

Nové liečivá v EÚ registrované v roku 2013 (III.)

PharmDr. Peter Stanko

Univerzitná lekárň FaF UK, Bratislava

Prakt. lekár., 2014; 4(2-3): 85–86

Okriplazmín

Všeobecné fakty o liečive

INN: ocriplasmin

Držiteľ registrácie: ThromboGenics NV

ATC zatriedenie: S01XA22 – Iné oftalmologiká

Chemický názov: neuvádza sa

CAS: 1048016-9-6

Sumárny vzorec: $C_{1214}H_{1890}N_{338}O_{348}S_{14}$

Indikácie

Okriplazmín je indikovaný na liečbu vitreo-makulárnej trakcie (VMT) vrátane prípadov, keď je spojená s dierou makuly s priemerom menším alebo rovným 400 mikrónov.

Mechanizmus účinku

Okriplazmín vykazuje proteolytickú aktivitu proti proteínovým zložkám tela sklovca avitreo-retinálnemu rozhraniu (VRI) (napríklad laminín, fibronektín akolagén) a snaží sa rozpustiť proteínovú maticu, ktorá je zodpovedná za abnormálnu vitreomakulárnu adhéziu (VMA). Tesná väzba proteínových zložiek v rámci makulárnej oblasti VRI prispieva k vitreomakulárnej trakkii (VMT), čo vedie k zhoršeniu zraku alebo k vytvoreniu dier makuly.

Farmakokinetické parametre

Hladiny okriplazmínu v sklovci po intra-vitreálnom podaní rýchlo klesajú (dve – štyri hodiny po podaní injekcie dosahovala stredná aktivita asi 9 % z počiatočnej koncentrácie). Ak sa okriplazmín aplikuje intravenózne, prechádza do endogénnej dráhy proteínového katabolizmu, počas ktorej sa rýchlo deaktivuje vďaka interakcii s alfa2-anti-plazmínom. Neaktívny komplex okriplazmín/alfa2-anti-plazmín sa eliminuje z obehu s polčasom niekoľkých hodín.

Liekové riziko

Kontraindikáciou na použitie okriplazmínu je precitlivosť na liečivo. Aktívne alebo predpokladané očné alebo periokulárne infekcie sú kontraindikáciou na použitie okriplazmínu. Medzi najčastejšie nežiaduce účinky po podaní okriplazmínu patria zákal sklovca, bolesť očí a krvácanie očných spojiviek.

Uvedenie na trh

Okriplazmín uviedla na európsky trh farmaceutická spoločnosť ThromboGenics NV pod komerčným názvom Jetrea.

Bosutinib

Všeobecné fakty o liečive

INN: bosutinib

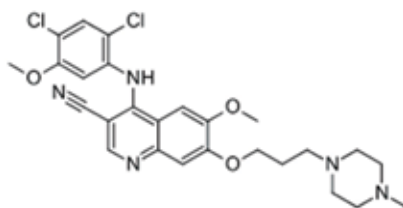
Držiteľ registrácie: Pfizer Ltd.

ATC zatriedenie: L01XE14 – Selektívne imunosupresíva

Chemický názov: 4-[(2,4-dichlóro-5-metoxifenyl)amino]-6-metoxý-7-[3-(4-metylpi-perazín-1-yl)propoxy]chinolín-3-karbonitril

CAS: 380843-75-4

Sumárny vzorec: $C_{26}H_{29}Cl_2N_5O_3$



Indikácie

Bosutinib je indikovaný na liečbu pacientov s chronickou myelocytovou leukémiou s pozitívitou Philadelphia chromozómu (Ph+ CML) v chronickej fáze (CP), akcelerovanej fáze (AP) a blastickej fáze (BP).

Mechanizmus účinku

Bosutinib patrí do farmakologickej skupiny liekov známych ako inhibítory kináz. Bosutinib inhibuje abnormálnu Bcr-Abl kinázu, ktorá podporuje vznik CML. Modelové štúdie ukazujú, že bosutinib sa viaže na kinázovú oblasť Bcr-Abl. Bosutinib je aj inhibítorom kináz skupiny Src vrátane Src, Lyn a Hck. Bosutinib len minimálne inhibuje PDGF receptor ac-Kit.

Farmakokinetické parametre

Bosutinib sa po podaní jednotlivej dávky spolu s jedlom absorbuje relatívne pomaly, s mediánom času dosiahnutia najvyššej koncentrácie (T_{max}) 6 hodín. Terminálny polčas vylučovania bosutinibu sa udáva na úrovni asi 34 hodín.

Liekové riziko

Kontraindikáciami na podanie bosutinibu sú precitlivosť na liečivo a ťažké hepatálne poškodenie. Medzi najčastejšie nežiaduce účinky po podaní bosutinibu patria infekcie dýchacích ciest, trombocytopenia, neutropénia, anémia, znížená chuť do jedla, bolesť hlavy, kašeľ, hnačka, nauzea, vracanie, zvýšenie ALT a AST, kožný výsyp, bolesti kĺbov, pyrexia, opuchy a únava.

Uvedenie na trh

Bosutinib uviedla v roku 2013 na európsky trh farmaceutická spoločnosť Pfizer Ltd. pod komerčným názvom Bosulif.

