Релатокс



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Лиофилизат для приготовления раствора для в/м введения	**1 фл.**
ботулинический токсин типа А	100 ЕД

100 ЕД - флаконы (1) - контейнеры полимерные (1) или банки полимерные (1) - пачки картонные.

Лиофилизат для приготовления раствора для в/м введения	**1 фл.**
ботулинический токсин типа А	50 ЕД

50 ЕД - флаконы (1) - контейнеры полимерные (1) или банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Молекула ботулинического токсина типа А состоит из связанных дисульфидным мостиком тяжелой (с молекулярной массой 100000 дальтон) и легкой (с молекулярной массой 50000 дальтон) цепей. Тяжелая цепь имеет высокое сродство связывания 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 25000 дальтон (SNAP-25) и участвующего в процессах экзоцитоза. Первый этап действия ботулинического токсина типа А - специфическое связывание молекулы с пресинаптической мембраной. Второй этап - проникновение связанного токсина в цитозоль нерва посредством эндоцитоза. Внутриклеточно 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 внутримышечном введении 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 Ia-афферентных нервных волокон. Это приводит к снижению активности мышечных рецепторов растяжения, а также к эфферентной активности альфа- и гамма-мотонейронов. Клинически это проявляется выраженным расслаблением инъецированных мышц и значительным уменьшением боли в них. Наряду с процессом деуервации в этих мышцах протекает процесс реиннервации путем появления боковых отростков нервных окончаний, что приводит к восстановлению мышечных сокращений через 4-6 месяцев после инъекции.

Фармакокинетика

Фармакологический эффект развивается в месте инъекции. Пресинаптический захват и ретрогадный аксональный транспорт из места введения незначителен.

Продолжительность клинического эффекта составляет 4-6 мес. Восстановление нервно-мышечной активности происходит за счет развития новых аксонных отростков, которые образуют новые функциональные активные нервно-мышечные синапсы, что приводит в итоге к восстановлению мышечных сокращений.

При введении в терапевтических дозах Релатокс не проникает через гемато-энцефалический барьер и не вызывает существенных системных эффектов. Выводится почками в виде нетоксичных метаболитов.

Антитела к комплексу ботулинического токсина типа А с гемагглютинином образуются у 1-5% пациентов после повторных инъекций. Образованию антител способствуют введение препарата в высоких дозах и повторные инъекции малыми дозами через короткие промежутки времени. В случае образования антител к ботулиническому токсину типа А эффект последующей реакции может быть снижен.

Показания к применению:

— лечение блефароспазма;

— коррекция гиперкинетических складок лица (мимических морщин) у взрослых.

Относится к болезням:

- Блефарит

Противопоказания:

— возраст до 18 лет;

— воспалительный процесс в месте предполагаемой инъекции;

— острая фаза инфекционных заболеваний;

— выраженный гравитационный птоз тканей лица;

— выраженные грыжи в области верхних и нижних век;

— период менее 3 месяцев после перенесенной хирургической операции на лице;

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С осторожностью:

Следует применять с крайней осторожностью и под постоянным контролем у пациентов с субклиническими или клиническими признаками нарушения нервно-мышечной передачи, например при миастении или миастеноподобных синдромах (в т.ч. синдром Ламберта-Итона), также у пациентов с патологическими изменениями роговицы, экхимозами (в области введения препарата). Пациенты с нервно-мышечными заболеваниями могут составлять группу риска возникновения клинически выраженных системных эффектов, включая тяжелую дисфагию и нарушение дыхания, при введении обычных доз Релатокс. Лечение таких больных должно проводиться с осторожностью.

При высокой степени миопии, закрытоугольной глаукоме введение препарата определяется по результатам заключения офтальмолога. Редкое моргание, связанное с введением ботулинического токсина в круговую мышцу глаза, может приводить к возникновению патологических изменений роговицы и требует дальнейшего наблюдения у специалиста.

При аллергологическом анамнезе, особенно повышенной чувствительности к препаратам, содержащим белки, следует учитывать риск возникновения аллергической реакции при оценке возможной пользы лечения.

Способ применения и дозы:

Перед разведением препарата центральную часть пробки флакона обрабатывают спиртом этиловым. Препарат растворяют, вводя во флакон 1-8 мл 0,9%-ного раствора натрия хлорида для инъекций путем прокола пробки стерильной иглой длиной 23 или 25 мм. Запрещается открывать флакон и удалять пробку. Раствор препарата представляет собой прозрачную бесцветную жидкость.

Приготовленный инъекционный раствор вводят инсулиновым шприцем с несъемной иглой диаметром 0,27-0,29 мм. Положение пациента при введении препарата в мышцы лица - сидя на стуле, затылок зафиксирован.

