

- **Etanercept (Enbrel*, PFIZER) Ετανερσέπτη**



Είναι μια πρωτεΐνη που συμπεριφέρεται ως διαλυτός υποδοχέας του TNF-α (**anti-TNF**). Πιο συγκεκριμένα, αποτελεί σύμπλοκο μιας διαλυτής διμερούς μορφής του εξωκυττάριου τμήματος του p75 υποδοχέα του TNF-α ενωμένη με το Fc τμήμα της ανθρώπινης ανοσοσφαιρίνης G1 (IgG1). Δρα μέσω σύνδεσης με τον TNF-α που κυκλοφορεί και, με αυτόν τον τρόπο, τον εμποδίζει από το να συνδεθεί με κυτταρικούς υποδοχείς του. Δε δρα σχηματίζοντας εξουδετερωτικά αντισώματα ή μεσολαβώντας στη λύση των κυττάρων.

Διατίθεται σε μιας χρήσης προγεμισμένη σύριγγα των 25mg ή 50 mg (50 mg/ml) και χορηγείται με υποδόρια ένεση. Απορροφάται αργά και φτάνει τη μέγιστη συγκέντρωση στο πλάσμα σε 48-60 (ή σε 69 ± 34) ώρες με χρόνο ημίσειας ζωής 70-100 ώρες. Η βιοδιαθεσιμότητα ανέρχεται σε 58-76% σε υγιή άτομα μετά από υποδόρια έγχυση. Η μέγιστη συγκέντρωση στο πλάσμα είναι 1.1 ± 0.6 μg/mL, ενώ η κάθαρση γίνεται με ρυθμό 72 ± 5 ml/h.

Η δόση για ενήλικα είναι 50 mg εβδομαδιαίως *με ή χωρίς μεθοτρεξάτη*.

Ανεπιθύμητες δράσεις: κεφαλαλγία, αντιδράσεις από το σημείο της ένεσης, λοιμώξεις ανώτερου ανοσοποιητικού σε δόση 25 mg (αλλά όχι σε δόση 10 mg), δερματικές ανεπιθύμητες ενέργειες, μεγαλύτερος κίνδυνος για κακοήθειες σε σχέση με placebo αλλά όχι στατιστικά σημαντικός, πιθανός κίνδυνος για εμφάνιση και επιδείνωση απομυελινωτικών ασθενειών, αιματολογικές διαταραχές, σύνδρομο όμοιο με λύκο.

Αντενδείξεις: Ισχύουν οι γενικές αντενδείξεις για τους αναστολείς του TNF-α. Πρέπει να γίνεται έλεγχος για λανθάνουσα φυματίωση, έλεγχος για ηπατίτιδα-B.

Ενδείξεις: χρησιμοποιείται σε ενήλικες με ρευματοειδή αρθρίτιδα μέτριου και σοβαρού βαθμού που δεν έχουν ανταποκριθεί κατάλληλα σε θεραπεία με DMARDs. Επίσης, ως θεραπεία πρώτης γραμμής σε ενεργή σοβαρή ρευματοειδή αρθρίτιδα χωρίς

προηγούμενη χρήση μεθοτρεξάτης. Ακόμη, έχει εγκριθεί για την ιδιοπαθή νεανική αρθρίτιδα, την ψωριασική αρθρίτιδα, την κατά πλάκας ψωρίαση και την αγκυλοποιητική σπονδυλίτιδα.