Бутират, 11С



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Раствор для в/в введения прозрачный, бесцветный.

	1 мл
углерод-11	300-1600 МБк

Вспомогательные вещества: натрия гидрокарбонат - 13 мг, вода д/и до 1 мл.

750 - 4000 МБк - флаконы (1) - контейнеры транспортные для радиоактивных веществ.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

При внутривенном введении препарат Бутират,^{11}С быстро выводится из крови. Максимальный уровень захвата препарата в органах наблюдается на второй минуте и сохраняется еще не менее 20 мни, что достаточно для проведения позитронной эмиссионной томографии. Препарат поступает и распределяется в органах пропорционально уровню перфузии и метаболической активности белков-транспортеров. В клеточных митохондриях происходит β-окисление жирной кислоты с образованием ^{11}С-Ацетил-КоА. В условиях достаточной оксигенации ^{11}С-Ацетил-КоА метаболизируется в цикле Кребса в диоксид углерода, углерод-11 и воду. В условиях гипоксии образуются преимущественно меченые фосфолипиды и триглицериды. Фосфолипиды и триглицериды задерживаются в клетке, причем в условиях гипоксии доля образования фосфолипидов и триглицеридов, по сравнению с диоксидом углерода, возрастает.

С момента введения РФП Бутират,^{11}С наблюдается постепенное выведение ра дионуклидной метки через легкие в виде диоксида углерода, углерод-11. Почками радионуклидная метка не выводится.

Бутират,^{11}С является неспецифическим туморотропным радиофармпрепаратом (РФП). По своим диагностическим свойствам РФП пригоден для проведения позитронной эмиссионной томографии с целью диагностики опухолей.

Наиболее информативно исследование злокачественных и гиперваскулярных доброкачественных опухолей головного мозга, так как в коре головного мозга препарат не накапливается, что не препятствует визуализации новообразований. Следует также отмстить возможность визуализации рака предстательной железы, так при внутривенном введении данного препарата радионуклидная метка в мочевой пузырь не поступает.

РФП Бутират,^{11}С является также кардиотропным средством и пригоден для исследования метаболизма жирных кислот в миокарде. В норме при внутривенном введении Бутират,^{11}С равномерно распределяется во всех отделах левого желудочка миокарда пропорционально миокардиальной перфузии. В последующие 30 минут происходит постепенное равномерное выведение раднонуклидной метки из миокарда по мере метаболизации препарата, при этом наблюдается повышенное накопление углерода-11 в легких и выдыхаемом воздухе. При значимом снижении миокардиального кровотока, приводящем к гипоксии, уровень захвата и β-оксидация жирных кислот уменьшаются, в результате чего радионуклидная метка задерживается в миоцитах в виде меченых фосфолипидов и

триглицеридов. В участках постинфарктного кардиосклероза наблюдается стойкая гипофиксация РФП, что свидетельствует о гипоперфузии и отсутствии метаболизма.

Фармакокинетика

После внутривенного введения РФП Бутират,^{11}С быстро покидает кровяное руста и уже через 1 мин содержание его в крови не превышает 4-5 % от введенного. Током крови препарат доставляется в ткани, где включается в обменные процессы соответственно уровню их перфузии. Максимальный уровень захвата в органах и тканях наблюдается на 1 минуте. РФП накапливается в повышенных количествах в почках (0,12 г%), печени (0,1 г%), селезенке (0,06 г%), миокарде (0,03 г%), поджелудочной железе (0,03 г%). В остальных органах, включая головной мозг, легкие, мышцы, скелет к кожу накопление препарата фоновое. В печени, селезенке и железах метаболизация препарата замедлена. В тоже время из миокарда и почек в норме наблюдается быстрое выведение радионуклидной метки. С момента внутривенного введения РФП отмечается постепенное выведение радионуклидной метки через легкие в виде диоксида углерода, углерод-11.

Площадь под кривой "концентрация/время" (AUC) накопления и выведения РФП Бутират,^{11}С для сердечной мышцы биэкспоненциалына и характеризуется фазой быстрого накопления РФП в миокарде, за которой следует фаза быстрой элиминации радионуклидной метки (отражает процесс β-окисления жирной кислоты), и фаза медленной элиминации раднонуклидной метки (отражает процесс образования меченых фосфолипидов и триглицеридов). Время достижения максимальной концентрации ($ТС_{max}$) препарата в здоровом миокарде - 1-2 минуты, период полувыведения ($Т_{1/2}$) - 20-22 мин. В норме через 30 минут после введения РФП 60-80 % радионуклидной метки выводится из миокарда в легкие в виде диоксида углерода-11. В условиях гипоксии сердечной мышцы наблюдается замедление скорости накопления и выведения радионуклидной метки из миокарда.

