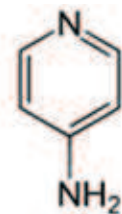


# Nové liečivá v EÚ registrované v roku 2011 (III.)

Prakt. lekár., 2012, 2(3): 115–116



## Fampiridín

### Všeobecné fakty o liečive

**INN:** Fampiridín

**Držiteľ registrácie:** Biogen Idec Ltd.

**ATC zatriedenie:** N07XX07 – Iné lieky na nervový systém

**Chemický názov:** 4-aminopyridín

**CAS:** 504-24-5

**Sumárny vzorec:** C<sub>5</sub>H<sub>6</sub>N<sub>2</sub>

### Indikácie

Fampiridín je indikovaný na zlepšenie chôdze dospelých pacientov postihnutých sklerózou multiplex spojenou s neschopnosťou samostatnej chôdze. Liečivo je zatriedené v ATC klasifikácii do skupiny N07XX07 – Iné lieky na nervový systém.

### Mechanizmus účinku

Fampiridín je blokátor draslíkového kanálu. Blokováním draslíkového kanálu fampiridín redukuje zvodový iónový prúd cez tieto kanály, predlžuje tak repolarizáciu, a tým podporuje vznik akčného potenciálu v axónoch zbavených myelínu, a tým neurologickú funkciu. Podporovaním vzniku akčného potenciálu umožňuje viacerým impulzom prechod cez centrálnu nervovú sústavu.

### Farmakokinetické parametre

Fampiridín sa podáva vo forme tabliet s predĺženým uvoľňovaním. Perorálne podaný fampiridín sa rýchlo kompletne absorbuje zo zažívacieho traktu. Tablety s predĺženým uvoľňovaním vykazujú oneskorenú absorpciu, prejavujú sa pomalším nárastom do nižšej hodnoty maximálnej koncentrácie bez účinku na rozsah absorpcie. Pri podaní spolu s jedlom plocha pod krivkou zmenší o 2 – 7 %. Terminálny polčas eliminácie fampiridínu je asi 6 hodín.

### Liekové riziko

Kontraindikáciami pre podanie fampiridínu sú záchvaty v anamnéze, pacienti so zníženou

funkciou obličiek a precitlivosť na účinnú látku. Medzi najčastejšie nežiaduce účinky, ktoré boli zaznamenané vo fáze klinického skúšania, patrili infekcie močových ciest.

### Uvedenie na trh

Fampiridín uviedla na trh farmaceutická spoločnosť Biogen Idec Ltd. pod komerčným názvom Fampyra.

### Inhibitor C1 (ľudský)

### Všeobecné fakty o liečive

**INN:** C1-inhibitor

**Držiteľ registrácie:** ViroPharma

**ATC zatriedenie:** B02AB03 – Antihemoragiká, inhibitory proteinázy

**Chemický názov:** neudáva sa

**CAS:** 80295-38-1

**Sumárny vzorec:** neudáva sa

### Indikácie

Inhibitor C1 (ľudský) sa používa na prevenciu angioedému pred zákrokom u pacientov s hereditárnym angioedémom (*hereditary angioedema* – HAE). Liečivo je zatriedené v ATC klasifikácii do skupiny B02AB03 – Antihemoragiká, inhibitory proteinázy.

### Mechanizmus účinku

Inhibitor C1 (ľudský) je inhibitor serínových proteáz alebo serpín. Funkciou serpínov je regulovať aktivitu serínových proteáz. Primárnym substrátom aktivovaného C1 enzýmu je C4. Neinhibovaný C1 spôsobuje zníženie hladín C4. C1 je najdôležitejším inhibitorom kontaktnej aktívácie a reguluje kontaktný systém a vnútornú cestu koagulácie väzbou na kalikreín a faktor XIIa a ich inaktíváciou. Aktivácia týchto ciest môže viesť bez inhibitora C1 k neregulovanej aktívácii a opuchu.