Таблица 1. Концентрации препарата, получаемые при разведении Релатокс 50 ЕД

№№ пп	Объем 0,9%-ного раствора натрия хлорида для инъекций, мл	Активность препарата (ЕД в 0,1 мл)
1	1	5
2	2	2,5
3	2,5	2,0
4	4	1,25

Таблица 2. Концентрации препарата, получаемые при разведении РЕЛАТОКС 100 ЕД

№№ пп	Объем 0,9%-ного раствора натрия хлорида для инъекций, мл	Активность препарата (ЕД в 0,1 мл)
1	2	5
2	4	2,5
3	5	2,0
4	8	1,25

Единицы действия ботулинического токсина в различных препаратах не взаимозаменяемы. Рекомендованные дозы, выраженные в единицах действия, для препарата Релатокс отличаются от таковых у других препаратов ботулотоксина.

Дозы и способы введения препарата при коррекции мимических морщин

Сглаживание межбровных морщин.

В процессе формирования межбровных морщин участвуют m. corrugator supercilii (мышца, сморщивающая бровь) и m. procerus (мышца гордецов).

Для определения места инъекций с целью устранения межбровных морщин пациента просят нахмуриться, в этот момент хорошо пальпируется m. corrugator supercilii (мышца, сморщивающая бровь), при этом точка наиболее выраженной мышечной активности должна находиться на 0,5 см вверх от верхнего медиального края брови. Аналогичным образом производят разметку на другой стороне. Игла вводится в толщу брюшка, направление иглы - либо под углом 45° спереди назад, медиально, либо под углом 90°. Глубина введения иглы - 7-10 мм. Если игла упрется в надкостницу, ее надо вытянуть на 1 мм и после этого ввести препарат. Точка введения препарата в m. procerus (мышца гордецов) располагается в центре линии, соединяющей медиальные края бровей. Положение иглы - спереди назад, глубина введения иглы - 2-3 мм.

В каждую точку вводят препарат Релатокс от 2,5 до 7,5 ЕД в зависимости от выраженности морщин, возраста и пола. Общее количество препарата, введенного в эту область, не должно превышать 25 ЕД.

Сглаживание горизонтальных морщин в области лба.

В образовании горизонтальных морщин в области лба участвует m. epicranius (мышца надчерепная). Для сглаживания лобных морщин пациента просят поднять брови и на максимуме амплитуды отмечают точки с наиболее выраженной мимической активностью. С целью исключения птоза брови, расстояние между точкой инъекции и верхним краем брови должно составлять не менее 2 см. Используется 5-10 точек и в каждую вводят от 1,25 ЕД до 2,5 ЕД препарата РЕЛАТОКС. При незначительно выраженных морщинах вводится по 2,0-2,5 ЕД в середину лобной области правой и левой стороны. При желании пациента сохранить движение кончиков бровей, точки инъекции можно расположить V- образно. Если у пациента очень высокий лоб и складки образуются близко под линией волос, можно дополнительно ввести по 1,25-2,5 ЕД в 2-3 точки параллельно линии роста волос. Общее количество препарата на данную область не должно превышать 20 ЕД.

Сглаживание морщин в периорбитальной области.

Морщины, расходящиеся радиально вокруг глаз, так называемые «гусиные лапки», возникают в результате активности круговой мышцы глаза. Для выбора дозы надо попросить пациента рассмеяться и в это время очертить примерные границы области кожи с максимальным количеством складок.

Для уменьшения «гусиных лапок» необходимо произвести несколько инъекций (от 2 до 4 с каждой стороны) в область проекции m. orbicularis oculi(мышца глаза круговая) на расстоянии не менее чем 1 см от наружного угла

глаза, а также в область латеральной части нижнего века в местах максимальной мышечной активности. Расчет дозы производится исходя из площади этой поверхности в покое: в каждую точку вводится 2,0-2,5 ЕД препарата, диффузия из одной точки имеет радиус 0,5-1,0 см, следовательно, расстояние между точками введения должно составлять в среднем 1,0-2,0 см. Максимально допустимое количество вводимых в периорбитальную область единиц не более 25 ЕД на одну сторону. Чтобы не нарушать пропорции лица, необходимо тщательно следить за симметричностью расположения точек введения. Препарат в области «гусиных лапок» не вводится очень низко, так как возможно нарушение симметричности углов рта и носогубной складки вследствие диффузии препарата в область m. zygomaticus major (мышца скуловая большая).

Сглаживание морщин в области спинки носа.

При наличии выраженных морщин в области спинки носа препарат вводится непосредственно в m. nasalis (мышца носовая) с каждой стороны по 2,5 ЕД препарата.

Сглаживание морщин в нижней части лица.

Крылья носа. Препарат вводится непосредственно в крыльную часть m. nasalis (мышца носовая) по 2,5 ЕД с каждой стороны.

Верхняя губа. Инъекции производятся вдоль красной каймы верхней губы внутрикожно непосредственно в морщины, отступая от края на 2 мм, по 1,25 ЕД в каждую точку, количество точек от 4 до 6.