$ТС_{max}$) для Бутирата,^{11}С в опухолевых клетках - 2-6 мин. Отношение опухоль/нормальная ткань, достаточное для визуализации злокачественных и гиперваскуляр ных доброкачественных опухолей, сохраняется еще в течение 20 минут.

Показания к применению:

В качестве диагностического средства для позитронной эмиссионной томографии (ПЭТ). Основными показаниями для проведения исследования являются:

в онкологии:

— диагностика и дифференциальная диагностика злокачественных и доброкачественных новообразований;

— контроль эффективности лечения злокачественных новообразований, в том числе при выявлении продолженного роста злокачественных опухолей в послеоперационной зоне.

в кардиологии:

— оценка жизнеспособности дисфункционирующего миокарда, в том числе у больных с полной блокадой левой ножки пучка Гиса;

— диагностика ишемической болезни сердца (ИБС), в частности определение степени гипоксии сердечной мышцы;

— оценка эффективности проводимого лечения ИБС.

Относится к болезням:

- Кардит
- Миокардит
- Опухоли

Противопоказания:

— при беременности;

— в период лактации;

— для исследования у детей, так как клинические испытания проводились только у взрослых.

Возможны реакции гиперчувствительности.

Способ применения и дозы:

Препарат в виде стерильного раствора вводится больным внутривенно струйно. Перед использованием во флакон с РФП Бутират,^{11}С добавляют 10% раствор плацентарного альбумина в соотношении 1:1 к объему РФП. Смесь фильтруют через стерилизующий фильтр с величиной пор 0, 22 мкм. Готовый стерильный раствор должен быть прозрачным. В случае наличия у больного в анамнезе аллергической реакции на белок РФП Бутират,^{11}С может вводиться без альбумина.

Динамические ПЭТ-исследования больных оптимально начинать сразу после инъекции РФП Бутират,^{11}С и проводить в динамическом режиме в течение 30 минут. Специальной подготовки онкологических пациентов не требуется. Исследование кардиологических больных проводят натощак (последний прием пищи - вечерний).

Диагностическая доза препарата для проведения исследования в динамическом режиме составляет 200 МБк на 1 м^2 поверхности тела пациента. Площадь поверхности тела определяется по номограмме на основании роста и массы тела пациента. Как правило, используют от 250 до 400 МБк препарата на одно обследование, который вводят внутривенно струйно в объеме от 0,5 до 2,5 мл.

Эффективная доза

Дозовые коэффициенты для расчета эффективных доз облучения пациентов при использовании препарата РФП Бутират,^{11}С

Соединение	Дозовые коэффициенты, мЗв/МБк
	Взрослые
Бутират,^{11}С	0,0035

Дозопыи коэффициент при внутривенном введении Бутирата,^{11}С у взрослых составляет 3.5×10^{-3} мЗп/МПк. При введении диагностической дозы препарата (от 250 до 400МБк) эффективная доза составляет от 0.87 до 1.4 мЗв.

Побочное действие:

При использовании препарата в соответствии с инструкцией и в рекомендованных дозах побочных действий не отмечалось.

Передозировка:

Передозировка препарата маловероятна в связи с тщательным контролем вводимой радиоактивности в условиях специализированного стационара.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Данные по лекарственному взаимодействию отсутствуют.

Особые указания и меры предосторожности:

Работа с препаратом проводится в соответствии с "Основными санитарными правилами обеспечения радиационной безопасности" (ОСПОРБ-99) и Методическими указаниями "Гигиенические требования по обеспечению радиационной безопасности при проведении радионуклидной диагностики с помощью радиофармпрепаратов". (МУ-2.6.1.1892-04).

Применение в детском возрасте

Противопоказан для исследования у детей, так как клинические испытания проводились только у взрослых.

Условия хранения:

Препарат хранят в соответствии с требованиями «Основных санитарных правил обеспечения радиационной безопасности (ОСПОРБ-99). Срок годности - 40 мин с даты и времени изготовления. Не использовать по истечении срока годности.

Источник: http://drugs.thead.ru/Butirat_11C