Pertuzumab

Všeobecné fakty o liečive

INN: pertuzumab

Držiteľ registrácie: Roche Registration Limited

ATC zatriedenie: L01XC13 – Antineoplastiká, monoklonálne protilátky

Chemický názov: neudáva sa

CAS: 380610-27-5

Sumárny vzorec: neudáva sa

Indikácie

Pertuzumab je indikovaný na liečbu pacientov s HER2-pozitívnym metastatickým alebo lokálne rekurentným neresekovateľným karcinómom.

Mechanizmus účinku

Pertuzumab je rekombinantná humanizovaná monoklonálna protilátka, ktorá sa špecificky zameriava na extracelulárnu doménu dimerizácie (subdoménu II) proteínu receptora 2 ľudského epidermálneho rastového faktora (HER2) a tým blokuje heterodimerizáciu HER2 závislú od ligandu spolu s ďalšími členmi skupiny HER vrátane EGFR, HER3 a HER4. V dôsledku toho Perjeta inhibuje ligandom aktivovanú intracelulárnu signalizáciu prostredníctvom dvoch hlavných signálnych dráh, mitogénom aktivovanej proteín (MAP) kinázy a fosfoinozid 3-kinázy (PI3K). Inhibícia týchto signálnych dráh môže mať za následok zastavenie rastu bunky a apoptózu, v uvedenom poradí. Okrem toho Perjeta sprostredkovaná od protilátky závislú bunkou sprostredkovanú cytotoxicitu (antibody-dependent cell-mediated cytotoxicity - ADCC).

Farmakokinetické parametre

Pertuzumab vykazuje po intravenózne aplikácii lineárnu farmakokinetiku. Eliminačný polčas po podaní pertuzumabu je asi 18 dní.

Liekové riziko

Kontraindikáciou na podanie pertuzumabu je precitlivosť na liečivo. Medzi najčastejšie nežiaduce účinky pertuzumabu patria infekcie horných dýchacích ciest, nazofaryngitída, neutropénia, leukopénia a anémia, znížená chuť do jedla, insomnia, zvýšená lakrimácia, dyspnoe, kašeľ, hnačka, vracanie, stomatitída, nauzea, zápcha, dyspepsia, alopecia, vyrážky, poruchy nechťov, pruritus, suchá koža, bolesti svalov a kĺbov, bolesti, pyrexia, asténia a únava.

Uvedenie na trh

Pertuzumab uviedla v roku 2013 na európsky trh britská spoločnosť Roche Registration Limited pod komerčným názvom Perjeta.

Lixisenatid

Všeobecné fakty o liečive

INN: lixisenatide

Držiteľ registrácie: Sanofi-Aventis Groupe

ATC zatriedenie: A10BX10 – Iné antidiabetiká s výnimkou inzulínov

Chemický názov: neuvádza sa

CAS: 827033-10-3

Sumárny vzorec: $C_{215}H_{347}N_{61}O_{65}S$

Indikácie

Lixisenatid je indikovaný na liečbu diabetes mellitus 2. typu na dosiahnutie kontroly glykémie v kombinácii s perorálnymi antidiabetikami a/alebo bazálnym inzulínom, ak tieto spolu s diétou a cvičením nepostačujú na adekvátnu kontrolu glykémie.

Mechanizmus účinku

Lixisenatid je selektívny agonista receptorov GLP-1. Na GLP-1 receptor sa prirodzene viaže natívny GLP-1, endogénny inkretínový hormón, ktorý v beta-bunkách pankreasu potenciuje sekréciu inzulínu závislú od glykémie. Mechanizmus účinku lixisenatidu spočíva v špecifickej interakcii s receptormi LP-1, čo má za následok zvýšenie produkcie intracelulárneho cyklického adenosín monofosfátu (cAMP). Lixisenatid stimuluje sekréciu inzulínu pri zvýšenej hladine glykémie, ale nie pri normoglykémii, čo obmedzuje riziko hypoglykémie. Súčasne potláča sekréciu glukagónu. V prípade hypoglykémie zostáva sekrécia glukagónu zachovaná. Lixisenatid spomaľuje vyprázdňovanie žalúdka, čím znižuje postprandiálny vzostup hladiny glykémie v obeh.

Farmakokinetické parametre

Maximálne plazmatické koncentrácie lixisenatidu sa dosahujú 1 až 3,5 hodiny po subkutánom podaní dávky. Pri podávaní opakovaných dávok je terminálny polčas eliminácie približne tri hodiny.

Liekové riziko

Kontraindikáciou na použitie lixisenatidu je precitlivosť na liečivo. Medzi najčastejšie nežiaduce účinky lixisenatidu patria hypoglykémia, bolesť hlavy, nauzea, vracanie a hnačka.

Uvedenie na trh

Lixisenatid uviedla v roku 2011 na európsky trh farmaceutická spoločnosť Sanofi-Aventis Groupe pod názvom Lyxumia.

Zdroj: ADC ČÍSELNÍK, www.adcc.sk

PharmDr. Peter Stanko

Univerzitná lekárň, FaF UK v Bratislave
Ružinovská 12, 821 01 Bratislava
peter.stanko@pharminfo.sk

