

- **Tocilizumab (Actemra\*/RoActemra\*, ROCHE, Τοσιλιζουμάμπη)**



Αποτελεί αποκλειστή των υποδοχέων της IL-6. Είναι ένα εξανθρωπισμένο IgG1 μονοκλωνικό αντίσωμα, το οποίο συνδέεται με υψηλή συγγένεια τόσο με τους διαλυτούς όσο και τους συνδεδεμένους στη μεμβράνη των κυττάρων υποδοχείς της IL-6, εμποδίζοντας τη σύνδεσή της με αυτούς.

Υπάρχει σε φιαλίδια 80mg/4ml, 200 mg/10ml, 400mg/20 ml τα οποία χορηγούνται ενδομυϊκά σε διάρκεια 60 λεπτών. Μεταβολίζεται από το δικτυοενδοθηλιακό σύστημα, όπως και η ενδογενής IgG. Ο χρόνος ημίσειας ζωής εξαρτάται από τη συγκέντρωση: 11 ημέρες για τη δόση των 4 mg/kg και 13 ημέρες για τη δόση 8 mg/kg. Η μέγιστη συγκέντρωση αυξάνει ανάλογα με την αύξηση της δόσης. Μετά την ενδοφλέβια χορήγηση απομακρύνεται από την κυκλοφορία με κινητική δύο ταχυτήτων, ενώ σε μεγαλύτερη συγκέντρωση η απομάκρυνση είναι κυρίως γραμμική και σε χαμηλή συγκέντρωση μη γραμμική.

Η δόση για έναν ενήλικα διαμορφώνεται στα 4 mg/kg κάθε 4 εβδομάδες με αύξηση σε 8 mg/kg κάθε 4 εβδομάδες βασισμένη στην κλινική απάντηση.

Ανεπιθύμητες δράσεις, που έχουν περιγραφεί είναι: σοβαρές μολύνσεις, διάτρηση εντέρου (κυρίως ως αποτέλεσμα εκκολπωματίτιδας), αντιδράσεις από την έγχυση (υπέρταση, πονοκέφαλος, δερματικές αντιδράσεις) και λιγότερο συχνά αντιδράσεις υπερευαισθησίας. Προκαλεί επιτάχυνση του μεταβολισμού των φαρμάκων που μεταβολίζονται με τα ένζυμα του κυτοχρώματος-P<sub>450</sub> και μειώνει τη συγκέντρωση της κυκλοσπορίνης σε συγχορήγηση.

Αντενδείξεις: δε θα πρέπει να χορηγείται με ενδοφλέβια ταχεία χορήγηση, με τεχνική bolus ή μαζί με άλλα φάρμακα από την ίδια ενδοφλέβια γραμμή. Επίσης, δεν προτείνεται για ασθενείς με ενεργό ηπατική νόσο ή με ηπατική βλάβη. Ακόμη, ανεξάρτητα από το βάρος του ασθενή, **η μέγιστη δόση είναι 800 mg** σε κάθε ενδοφλέβια έγχυση. Τέλος, δεν προτείνεται κατά τη διάρκεια του θηλασμού.

Ενδείξεις: χρησιμοποιείται στη ρευματοειδή αρθρίτιδα, όταν τουλάχιστον μία θεραπεία με αναστολείς του TNF έχει αποτύχει. *Μπορεί να συγχορηγηθεί με μεθοτρεξάτη ή άλλα DMARDs*. Επίσης χρησιμοποιείται για τη νεανική ιδιοπαθή αρθρίτιδα.

