo de acción diferencial
para el tratamiento de la esquizofrenia
en la fase aguda y la fase de mantenimiento.



RXULTI[®], mecanismo de acción diferencial

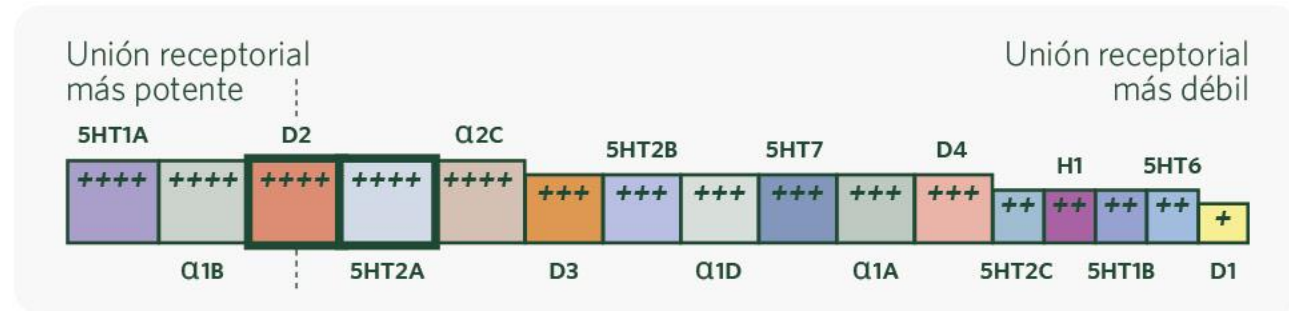


Muy alta afinidad de unión: Ki <1 nM¹

^aLa afinidad de unión de brexpiprazol se determinó in vitro en células que sobreexpresan receptores humanos y se expresa como una concentración nM donde los valores más bajos representan una mayor afinidad.

Adaptado de Maeda et al. 2014

► Grado de afinidad de la unión receptorial de Rxulti²:

