

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

АРТИКАИН

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: АРТИКАИН

Международное непатентованное наименование: Артикаин

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: артикаина гидрохлорид – 10,0 мг, 20,0 мг, 40,0 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, вода для инъекций.

Описание: прозрачный бесцветный или с желтоватым оттенком раствор.

Фармакотерапевтическая группа: местноанестезирующее средство

Код АТХ: N01BB08

Фармакологические свойства**Фармакодинамика**

Артикаин является местноанестезирующим средством амидного типа.

Артикаин оказывает местноанестезирующее действие за счет блокады потенциал-зависимых натриевых каналов в клеточной мембране нейронов, что приводит к обратимому угнетению проводимости импульсов по нервному волокну и обратимой потери чувствительности.

Артикаин дозировками 10 мг/мл и 20 мг/мл обладает очень небольшим анестезирующим эффектом для поверхностной анестезии. При всех способах введения препарат оказывает быстрое (латентный период – от 1 до 11 мин) и сильное анестезирующее действие и имеет хорошую тканевую переносимость. Продолжительность анестезии без добавления сосудосуживающего средства (например, эпинефрина), составляет от 60 до 225 мин.

Артикаин дозировкой 40 мг/мл применяется для инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологии. Действие препарата начинается быстро, в течение 1-3 мин. Продолжительность анестезии составляет примерно 20 мин.

Препарат не содержит эпинефрин и применяется, когда добавление эпинефрина к местноанестезирующему средству необязательно или применение эпинефрина противопоказано.

Фармакокинетика

Артикаин быстро и практически сразу после введения метаболизируется (путем гидролиза) неспецифическими плазменными эстеразами в тканях и крови (90 %); остальные 10 % дозы артикаина метаболизируются микросомальными ферментами печени. Образующийся при этом главный метаболит артикаина – артикаиновая кислота – не обладает местноанестезирующей активностью и системной токсичностью, что позволяет проводить повторные введения препарата. Связывание артикаина с белками плазмы крови составляет приблизительно 95 %.

Артикаин выводится через почки, главным образом, в виде артикаиновой кислоты.

После внутримышечного введения максимальная концентрация артикаина в крови достигается через 20-40 мин, период полувыведения составляет приблизительно $39,8 \pm 3,1$ мин.

После подслизистого введения период полувыведения составляет приблизительно 25 мин. Артикаин проникает через плацентарный барьер, практически не выделяется с грудным молоком.

Показания к применению

Раствор для инъекций 10 мг/мл и 20 мг/мл применяется для местной и регионарной блокады нервных окончаний.

Раствор для инъекций 40 мг/мл применяется для инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологии.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к артикаину, другим местноанестезирующим средствам амидного типа или к любому из вспомогательных компонентов препарата;
- тяжелые нарушения функции синусового узла или тяжелые нарушения проводимости (такие, как выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада 2-й или 3-й степени);
- острая декомпенсированная сердечная недостаточность (острое нарушение функционального состояния сердца);
- тяжелая артериальная гипотензия, шок;
- детский возраст до 4-х лет (*для дозировки 40 мг/мл*) (отсутствие достаточного клинического опыта).

С осторожностью

Для дозировок 10 мг/мл и 20 мг/мл:

- у пациентов с недостаточностью холинэстеразы (применение возможно только в случае крайней необходимости, так как возможно пролонгирование и выраженное усиление действия препарата);

- у пациентов с эпилепсией в анамнезе;
- у пациентов со стенокардией, атеросклерозом;
- у пациентов с нарушениями свертываемости крови;
- у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени/ почек.

Для дозировки 40 мг/мл:

- у пациентов с недостаточностью холинэстеразы (применение возможно только в случае крайней необходимости, так как возможно пролонгирование и выраженное усиление действия препарата);
- у пациентов с эпилепсией в анамнезе.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Артикаин проникает через плацентарный барьер. Концентрация артикаина в сыворотке крови у новорожденных (после введения препарата матери) составляет приблизительно 30 % от концентрации артикаина в сыворотке крови матери.

Ввиду недостаточности клинических данных решение о применении препарата врачом может быть принято только в том случае, если потенциальная польза от его применения для матери оправдывает потенциальный риск для плода.

