Раптива



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Эфализумаб

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный иммунодепрессант. Представляет собой гуманизированные моноклональные антитела (иммуноглобулины класса IgG_1), полученные методами биотехнологии с использованием клеток яичников китайского хомячка.

Эфализумаб специфически связывается с белковыми структурами - с CD11a (субъединица молекулы LFA-1), которые экспрессируются на активированных Т-лимфоцитах. При этом эфализумаб ингибирует связывание LFA-1 с ICAM-1, молекулами межклеточной адгезии, экспрессированными на кератиноцитах и активированных клетках сосудистого эндотелия. Блокируя связывание указанных клеточных структур, эфализумаб ингибирует взаимодействие активированных Т-лимфоцитов с другими типами клеток, в частности кератиноцитами и клетками эндотелия сосудов, подавляя функциональную активность Т-хелперов, естественных киллеров, цитотоксических Т-клеток, блокирует выход лимфоцитов из сосудистого русла. Подавляя функциональные проявления активированных Т-лимфоцитов, эфализумаб воздействует на иммунологические процессы и способствует снижению выраженности симптомов и клинических проявлений псориаза.

Фармакокинетика

Фармакокинетические показатели эфализумаба имеют нелинейный характер.

Распределение

Средняя биодоступность эфализумаба составляет 30-50%.

После п/к введения в начальной дозе 0.7 мг/кг и последующих еженедельных инъекциях по 1 мг/кг C_{ss} эфализумаба в сыворотке крови достигалась через 4 нед., средняя концентрация и C_{max} составляли приблизительно 9 мкг/мл и 12 мкг/мл соответственно. Клиренс при достижении C_{ss} составлял 24 мл/кг/сут (в диапазоне от 5 до 76 мл/кг/сут).

Выведение

$T_{1/2}$ эфализумаба после введения последней дозы в условиях равновесного состояния составлял в среднем 25 сут (в диапазоне от 13 до 35 сут).

Клиренс эфализумаба в значительной степени зависит от массы тела.

Показания к применению:

Лечение псориаза средней и тяжелой степени у взрослых.

Относится к болезням:

- Псориаз

Противопоказания:

Злокачественные новообразования, тяжелые инфекционные заболевания (в т.ч. сепсис, туберкулез, гепатит B, гепатит C), повышенная чувствительность к эфализумабу.

Способ применения и дозы:

Лечение проводится под наблюдением врача, имеющего опыт применения иммуномодулирующих препаратов системного действия при псориазе.

Применяют п/к. Начальная доза составляет 700 мкг/кг массы тела, все последующие инъекции проводятся 1 раз/нед в дозе 1 мг/кг массы тела. Продолжительность первого курса лечения обычно составляет 12 недель. В случае положительного эффекта рекомендуется продолжать терапию для поддержания достигнутого уровня и дальнейшего улучшения состояния. Если через 12 недель не наблюдается терапевтического эффекта (снижение индекса PASI менее чем на 50%) применение эфализумаба следует прекратить.

Побочное действие:

Гриппоподобные симптомы: очень часто - легкие или умеренные головная боль, повышение температуры тела, озноб, тошнота, боли в мышцах (степень выраженности этих симптомов носит дозозависимый характер).

Со стороны системы кроветворения: очень часто - асимптоматический лимфоцитоз (число лимфоцитов возвращалось к исходному уровню после прекращения терапии); реже - незначительное увеличение абсолютного числа нейтрофилов и эозинофилов.

Со стороны свертывающей системы крови: редко - тромбоцитопения (менее 52 000/мкл), которая может сопровождаться экхимозами, спонтанными кровоизлияниями, кровотечениями из слизистых оболочек.

Со стороны печени: часто - повышение активности ЩФ, повышение активности АЛТ (значения этих показателей возвращались к исходным после прекращения терапии).

Аллергические реакции: часто - крапивница, кожная сыпь.

Прочие: частота развития злокачественных опухолей была приблизительно одинаковой в группах, получавших эфализумаб и в группах плацебо.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности не рекомендуется. Данные о тератогенном действии или отрицательном влиянии на репродуктивную систему отсутствуют.