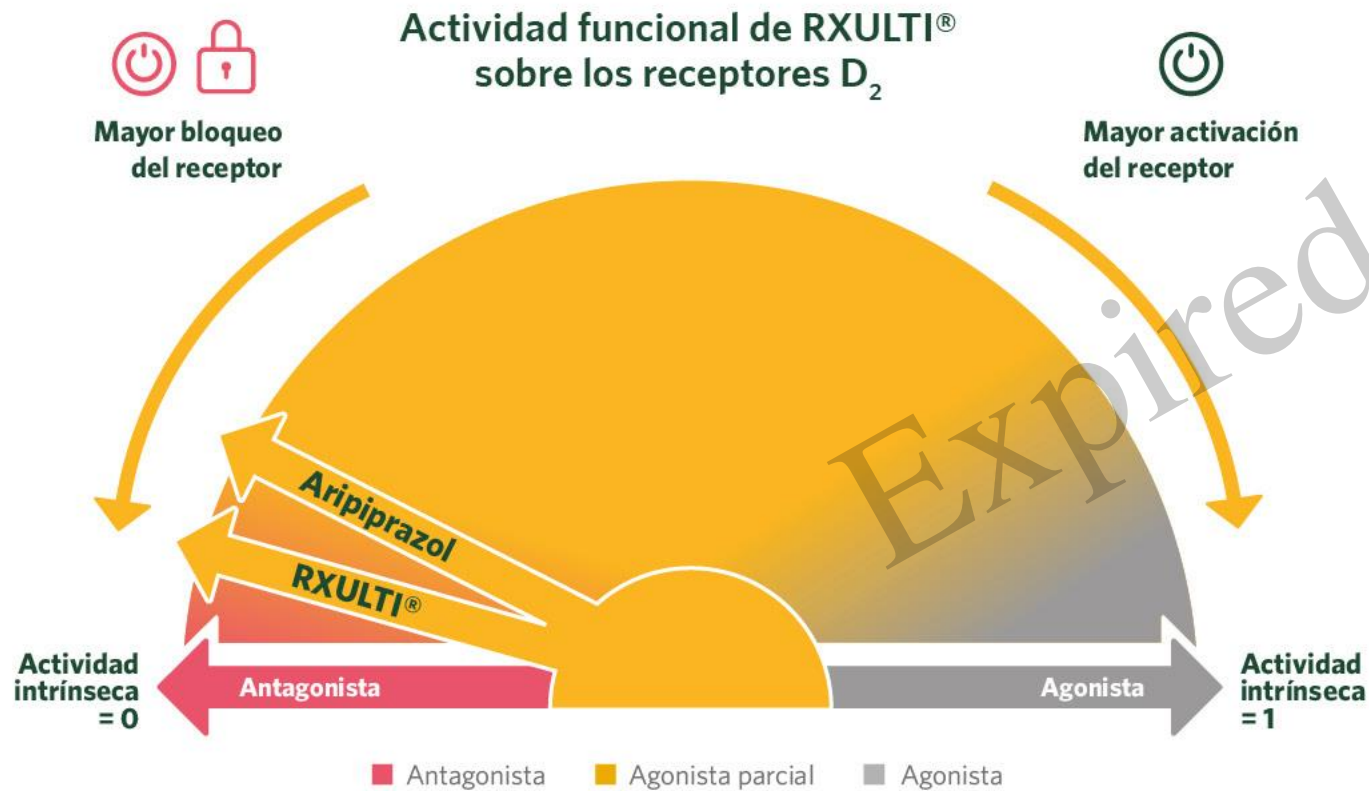


RXULTI[®], único antipsicótico con muy alta afinidad por el sistema dopaminérgico, serotoninérgico y noradrenérgico¹

La línea vertical indica la unión al receptor D₂ de la dopamina, generalmente con una ocupación del 60-80% en el tratamiento de la esquizofrenia.

Adaptado de Stahl et al. 2016

RXULTI[®], mecanismo de acción diferencial



RXULTI[®] es un agonista parcial del receptor D₂ con baja actividad intrínseca, promoviendo menor riesgo de efectos adversos activadores* relacionados con el agonismo de los receptores D₂^{1,2}

Adaptado de Maeda, et al. J Pharmacol Exp Ther. 2014.

*Determinado *in vitro* en células que sobreexpresan los receptores humanos.

*Efectos adversos activadores: acatisia, inquietud, agitación, ansiedad e insomnio.

Implicaciones clínicas estimadas del perfil receptorial de RXULTI®



D₂

α_{2c}

Eficacia antipsicótica

La baja actividad intrínseca sobre el receptor D₂ junto al antagonismo α_{2c} podría relacionarse con un efecto antipsicótico sinérgico.¹⁻⁴

D₂

5-HT_{2A}

5-HT_{1A}

α_{1B}

Perfil de tolerabilidad

La baja actividad intrínseca sobre el receptor D₂ y la combinación del antagonismo potente 5-HT_{2A}, el agonismo parcial de 5-HT_{1A} y el antagonismo de α_{1B} le confiere:

- Un bajo **potencial para inducir SEP, acatisia e hiperprolactinemia** derivados del antagonismo sobre el receptor D₂.^{1-3,5,6}
- Un **bajo potencial para inducir** efectos adversos asociados al agonismo D₂ (**inquietud, insomnio, intranquilidad y náuseas**).¹⁻³

SEP: síntomas extrapiramidales.

5-HT_{1A}

α_{2c}

Eficacia en sintomatología depresiva y ansiosa

El agonismo parcial sobre 5-HT_{1A} junto al antagonismo en α_{2c} podría relacionarse con un efecto antidepresivo y ansiolítico.¹⁻⁵

D₂

H₁

Bajo potencial de activación*/sedación

La baja actividad intrínseca sobre el receptor D₂ y la baja afinidad por el receptor H₁ podrían estar relacionados con el bajo potencial de generar inquietud y sedación.^{1-3,7}

*Activación: acatisia, inquietud, agitación, ansiedad e insomnio.