### Farmakokinetické parametre

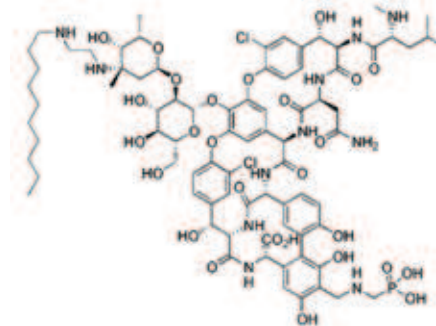
Inhibitor C1 (ľudský) sa podáva vo forme intravenózneho injekcie. Po intravenóznom podaní jednorazovej dávky sa sérová koncentrácia funkčného inhibitora C1 zdvojnásobila v priebehu 1 až 2 hodín. Priemerný eliminačný polčas funkčného inhibitora C1 bol 56 hodín pre jednorazovú dávku a 62 hodín pre dvojnásobnú dávku.

### Liekové riziko

Jedinou kontraindikáciou pre podanie inhibitora C1 je precitlivosť na liečivo. Medzi najčastejšie nežiaduce účinky, ktoré boli zaznamenané vo fáze klinického skúšania patrili lokálne kožné reakcie, napríklad vyrážky.

### Uvedenie na trh

Inhibitor C1 (ľudský) uviedla v auguste 2011 na trh farmaceutická firma ViroPharma pod komerčným názvom Cinryze. Prvé uvedenie liečiva zo skupiny inhibitorov C1 proteínu sa viaže na rok 2009, kedy nemecká farmaceutická firma CSL Behring uviedla na trh liek Berinet.



## Telavancín

### Všeobecné fakty o liečive

**INN:** Telavancín

**Držiteľ registrácie:** Astellas Pharma Europe

**ATC zatriedenie:** J01XA03 – glykopeptidové antibakteriálne látky

**Chemický názov:** neudáva sa

**CAS:** 372151-71-8

**Sumárny vzorec:** C<sub>80</sub>H<sub>106</sub>Cl<sub>2</sub>N<sub>11</sub>O<sub>27</sub>P

### Indikácie

Telavancín je indikovaný na liečbu nozokomiálnej pneumónie vyvolanej meticilín rezistentným *Staphylococcus aureus*. Liečivo je zatriedené v ATC klasifikácii do skupiny J01XA03 – glykopeptidové antibakteriálne látky.

### Mechanizmus účinku

Telavancín inhibuje biosyntézu bunkovej steny väzbou na neskoré prekurzory peptidoglykánu, vrátane lipidu II, čím zabraňuje polymerizácii prekurzorov na peptidoglykán a následnej tvorbe priečných väzieb. Telavancín sa tiež viaže na bakteriálne membrány a spôsobuje depolarizáciu

membránového potenciálu a zvýšenie permeability membrány, to má za následok inhibíciu syntézy proteínov, RNA a lipidov. Výsledkom je baktericídne pôsobenie voči G+ baktériám.

### Farmakokinetické parametre

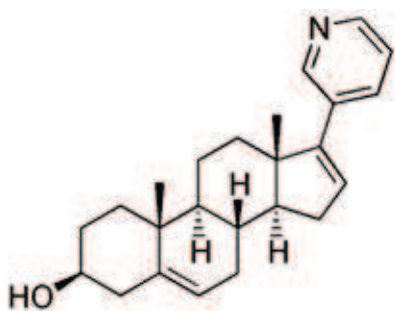
Telavancín sa podáva vo forme intravenózneho infúzie. Nesmie byť podaný ako bolusová injekcia. Polčas eliminácie telavancínu je asi 8 hodín.

### Liekové riziko

Kontraindikáciami pre podanie telavancínu sú závažné poškodenia obličiek vrátane pacientov liečených hemodialýzou a akútneho zlyhania obličiek, prípadne precitlivosť na účinnú látku. Telavancín je kontraindikovaný v tehotenstve. Medzi najčastejšie nežiaduce účinky, ktoré boli zaznamenané vo fáze klinického skúšania, patrili poruchy chuti a nevoľnosti.