При использовании родовспомогательной анестезии негативного влияния артикаина на новорожденных не отмечено.

Грудное вскармливание

При краткосрочном применении препарата в период грудного вскармливания, как правило, не требуется прерывать кормление грудью, так как в грудном молоке не обнаруживаются клинически значимых концентраций артикаина.

Фертильность

В исследованиях фертильности у крыс при применении артикаина в токсических дозах не отмечено влияния на фертильность у особей мужского и женского пола. Не ожидается влияния на фертильность у человека при применении артикаина в терапевтических дозах.

Способ применения и дозы

Раствор для инъекций 10 мг/мл и 20 мг/мл применяется для инфильтрационной, проводниковой, эпидуральной и внутривенной регионарной анестезии, в зависимости от выбранного вида анестезии.

Следует вводить минимальную дозу, с помощью которой достигается желаемая достаточная анестезия.

Дозировку следует осуществлять индивидуально в соответствии с особенностями каждого

конкретного случая.

Для детей и пациентов пожилого возраста необходим подбор дозы.

Рекомендуемая максимальная доза для взрослых: 5-6 мг/кг массы тела (не более 400 мг).

Ниже представлены ориентировочные дозы, которые необходимо корректировать в зависимости от глубины анестезии и состояния пациента.

Вид анестезии	Количество, мл	
	Для дозировки 10 мг/мл	Для дозировки 20 мг/мл
Блокада плечевого сплетения	10-30	10-15
Эпидуральная (перидуральная) анестезия	10-30	10-15
Внутривенная регионарная анестезия	30-40	-

Во избежание случайной интраваскулярной инъекции, перед введением препарата и в ходе введения основной дозы, всегда следует проводить аспирационную пробу. Давление инъекции должно соответствовать чувствительности тканей.

Раствор для инъекций 40 мг/мл предназначен для применения в ротовой полости и может вводиться только в ткани, где отсутствует воспаление.

Проводить инъекцию в воспаленные ткани нельзя.

Препарат нельзя вводить внутривенно.

При инфильтрационной анестезии при отсутствии воспаления обычно вводят 1,7 мл раствора артикаина на зуб или на два смежных зуба. При проводниковой анестезии нижнего альвеолярного нерва требуется примерно 1-1,7 мл препарата. Для дополнительных инъекций следует применять половину дозы или полную дозу.

Максимальная доза для взрослых составляет 4 мг артикаина гидрохлорида на кг массы тела.

Для того, чтобы избежать случайного попадания препарата в кровеносные сосуды, перед его введением всегда следует проводить аспирационную пробу (в два этапа). Инъекционное давление во время введения препарата должно корректироваться в зависимости от тканевой чувствительности.

Побочное действие

Частота возникновения побочных эффектов представлена в соответствии с классификацией Всемирной Организации Здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$ и $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$), включая отдельные сообщения; частота неизвестна (определить частоту возникновения побочного действия по имеющимся данным не представляется

возможным).

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: парестезия, гипестезия.

Нечасто: головокружение.

Частота неизвестна: дозозависимые реакции со стороны центральной нервной системы (особенно при введении слишком большой дозы или при случайной интраваскулярной инъекции): агитация, нервозность, ступор, иногда прогрессирующий до потери сознания, кома, дыхательные расстройства, иногда прогрессирующие до остановки дыхания, мышечный тремор, мышечные подергивания, иногда прогрессирующие до генерализованных судорог.

Иногда при нарушении правильной техники инъекции при введении местноанестезирующего средства в стоматологической практике возможно повреждение лицевого нерва, которое может привести к развитию паралича лицевого нерва.

Нарушения со стороны органа зрения

Частота неизвестна: зрительные расстройства (нечеткость зрительного восприятия, двоение в глазах, мидриаз, слепота), обычно обратимые, и возникающие во время или через короткое время после инъекции местноанестезирующего средства в область головы.

Нарушения со стороны сердца

Частота неизвестна: снижение артериального давления, брадикардия, сердечная недостаточность, шок (при определенных обстоятельствах с угрозой для жизни).

