Тофацитиниб
(Tofacitinibum)

- Фармакологическая группа вещества Тофацитиниб

- Иммунодепрессанты

Характеристика вещества Тофацитиниб

- Селективный ингибитор семейства Янус киназ (JAK), обладающий также высокой селективностью в отношении других киназ генома человека.

Механизм действия

- Тофацитиниб ингибирует JAK1, -2, -3 и в меньшей степени — тирозинкиназу 2. В тех клетках, где JAK передают сигнал парами, тофацитиниб предпочтительно ингибирует передачу сигнала гетеродимерных рецепторов, связанных с JAK3 и/или JAK1, обладая функциональной селективностью в отношении рецепторов, которые передают сигналы через пары JAK2.

Фарм.эффекты

- Лечение тофацитинибом сопровождается дозозависимым снижением циркулирующих натуральных киллеров CD16/56+. Расчетное максимальное снижение достигается по прошествии около 8–10 нед после начала терапии.

После лечения тофацитинибом пациентов с ревматоидным артритом отмечалось быстрое снижение сывороточного С-реактивного белка (С-РБ), что сохранялось на протяжении всего периода лечения.

Фармакокинетика

- Профиль фармакокинетики тофацитиниба характеризуется быстрым всасыванием (Cmax достигается в течение 0,5–1 ч), быстрым выведением (T1/2 около 3 ч)

Показания к применению

- Лечение взрослых пациентов с умеренным или тяжелым активным ревматоидным артритом с неадекватным ответом на один или несколько базисных противовоспалительных препаратов (БПВП).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к тофацитинибу, тяжелое нарушение функции печени, инфицирование вирусами гепатита B и/или C (наличие серологических маркеров HBV- и HCV-инфекции), Cl креатинина <40 мл/мин, одновременное применение живых вакцин, одновременное применение с биологическими препаратами (такими как ингибиторы ФНО, антагонисты ИЛ-1R, ИЛ-6R, моноклональные анти-CD20-антитела, селективные костимулирующие модуляторы), а также сильными иммунодепрессантами (такими как азатиоприн, циклоспорин и такролимус

Побочные действия вещества Тофацитиниб

- Инфекционные и паразитарные заболевания: очень часто — назофарингит; часто — пневмония, опоясывающий герпес, бронхит, грипп, синусит, инфекции мочевого тракта, фарингит; нечасто — сепсис, бактериальная пневмония, пневмококковая пневмония, пиелонефрит, воспаление подкожной жировой клетчатки, вирусный гастроэнтерит, вирусная инфекция, простой герпес; редко — туберкулез ЦНС, энцефалит, некротизирующий фасциит, криптококковый менингит, диссеминированный туберкулез, уросепсис, пневмония, вызванная Pneumocystis jiroveci, стафилококковая бактериемия, туберкулез, бактериальный артрит, атипичная инфекция, вызванная микобактериями, инфекция, вызванная комплексом Mycobacterium avium, ЦМВ-инфекция, бактериемия. Среди пациентов, принимавших тофацитиниб, частота серьезных инфекций была выше у лиц старше 65 лет, чем у лиц младше 65 лет.

- *Со стороны ССС:* часто — повышение АД.
- *Со стороны пищеварительной системы:* часто — боль в животе, рвота, гастрит, диарея, тошнота, диспепсия.
- *Со стороны обмена веществ:* часто — гиперлипидемия, дислипидемия; нечасто — дегидратация.
- *Со стороны нервной системы:* часто — головная боль; нечасто — парестезия.
- *Психические расстройства:* часто — бессонница.
- *Со стороны скелетно-мышечной системы и соединительной ткани:* часто — боль в мышцах и костях, артралгии; нечасто — тендинит, отек суставов, мышечное напряжение.
- *Со стороны крови и лимфатической системы:* часто — лейкопения, анемия; нечасто — нейтропения, лимфопения.

Исследования

ВЫВОДЫ

1. Применение тофацитиниба во второй и третьей линии фармакотерапии РА как в виде монотерапии, так и в комбинации со стандартными базисными препаратами позволяет достоверно улучшить результаты лечения больных, резистентных к метотрексату, лефлуномиду либо их комбинации.
2. Высокий терапевтический эффект тофацитиниба, в т. ч. его комбинации с метотрексатом или лефлуномидом, у пациентов РА дает основание для более широкого использования этого препарата у пациентов с неадекватным ответом на стандартную терапию.

WRUAQAR16081

РЕВМАТОЛОГИЯ

ТОФАЦИТИНИБ В БАЗИСНОЙ ТЕРАПИИ РЕВМАТОИДНОГО АРТРИТА:

СОБСТВЕННЫЙ КЛИНИЧЕСКИЙ ОПЫТ

В статье проведен анализ эффективности тофацитиниба у больных с резистентным ревматоидным артритом. Тофацитиниб был применен у 15 пациентов с активным РА в развернутой стадии с неэффективностью предшествующей терапии базисными противоревматическими препаратами, в т. ч. при их применении в комбинации. Результат оценивали через 3 и 6 мес. Снижение активности заболевания, соответствующее ACR 20, наблюдалось у 93,33% пациентов уже через 3 мес. терапии, что свидетельствует о высокой эффективности препарата для лечения рефрактерного РА. Было также отмечено снижение сывороточного уровня РФ. У 7 (63%) из 11 серопозитивных больных произошло значимое снижение РФ, причем более чем у трети серопозитивных больных наблюдалось 50%-ное снижение уровня РФ, а у 2 (18%) пациентов была достигнута отрицательная сероконверсия.

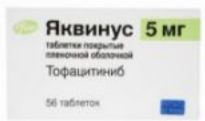
Ключевые слова: *ревматоидный артрит, тофацитиниб, анализ эффективности лечения, генно-инженерные биологические препараты.*

A.R. BABAEVA [1], MD, Prof., E.V. KALININA [1], PhD in Medicine, D.E. KARATEEV [2], MD
[1] Volgograd State Medical University, Ministry of Health of Russia,intermediate course of internal medicine, Volgograd,
[2] Nasonova Research Institute of Rheumatology, Moscow

TOFACITINIB IN BASELINE THERAPY OF RHEUMATOID ARTHRITIS: OWN CLINICAL EXPERIENCE

This article presents the clinical data regarding the use of the novel drug tofacitinib (TOFA) in the treatment of rheumatoid arthritis, resistant to conventional disease-modifying therapy. It was shown, that TOFA in total dose 10 mg t/d has a high efficacy and safety. After 6 month course of TOFA treatment as monotherapy in 7 pts and as combination with methotrexate or leflunomide in 8 pts significant decrease of RA activity according to DAS28, CDAI, SDAI and RAPID scores was revealed. Positive dynamics of clinical data was associated with decreased levels of immune markers: C-reactive protein and rheumatoid factor, two persons became seronegative. No one serious side-effect was registered. On the basis of clinical data we can recommend using TOFA in RA in cases of insufficient efficacy of conventional DMARDs or if they are contraindicated.

Keywords: *rheumatoid arthritis, tofacitinib, treatment effectiveness analysis, genetically engineered biological agents.*



Яквинус 5мг 56 шт. таблетки покрытые пленочной оболочкой

Пфайзер (Германия)
Препарат: Яквинус

Цена от
49 000 руб.

— 1 + Купить