Углы рта. Препарат вводится подкожно в количестве 2,5 ЕД непосредственно в m. depressor anguli oris (мышца, опускающая угол рта).

Подбородок. Препарат вводится подкожно в количестве 2,5 ЕД непосредственно в m. mentalis (мышца подбородочная).

Дозы, схемы и способ введения препарата при лечении блефароспазма

При лечении блефароспазма препарат вводится поверхностно внутримышечно шприцем с иглой калибром 28-30 в следующие точки: две точки на верхнем веке, одна точка на латеральной половине нижнего века и одна точка у латерального угла глаза. В каждую точку следует вводить 2,5-5,0 ЕД. Средняя начальная доза 15-25 ЕД на одну сторону.

Максимально допустимое количество вводимых в периорбитальную область единиц не более 25 ЕД на одну сторону.

Выраженный клинический эффект от введения препарата проявляется в интервале от 2 до 14 дней после инъекции, в зависимости от индивидуальных особенностей организма, и длиться в течение 4-6 месяцев.

При неэффективности первой процедуры при любом выше описанном лечении, т.е. отсутствия значительного клинического улучшения, по сравнению с исходным состоянием, через 1 месяц после введения препарата, необходимо:

- клиническое подтверждение действия токсина на инъецированную мышцу (мышцы), которое может включать электромиграфическое (ЭМГ) исследование, выполняемое опытным специалистом в специализированном отделении;

- анализ причин неэффективности процедуры, например, неадекватный выбор точек для иинъещии, недостаточная доза, неправильная техника инъекции, признаки фиксированной контрактуры, слабость мышц-антагонистов, формирование токсин нейтрализующих антител;

- повторная оценка целесообразности лечения ботулиническим токсином типа А;

- при отсутствии каких-либо нежелательных эффектов, связанных с первым введением препарата, при повторной процедуре должны быть соблюдены следующие условия: коррекция дозы с учетом анализа причин неэффективности предыдущей процедуры; ЭМГ-контроль; интервал между процедурами должен составлять не менее 3- х месяцев.

При отсутствии эффекта от введения препарата или снижении его выраженности после повторных инъекции, следует рекомендовать другие методы лечения.

Побочное действие:

Местные реакции: боль в месте инъекции, раздражение и отек, уплотнение, эритема, стянутость кожи, гиперемия в месте введения (в очень редких случаях возможна разлитая гиперемия), микрогематомы, экхимозы, точечный кератит.

При неквалифицированном выполнении процедуры возможны травмы иглой жизненно важных структур (нервов, сосудов).

Реакции, связанные с распространением препарата на мышечные группы, расположенные вблизи места инъекции: опущение межбровной области, латеральных участков бровей, птоз, нарушение аккомодации, сухость в глазах,

фотофобия и повышенная слезоотделение, трудность смыкания век, лагофтальм, парез мимической мускулатуры, паралич мимической мускулатуры, ассиметрия углов рта, нарушение артикуляции, онемение губ.

Системные реакции: общая слабость, головная боль, головокружение, тошнота, сонливость. Возможно кратковременное повышение температуры тела до субфебрильных цифр (до 37,5 °С).

Передозировка:

Больные с симптомами отравления ботулиническим токсином А (общая слабость, птоз, диплопия, затруднение глотания и расстройство речи, парез дыхательной мускулатуры) должны быть госпитализированы.

При параличе дыхательных мышц необходимо проведение интубации и перевод на искусственную вентиляцию легких до улучшения состояния больного.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата противопоказано во время беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Действие препарата усиливается при одновременном применении антибиотиков группы аминогликозидов, эритромицина, тетрациклина, полимиксинов, средств уменьшающих нервно-мышечную передачу (в т.ч. недеполяризующих миорелаксантов).

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат отпускается, хранится и применяется в специализированных медицинских учреждениях.

Инъекции раствора препарата должен проводить высококвалифицированный врач, имеющий специальную подготовку в специализированных стационарах или амбулаторно, в условиях процедурного кабинета.

Указания по обработке остатков раствора препарата. Сразу же после проведения инъекции оставшийся раствор препарата во флаконе и в шприце следует инактивировать разбавленным раствором гипохлорита натрия (содержащим 1% активного хлора).

Пролитый раствор препарата вытирают абсорбирующей салфеткой, смоченной в разбавленном растворе гипохлорита натрия.

Дезинфекцию производить согласно установленным требованиям. Все вспомогательные материалы, находившиеся в контакте с раствором препарата, должны быть утилизированы способами, предусмотренными для уничтожения биологических отходов.

Сведения о возможном влиянии лекарственного препарата на способность управлять транспортными средствами, механизмами

После введения препарата может развиться мышечная слабость, головокружение и расстройства зрения, может создаваться опасность при управлении автомобилем или работе с движущимися механизмами.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

Хранить и транспортировать в соответствие с СП 3.3.2.1248-03 при температуре от 2 до 8°С в отдельной закрытой маркированной пачке. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

2 года.

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