

BIVALIRUDIN

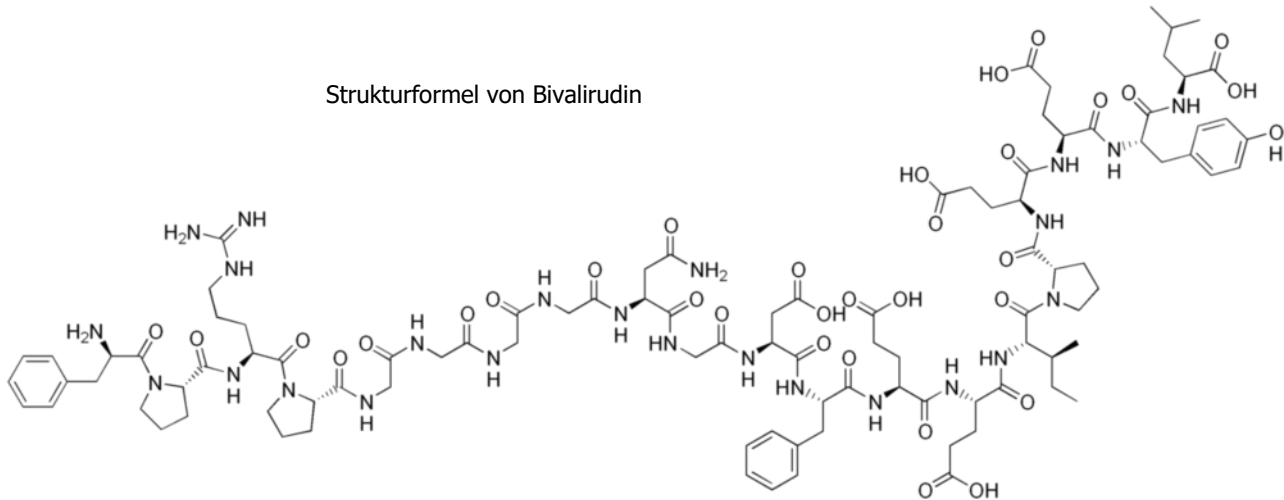
Cas No: 128270-60-0

Strukturformel: C₉₈H₁₃₈N₂₄O₃₃

Molekulargewicht: 2180.29 g/ mol (free base basis)

Synonym: D-Phenylalanyl-L-prolyl-L-arginyl-L-prolyl-glycyl-glycyl-glycyl-glycyl-L-aspariginyl-glycyl-L-α-aspartyl-L-phenylalanyl-L-α-glutamyl-L-α-glutamyl-L-isoleucyl-L-prolyl-L-α-glutamyl-L-α-glutamyl-L-tyrosyl-L-leucine

Strukturformel von Bivalirudin



Bivalirudin ist ein Antikoagulans. Das Hirudin-Analogon ist ein direkter Thrombin-Inhibitor. Bivalirudin wird angewendet, um Blutgerinnsel bei Erwachsenen zu verhindern. Und zwar bei solchen Patienten, die sich einer perkutanen Koronarintervention (PCI) unterziehen. Bei diesem nichtchirurgischen Verfahren werden die Blutgefäße, die den Herzmuskel versorgen, von einem Verschluss befreit. Die Anwendung schließt Patienten mit Myokardinfarkt (Herzinfarkt) mit „ST-Hebung“ (STEMI, einem anomalen Messwert beim Elektrokardiogramm bzw. EKG) ein. Bivalirudin wird darüber hinaus bei Erwachsenen mit instabiler Angina (Schmerzen unterschiedlicher Stärke im Brustkorb) oder Myokardinfarkt ohne ST-Hebung (NSTEMI) angewendet, die sich einer Behandlung wie einer PCI oder einer Bypassoperation unterziehen müssen oder andere Arzneimittel einnehmen. Bivalirudin wird zusammen mit Aspirin und Clopidogrel angewendet.

Mechanism of action

Bivalirudin directly inhibits thrombin by specifically binding both to the catalytic site and to the anion-binding exosite of circulating and clot-bound thrombin. Thrombin is a serine proteinase that plays a central role in the thrombotic process. It cleaves fibrinogen into fibrin monomers, activates Factor V, VIII, and XIII, allowing fibrin to develop a covalently cross-linked framework that stabilizes the thrombus. Thrombin also promotes further thrombin generation, and activates platelets, stimulating aggregation and granule release. The binding of bivalirudin to thrombin is reversible as thrombin slowly cleaves the bivalirudin-Arg3-Pro4 bond, resulting in recovery of thrombin active site functions.

References

Marco Valgimigli et. al, New England Journal of Medicine, 373(11), 997-1009 (2015), Bivalirudin or Unfractionated Heparin in Acute Coronary Syndromes.

Gregg W Stone et. al, Journal of the American College of Cardiology, 65(1), 27-38 (2015), Bivalirudin versus heparin with or without glycoprotein IIb/IIIa inhibitors in patients with STEMI undergoing primary percutaneous coronary intervention: pooled patient-level analysis from the HORIZONS-AMI and EUROMAX trials.

Anthony A Bavry et. al, PLoS ONE, 10(5), e0127832 (2015), Critical Appraisal of Bivalirudin versus Heparin for Percutaneous Coronary Intervention: A Meta-Analysis of Randomized Trials.

Gregg W. Stone et al., New England Journal of Medicine. Band 358, Nr. 21, 2008, S. 2218–2230, Bivalirudin during Primary PCI in Acute Myocardial Infarction.

Genosphere Biotechnologies

21 place de la République

F-75003 Paris

Internet: www.biomodul.de

E-mail: info@genosphere-biotech.de