В процессе родовспомогательной анестезии, в частности при парацервикальной блокаде, может появиться брадикардия у плода. Рекомендуется тщательно контролировать сердечную деятельность плода.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: тошнота, рвота.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: могут развиваться аллергические и алергоподобные реакции. В месте инъекции они могут проявляться в виде отечности/ припухлости и/ или воспаления. Проявлениями, не связанными с местом введения, могут быть гиперемия кожных покровов, зуд, конъюнктивит, ринит и ангионевротический отек.

Ангионевротический отек может проявляться отеком верхней и/или нижней губы, щек, отеком голосовых связок с ощущением «комка в горле» и затруднениями глотания, крапивницей и затруднением дыхания. Любые из этих проявлений могут прогрессировать до анафилактического шока.

Передозировка

Симптомы

Со стороны центральной нервной системы

Возбуждение центральной нервной системы: чувство тревоги, страха, спутанность сознания, гиперпноэ, тахикардия, увеличение артериального давления с покраснением лица, тошнота, рвота, тремор, подергивания, тонико-клонические судороги.

Угнетение центральной нервной системы: головокружение, нарушение слуха, потеря способности говорить, ступор, бессознательное состояние, атония, паралич сосудодвигательных нервов (слабость, бледность), одышка, смерть от асфиксии из-за паралича дыхательных мышц.

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Угнетение сердечно-сосудистой системы: брадикардия, аритмия, мерцание желудочков, падение артериального давления, цианоз, остановка сердца.

Лечение

При первых проявлениях токсического действия, таких как головокружение, моторное возбуждение или ступор во время введения препарата, следует прекратить его введение и перевести пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями. Следует обеспечить проходимость дыхательных путей и мониторировать показатели гемодинамики (число сердечных сокращений и артериальное давление). Рекомендуется всегда, даже если симптомы интоксикации кажутся незначительными, ставить внутривенный катетер для того, чтобы в случае необходимости, иметь возможность немедленно провести внутривенное введение необходимых лекарственных средств.

При нарушениях дыхания, в зависимости от их тяжести, рекомендуется подача кислорода, а при возникновении показаний к проведению искусственного дыхания – проведение эндотрахеальной интубации и искусственной вентиляции легких.

Введение аналептиков центрального действия противопоказано.

Мышечные подергивания и генерализованные судороги могут быть купированы внутривенным введением барбитуратов короткого или ультракороткого действия. Рекомендовано вводить эти препараты медленно, под постоянным врачебным контролем (риск гемодинамических расстройств и угнетения дыхания) и с одновременной подачей кислорода и мониторингом гемодинамических показателей.

Часто брадикардия или резкое снижение артериального давления могут устраняться при простом переведении пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями.

При тяжелых нарушениях кровообращения и шоке, вне зависимости от их причины, введение препарата должно быть прекращено и пациент должен быть переведен в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями. Должны проводиться подача кислорода, внутривенное введение электролитных растворов, глюкокортикостероидов (250-1000 мг метилпреднизолона), при необходимости, плазмозаменителей, в том числе альбумина.

При развитии коллапса и усилении брадикардии показано медленное внутривенное введение раствора эпинефрина (0,0025-0,1 мг) под контролем сердечного ритма и артериального давления. При необходимости введение доз, превышающих 0,1 мг, эпинефрин следует вводить инфузионно, отрегулировав скорость введения под контролем числа сердечных сокращений и артериального давления.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

С лекарственными средствами, угнетающими центральную нервную систему (ЦНС)

Местноанестезирующие средства усиливают действие лекарственных средств, угнетающих ЦНС. Наркотические анальгетики усиливают действие местноанестезирующих средств и повышают риск угнетения дыхания.

С гепарином, ацетилсалициловой кислотой

При проведении инъекций препарата артикаина пациентам, получающим гепарин или ацетилсалициловую кислоту, возможно развитие кровотечений в месте инъекции.

С ингибиторами холинэстеразы

Замедление метаболизма местноанестезирующих лекарственных средств, в результате чего возможно пролонгирование и выраженное усиление действия артикаина.

С сосудосуживающими средствами

Местноанестезирующее действие артикаина усиливают и удлиняют сосудосуживающие лекарственные средства.