Aportando resultados Superando expectativas



- ▶ **RXULTI®** es el único antipsicótico con **muy alta afinidad por el sistema dopaminérgico, serotoninérgico y noradrenérgico**.^{1,2}
- ▶ **RXULTI®** es agonista parcial de los receptores **D₂** y **5-HT_{1A}** y antagonista de los receptores **5-HT_{2A}**, **α_{1B}** y **α_{2C}**.
- ▶ **RXULTI®** es eficaz en el tratamiento de la esquizofrenia y promueve la **modulación de los procesos afectivos** por su alta afinidad al sistema dopaminérgico, serotoninérgico y noradrenérgico.^{1,9-12}
- ▶ El perfil receptorial de **RXULTI®** promueve su **bajo potencial** de inducir efectos adversos **activadores*** y **sedativos**.^{1-3,7}



*Efectos adversos activadores: acatisia, inquietud, agitación, ansiedad e insomnio

Referencias: 1. Maeda, Kenji et al. "Brexiprazole I: in vitro and in vivo characterization of a novel serotonin-dopamine activity modulator." *The Journal of pharmacology and experimental therapeutics* vol. 350,3 (2014): 589-604. 2. Stahl, Stephen M. "Mechanism of action of brexpiprazole: comparison with aripiprazole." *CNS spectrums* vol. 21,1 (2016): 1-6. 3. Das S, Barnwal P, Winston A 8, et al. Brexpiprazole: so far so good. *Therapeutic advances in psychopharmacology*. 2016;6(1):39-54. 4. Uys MM, Shahid M, Harvey BH. Therapeutic Potential of Selectively Targeting the α₂-Adrenoceptor in Cognition, Depression, and Schizophrenia-New Developments and Future Perspective. *Front Psychiatry*. 2017 Aug 14;8:144. 5. Siwek, Marcin et al. "Brexiprazole-Pharmacologic Properties and Use in Schizophrenia and Mood Disorders." *Brain sciences* vol. 13,3 397. 25 Feb. 2023. 6. Frampton, James E. "Brexiprazole: A Review in Schizophrenia." *Drugs* vol. 79,2 (2019): 189-200. 7. Citrome, Leslie. "Activating and Sedating Adverse Effects of Second-Generation Antipsychotics in the Treatment of Schizophrenia and Major Depressive Disorder: Absolute Risk Increase and Number Needed to Harm." *Journal of clinical psychopharmacology* vol. 37,2 (2017): 138-147. 8. Ficha Técnica Rxulti (Brexiprazole). 9. Stahl SM. *Stahl's Essential Psychopharmacology*. 2nd ed. Cambridge University Press; 2000: pp135-97. 10. Nutt DJ. Relationship of neurotransmitters to the symptoms of major depressive disorder. *J Clin Psychiatry*. 2008;69(Suppl E1):4-7. 11. Robbins TW, Arnsten AFT. The neuropsychopharmacology of fronto-executive function: monoaminergic modulation. *Annu Rev Neurosci*. 2009;32:267-287. 12. Kehagia AA, Murray GK, Robbins TW. Learning and cognitive flexibility: frontostriatal function and monoaminergic modulation. *Curr Opin Neurobiol*. 2010;20:199-204.

Aportando resultados Superando expectativas

CONDICIONES DE PRESCRIPCIÓN Y DISPENSACIÓN Medicamento sujeto a prescripción médica. **CONDICIONES DE PRESTACIÓN AL SISTEMA NACIONAL DE SALUD** Reembolsable por el Sistema Nacional de Salud. Medicamento de aportación reducida.

PRESENTACIONES Y PRECIOS RXULTI 1 mg comprimidos recubiertos con película, 10 comprimidos PVP: 16,23 €, PVP IVA: 16,88 €. RXULTI 1 mg comprimidos recubiertos con película, 28 comprimidos PVP: 45,44 €, PVP IVA: 47,25 €. RXULTI 2 mg comprimidos recubiertos con película, 28 comprimidos PVP: 45,44 €, PVP IVA: 47,25 €. RXULTI 3 mg comprimidos recubiertos con película, 28 comprimidos PVP: 45,44 €, PVP IVA: 47,25 €. RXULTI 4 mg comprimidos recubiertos con película, 28 comprimidos PVP: 45,44 € PVP IVA: 47,25 €.

Fecha de elaboración: marzo 2024

ES-RXU-2400041-v1.0 - ES-REXU-0058



Consulte aquí la ficha técnica de Rxulti®