### Uvedenie na trh

Telavancín uviedla v októbri 2011 na trh holandská farmaceutická spoločnosť Astellas Pharma Europe pod komerčným názvom Vibativ.



### Abiraterón acetát

#### Všeobecné fakty o liečive

**INN:** Abiraterón acetát

**Držiteľ registrácie:** Janssen Cilag International

**ATC zatriedenie:** L02BX03 – iné antagonisty hormónov a príbuzné liečivá

**Chemický názov:** (3β)-17-(pyridín-3-yl)androsta-5,16-dién-3-ol

**CAS:** 154229-19-3

**Sumárny vzorec:** C<sub>24</sub>H<sub>31</sub>NO

### Indikácie

Abiraterón acetát je indikovaný na liečbu metastazujúceho karcinómu prostaty rezistentného na kastráciu. V rámci ATC klasifikácie je liečivo zatriedené do skupiny L02BX03 – iné antagonisty hormónov a príbuzné liečivá.

### Mechanizmus účinku

Abiraterón acetát je inhibítorom biosyntézy androgénov. Selektívne inhibuje enzým 17α-hydroxylázu/C17,20-lyázu (CYP17). Tento enzým sa nachádza a je potrebný na biosyntézu androgénu v nádorovom tkanive semenníkov, nadobličiek a prostaty. CYP17 katalyzuje premenu pregnenolónu a progesterónu na prekurzory testosterónu, DHEA a androstendionu (v danom poradí) prostredníctvom 17α-hydroxylácie a štiepenia väzby C17,20. Inhibícia CYP17 má za následok taktiež zvýšenú tvorbu mineralokortikoidov v nadobličkách. Karcinóm prostaty citlivý na androgény odpovedá na liečbu, ktorá znižuje hladinu androgénov.

### Farmakokinetické parametre

Abiraterón acetát sa podáva vo forme tabliet. Po perorálnom podaní sa maximálna plazmatická koncentrácia dosahuje asi po 2 hodinách (T<sub>max</sub>). Priemerný biologický polčas abiraterónu v plazme je približne 15 hodín.

### Liekové riziko

Kontraindikáciami pre podanie abiraterónu acetátu je existujúca alebo potenciálna gravidita u žien a precitlivosť na účinnú látku. Medzi najčastejšie nežiaduce účinky, ktoré boli zaznamenané vo fáze klinického skúšania, patrili infek-

cie močových ciest, hypokaliémia, hypertenzia a periférne edémy.

### Uvedenie na trh

Abiraterón acetát uviedla v októbri 2011 na trh farmaceutická firma Janssen Cilag International pod komerčným názvom Zytiga.

**Zdroj:** ADC ČÍSELNÍK, www.adcc.sk



#### PharmDr. Peter Stanko

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



## Jindřich Olšovský:

### DIABETES MELLITUS 2. TYPU

Diabetes mellitus je chronickým onemocněním, které má za následek vysokou morbiditu, invaliditu a mortalitu v celém světě. Kromě vysokého počtu nositelů tohoto onemocnění je středem pozornosti moderní medicíny i rozvoj chronických komplikací, které zhoršují kvalitu života takto nemocných, ale často zkracují i jeho trvání. Diabetes mellitus 2. typu se stal skutečnou pandemií, která přináší velké utrpení milionům nemocných, ale představuje také obrovskou ekonomickou zátěž pro všechny vyspělé státy světa. Medicínský a farmaceutický výzkum v reakci na tento stav přinesl v posledních dvou desetiletích velký počet nových léků, a to léků nových principiálně, tedy nových lékových skupin. Knížka našeho předního diabetologa přináší moderní a srozumitelný přehled veškeré současně dostupné terapie diabetu, včetně terapie jeho nejzávažnějších komplikací.

Maxdorf 2012, edice Farmakoterapie pro praxi, ISBN 978-80-7345-277-3, 86 s.

Ojednávejte: písomne – Maxdorf, Na Šejdru 247, 142 02 Praha, telefonicky – 004202 4101 1681, e-maliom – knihy@maxdorf.cz



www.maxdorf.cz