

Релатокс



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Леофилизат 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.	
Леофилизат 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 синапсомальносвязанного 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 деурвации 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 ретроградный 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 брышка, 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. epicranii* (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 длится 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 электромиографическое (ЭМГ) исследование, выполняемое опытным специалистом в специализированном отделении;

- анализ причин неэффективности процедуры, например, неадекватный выбор точек для инъекции, 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 некачественном 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, асимметрия 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 развиваться 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 соответствии 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.

Релатокс

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

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