Женщинам детородного возраста в период лечения рекомендуется использовать надежные методы контрацепции.

Неизвестно, выделяется ли эфализумаб с грудным молоком. Поскольку иммуноглобулины обычно проникают в грудное молоко, при необходимости применения в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Специальных исследований по изучению взаимодействия эфализумаба с другими лекарственными средствами не проводилось.

Данные по применению эфализумаба одновременно с препаратами для лечения псориаза системного действия (циклоспорином, метотрексатом), а также PUVA-терапией отсутствуют, поэтому данные комбинации

противопоказаны.

Особые указания и меры предосторожности:

Эфализумаб может снизить эффективность иммунного ответа в отношении возбудителей инфекции. Не установлено, какое влияние оказывает эфализумаб на развитие и лечение острых и/или хронических инфекционных заболеваний. Если у пациента отмечено развитие серьезного инфекционного заболевания, то эфализумаб следует отменить.

Эфализумаб не следует применять в комбинации с другой иммуносупрессивной терапией.

На фоне терапии эфализумабом возможно обострение течения псориаза или псориатического артрита. В этом случае лечение рекомендуется прекратить.

При отмене эфализумаба необходимо контролировать состояние пациента и в случае рецидива - назначить эффективное лечение.

Поскольку у лиц пожилого возраста чаще развиваются инфекционные заболевания, терапию следует проводить с особой осторожностью.

Во время проведения курса лечения эфализумабом не рекомендуется делать прививки живыми вакцинами.

Примерно у 6.3% пациентов, получавших терапию эфализумабом, определялись специфические анти-антитела к эфализумабу. Анти-антитела не оказывали какого-либо выраженного действия на фармакодинамические и фармакокинетические параметры.

Необходимо контролировать число тромбоцитов в начальной стадии терапии и затем регулярно в процессе терапии (в течение первых 3 месяцев ежемесячно, затем 1 раз в 3 месяца) и лейкоцитов (1 раз в 3 месяца). При появлении симптомов тромбоцитопении применение эфализумаба следует немедленно прекратить, определить число тромбоцитов и незамедлительно начать соответствующую симптоматическую терапию.

При появлении аллергических реакций применение эфализумаба следует немедленно прекратить.

Клинический опыт применения эфализумаба не подтвердил повышенный риск развития злокачественных новообразований, по сравнению с общей популяцией. Если у пациента во время курса лечения обнаружено новообразование, то эфализумаб следует отменить.

Клинических исследований эффективности и безопасности применения эфализумаба у пациентов с нарушениями функции почек и печени не проводилось. Лечение пациентов этой группы следует проводить с особой осторожностью. Опыт применения препарата у пациентов с почечной или печеночной недостаточностью отсутствует.

Использование в педиатрии

Данные по применению эфализумаба у пациентов младше 18 лет отсутствуют, поэтому применение в педиатрии не рекомендуется.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Влияние эфализумаба на способность к вождению автотранспорта и работе с механизмами маловероятно.

При нарушениях функции почек

Клинических исследований эффективности и безопасности применения эфализумаба у пациентов с нарушениями функции почек не проводилось. Лечение пациентов этой группы следует проводить с особой осторожностью. Опыт применения препарата у пациентов с почечной недостаточностью отсутствует.

При нарушениях функции печени

Противопоказан у пациентов с гепатитом В, гепатитом С.

Клинических исследований эффективности и безопасности применения эфализумаба у пациентов с нарушениями функции печени не проводилось. Лечение пациентов этой группы следует проводить с особой осторожностью. Опыт применения препарата у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствует.

Применение в пожилом возрасте

Поскольку у лиц пожилого возраста чаще развиваются инфекционные заболевания, терапию следует проводить с особой осторожностью.

Применение в детском возрасте

Данные по применению эфализумаба у пациентов младше 18 лет отсутствуют, поэтому применение в педиатрии не

рекомендуется.

Источник: http://drugs.thead.ru/Raptiva