Лантокс



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ботулинический нейротоксин типа А

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Миорелаксант. Молекула активного вещества состоит из связанных дисульфидным мостиком тяжелой (с молекулярной массой 100 000 дальтон) и легкой (с молекулярной массой 50 000 дальтон) цепей. Тяжелая цепь имеет высокое сродство к связыванию со специфическими рецепторами, расположенными на поверхности нейронов-мишеней. Легкая цепь обладает Zn^{2+}-зависимой протеазной активностью, специфичной по отношению к цитоплазматическим участкам синаптосомальносвязанного протеина, имеющего молекулярную массу 25 000 дальтон (SNAP-25) и участвующего в процессах экзоцитоза. Первый этап действия ботулинического токсина типа А - специфическое связывание молекулы с пресинаптической мембраной, этот процесс занимает 30 мин. Второй этап - интернализация связанного токсина в цитозоль посредством эндоцитоза. После интернализации легкая цепь действует как Zn^{2+}-зависимая протеаза цитозоля, избирательно расщепляя SNAP-25, что на третьем этапе приводит к блокаде высвобождения ацетилхолина из пресинаптических терминалей холинергических нейронов. Конечным эффектом этого процесса является стойкая хемоденервация.

При в/м введении ботулинического токсина типа А развиваются 2 эффекта: прямое ингибирование экстрафузальных мышечных волокон посредством ингибирования альфа-мотонейронов на уровне нервно-мышечного синапса и ингибирование активности мышечных веретен посредством торможения гамма-мотонейронного холинергического синапса на интрафузальном волокне. Уменьшение гамма-активности ведет к расслаблению интрафузальных волокон мышечного веретена и снижает активность 1а-афферентов. Это приводит к снижению активности мышечных рецепторов растяжения, а также - эфферентной активности альфа- и гамма-мотонейронов. Клиническими проявлениями являются выраженное расслабление мышц в месте инъекции и значительное уменьшение боли в них. Наряду с процессом денервации в этих мышцах протекает процесс реиннервации путем появления боковых отростков нервных терминалей, что приводит к восстановлению мышечных сокращений через 4-6 мес после инъекции.

При внутрикожной инъекции в области локализации экзокринных потовых желез (подмышечные впадины, ладони, стопы) развивается блокада постганглионарных симпатических нервов и прекращается гипергидроз на 6-8 мес.

При локальном введении в терапевтических дозах активное вещество не проникает через ГЭБ и не вызывает существенных системных эффектов. По-видимому, имеются минимальный пресинаптический захват и обратный аксональный транспорт из места его введения.

Антитела к ботулиническому токсину типа А образуются у 1-5% пациентов после повторных инъекций. Образованию антител способствуют введение в высоких дозах (более 250 ЕД), бустерные инъекции (малыми дозами через короткие промежутки времени). В случае образования антител к ботулиническому токсину типа А применяют другие серологические типы (B, F).

Фармакокинетика

Гемагглютинин-комплекс ботулинического токсина типа А в течение некоторого времени концентрируется в месте его в/м введения, прежде чем попадает в системный кровоток. В дальнейшем активное вещество очень быстро метаболизируется с образованием более простых молекулярных структур.

Выводится в виде метаболитов преимущественно почками.

Показания к применению:

Блефароспазм, гемифациальный спазм, паралитическое косоглазие, спастическая кривошея, локальный мышечный спазм у взрослых и детей старше 2 лет (в т.ч. детский церебральный паралич и спастичность).

Относится к болезням:

- Детский церебральный паралич
- Косоглазие
- Кривошея
- Мышечный спазм
- Паралич
- Спазмы

Противопоказания:

Миастения, миастенические и миастеноподобные синдромы (в т.ч. синдром Ламберта-Итона), воспалительный процесс в месте инъекции, беременность, период лактации, повышенная чувствительность к ботулиническому токсину типа А.

Способ применения и дозы:

Дозы и точки для инъекций определяются индивидуально для каждого пациента в соответствии с характером, выраженностью и локализацией мышечной гиперактивности. В ряде случаев для более точной локализации инъецируемых мышц применяется ЭМГ-контроль.

Средние суммарные дозы при инъекции в мышцы лица составляют 25-100 ЕД, в мышцы шеи - 100-200 ЕД, в мышцы конечностей - 50-300 ЕД. Интервал между повторными инъекциями должен составлять не менее 2 мес.

Максимальная суммарная доза на 1 процедуру у взрослых составляет 400 ЕД, на 1 процедуру у детей старше 2 лет - 12 ЕД/кг массы тела (не более 300 ЕД). *Токсическая доза* составляет 38-42 ЕД/кг массы тела.

Побочное действие:

Местные реакции: 2-5% случаев - микрогематомы (до 7 дней), боль в месте инъекций (до 1 суток).

Системные реакции: возникают при применении в высокой дозе (более 200 ЕД) - незначительная общая слабость в течение 1 недели.

Реакции, связанные с распространением на мышечные группы, расположенные вблизи места инъекции зависят от области введения ботулинического токсина типа А. При лечении блефароспазма, гемифациального спазма - птоз (5-10%), слезотечение (0.5-1%); редко - экстропион, кератит, диплопия, энтропион, экхимозы. При инъекции в обе кивательные мышцы - дисфагия (2-5%). Как правило, указанные побочные эффекты не требуют дополнительной терапии и регрессируют в пределах 1 мес после инъекции.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Действие ботулинического токсина типа А усиливается при одновременном применении антибиотиков группы аминогликозидов, эритромицина, тетрациклина, линкомицина, полимиксинов, средств, уменьшающих нервно-мышечную передачу (в т.ч. кураreподобных миорелаксантов).

Особые указания и меры предосторожности:

Инъекции ботулинического токсина типа А должен проводить высококвалифицированный врач, имеющий специальную подготовку и разрешение от фирмы-производителя.

Осложнения после инъекции исключительно редки и могут наступить при травме иглой жизненно важных структур (нервов, сосудов, трахеи) в случае неквалифицированного выполнения процедуры. Осложнений в виде анафилаксии не описано, тем не менее при проведении инъекции необходимо иметь средства для неотложного купирования анафилактических реакций.

В настоящее время доказана эффективность ботулинического токсина типа А у пациентов с миофасциальными синдромами, головными болями напряжения, контрактурами мимических мышц, тризмом, бруксизмом, гиперкинетическими морщинами лица, ахалазией кардии, спазмом сфинктеров прямой кишки и мочевого пузыря, локальным гипергидрозом.

Специфический ботулинический антитоксин эффективен в течение 30 мин после инъекции ботулинического токсина.

После инъекции шприцы и иглу следует уничтожить с помощью методов, предусмотренных для уничтожения биологических отходов.

Не рекомендуют для применения у детей в возрасте до 2 лет.

Применение в детском возрасте

Не рекомендуют для применения у детей в возрасте до 2 лет.

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