Артикаин несовместим с щелочными растворами.

Особые указания

Препарат не предназначен для длительного введения (более 20 мин) при инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологии.

При инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологии принимать пищу можно лишь после прекращения действия местной анестезии (восстановления чувствительности). Детей и их родителей следует предупреждать о риске случайного повреждения мягких тканей зубами (прикусывание) из-за снижения чувствительности тканей вследствие действия препарата.

Регионарная и местная анестезия должна проводиться опытными специалистами в соответствующем оборудованном помещении при доступности готового к немедленному использованию оборудования и препаратов, необходимых для проведения мониторинга сердечной деятельности и реанимационных мероприятий. Персонал, выполняющий анестезию, должен быть квалифицированным и обучен технике выполнения анестезии, должен быть знаком с диагностикой и лечением системных токсических реакций, нежелательных явлений и реакций, и других осложнений.

Только при наличии строгих показаний препарат артикаина можно применять у пациентов с дефицитом холинэстеразы, так как возможно пролонгирование и, при определенных обстоятельствах, усиление его действия.

Нельзя вводить препарат в воспаленные (инфицированные) участки ткани (усиление поглощения артикаина при уменьшении эффективности).

Для того, чтобы избежать риска развития побочных реакций, необходимо соблюдать следующие условия:

- у пациентов группы риска и при применении более высоких доз (более 25 % максимальной однократной дозы) следует освободить доступ к венам, чтобы при необходимости иметь возможность немедленно сделать внутривенную инъекцию;
- применять минимальные эффективные дозы препарата;
- до введения препарата провести двухэтапную аспирационную пробу в двух плоскостях (во избежание случайной интраваскулярной инъекции);
- регулярно контролировать жизненные показатели (контроль сердечно-сосудистой системы и сознания).

Для применения в офтальмологии и при нейроваскулярной анестезии забор препарата можно осуществлять только из вновь открытых ампул (препарат не содержит консервантов).

Для предотвращения инфицирования (в том числе, вирусным гепатитом) необходимо следить за тем, чтобы при заборе препарата из ампул всегда использовались новые стерильные шприцы и иглы.

Открытые ампулы нельзя использовать повторно для других пациентов!

В 1 мл препарата дозировкой 10 мг/мл содержится 0,12 ммоль (2,75 мг) натрия.

В 1 мл препарата дозировкой 20 мг/мл содержится 0,09 ммоль (2,04 мг) натрия.

В 1 мл препарата дозировкой 40 мг/мл содержится 1,0 ммоль (23 мг) натрия.

Эти данные следует учитывать при применении препарата у пациентов, контролирующего потребление натрия (диета с малым содержанием поваренной соли).

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Решение о том, когда пациент сможет вернуться к управлению транспортными средствами и занятиями другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, должен принимать врач.

Невроз ожидания и послеоперационный стресс могут привести к изменению способности управления транспортными средствами или другими видами деятельности, несмотря на то, что местная анестезия артикаином по результатам соответствующих тестов не показала определяемых отклонений от обычной способности управлять транспортными средствами.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 10 мг/мл, 20 мг/мл, 40 мг/мл.

По 1 мл, 2 мл, 5 мл, 10 мл, 20 мл препарата дозировками 10 мг/мл, 20 мг/мл, по 1 мл, 2 мл препарата дозировкой 40 мг/мл в ампулы нейтрального бесцветного стекла с кольцом излома или с надрезом и точкой. На ампулы дополнительно может быть нанесено одно, два или три цветных кольца.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и пленки полимерной или без пленки полимерной.

1, 2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по применению и скарификатор ампульный.

20, 48, 50, 96, 100 контурных ячейковых упаковок помещают в тару из гофрированного картона с равным количеством инструкций по применению и скарификаторов ампульных (для стационаров).

Скарификатор ампульный не вкладывают при использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия
125362, г. Москва, ул. Водников, д. 2, офис 31

Производитель/Организация, принимающая претензии

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия
Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях можно по телефону (3522) 55-51-80 или на сайте:
www.velpharm.ru, в разделе «VELPHARM» – «Фармаконадзор».

Представитель фирмы



М.А. Пишке