Артикаин С Адреналином



Код АТХ:

- N01BB58

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Артикаин
- Эпинефрин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный или с желтоватым оттенком.

	1 мл
артикаина гидрохлорид	40 мг
эпинефрин (в форме гидротартрата)	10 мкг
что соответствует содержанию эпинефрина	5 мкг

Вспомогательные вещества: натрия дисульфит - 0.5 мг, натрия хлорид - 1.6 мг, динатрия эдетат - 0.25 мг, натрия гидроксида раствор 1 М до pH 5.0, вода д/и до 1 мл.

1.7 мл - картриджи (10) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи (10) - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи (10) - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи (10) - упаковки контурные пластиковые (1) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи (10) - упаковки контурные пластиковые (5) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи (10) - упаковки контурные пластиковые (10) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи (10) - вкладыши из картона (1) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи (10) - вкладыши из картона (5) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи (10) - вкладыши из картона (10) - пачки картонные.
1 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
1 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
1 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (20) - пачки картонные.
1 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (50) - пачки картонные.
1 мл - ампулы (5) - упаковки пластиковые контурные (1) - пачки картонные.
1 мл - ампулы (5) - упаковки пластиковые контурные (2) - пачки картонные.
1 мл - ампулы (5) - упаковки пластиковые контурные (20) - пачки картонные.
1 мл - ампулы (5) - упаковки пластиковые контурные (50) - пачки картонные.
2 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
2 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
2 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (20) - пачки картонные.
2 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (50) - пачки картонные.
2 мл - ампулы (5) - упаковки пластиковые контурные (1) - пачки картонные.
2 мл - ампулы (5) - упаковки пластиковые контурные (2) - пачки картонные.

2 мл - ампулы (5) - упаковки пластиковые контурные (20) - пачки картонные.
2 мл - ампулы (5) - упаковки пластиковые контурные (50) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Артикаин с адреналином - комбинированный препарат, в состав которого входит артикаин (местноанестезирующее средство амидного типа) и эпинефрин (сосудосуживающее средство), который добавляется в состав препарата для пролонгации анестезии.

Артикаин является местноанестезирующим средством, применяемым для инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологической практике. Амидная структура артикаина подобна таковой других местноанестезирующих средств, но в его молекуле содержится одна дополнительная эфирная группа, которая в организме человека быстро гидролизуется эстеразами. С быстрым разрушением артикаина до его неактивного метаболита (артикаиновой кислоты) связана его очень низкая системная токсичность, позволяющая проводить повторные инъекции препарата.

Местноанестезирующие средства вызывают обратимую потерю чувствительности за счет прекращения или уменьшения проведения сенсорных нервных импульсов вблизи места инъекции. Они обладают мембраностабилизирующим эффектом за счет снижения проницаемости мембран нервных клеток для ионов натрия.

Артикаин с адреналином оказывает быстрое (латентный период - от 1 до 3 минут) и сильное анестезирующее действие и имеет хорошую тканевую переносимость. Продолжительность анестезии составляет не менее 45 мин.

Вследствие очень низкого содержания в препарате эпинефрина влияние последнего на сердечно-сосудистую систему выражено незначительно: почти не отмечаются повышение АД и увеличение ЧСС.

Фармакокинетика

Связь артикаина с белками плазмы составляет 95 %.

Все местноанестезирующие средства амидного типа метаболизируются в микросомах печени. Кроме этого, артикаин инактивируется путем гидролиза в карбоксильной группе неспецифическими плазменными эстеразами тканей и крови. Так как гидролиз происходит очень быстро и начинается сразу после введения, около 90 % арти каина инактивируется этим способом. Образующийся в результате главный метаболит артикаина, артикаиновая кислота, не обладает местноанестезирующей активностью, и у нее не выявлено системной токсичности.

После подслизистого введения выведение артикаина происходит экспоненциально с периодом полувыведения, составляющим приблизительно 25 минут. Артикаин, главным образом, выводится почками в виде артикаиновой кислоты (64,2±14,4 %), глюкуронида артикаиновой кислоты (13,4±5,0 %) и неизмененного артикаина (1,45±0,77 %).

После инъекций препарата в слизистую полости рта общий клиренс артикаина составляет 235±27 л/ч.

После подслизистого введения 2 мл Артикаина с адреналином время достижения максимальной концентрации в плазме крови (T_{max}) артикаина составляет 10-15 минут, а среднее значение максимальной концентрации в плазме крови (C_{max}) артикаина составляет приблизительно 400 мкг/л, T_{max} артикаиновой кислоты составляет 45 минут, а среднее значение C_{max} артикаиновой кислоты составляет 2000 мкг/л. У детей были получены сопоставимые фармакокинетические данные. Различия между плазменными концентрациями артикаина и артикаиновой кислоты отражают быстрый гидролиз артикаина в тканях и крови, так что введенный артикаин поступает в системный кровоток, в основном, в виде неактивного метаболита.

Концентрация артикаина в крови в области альвеолы зуба после подслизистого введения в тысячи раз превышает концентрацию артикаина в системном кровотоке. Выявлена обратная связь между временем после инъекции и концентрацией артикаина в области зубных альвеол.

Показания к применению:

Инфильтрационная и проводниковая анестезия при стоматологических операциях:

— неосложненные удаления одного или нескольких зубов;

— обработка полостей и обтачивание зубов перед протезированием у взрослых и детей старше 4 лет.

Относится к болезням:

- Анестезия
- Стоматит

Противопоказания:

— гиперчувствительность к артикаину или к другим местноанестезирующим средствам амидного типа, за исключением случаев, когда при гиперчувствительности к местноанестезирующим средствам амидного типа аллергия к артикаину была исключена с помощью соответствующих исследований, проведенных с соблюдением всех необходимых правил и требований.

— гиперчувствительность к эпинефрину;

— гиперчувствительность к любому из вспомогательных компонентов препарата.

Противопоказания, относящиеся к артикаину

—тяжелые нарушения функции синусового узла или тяжелые нарушения проводимости (такие, как тяжелая брадикардия, AV блокада II-III степени);

— острая декомпенсированная сердечная недостаточность;

— тяжелая артериальная гипотензия;

— анемия (в т.ч. B_{12}-дефицитная анемия);

— метгемоглобинемия;

— гипоксия;

Противопоказания, относящиеся к эпинефрину

— пароксизмальная тахикардия, тахиаритмия, закрытоугольная глаукома;

— прием неселективных бета-адреноблокаторов, например, пропранолола (риск развития гипертонического криза и тяжелой брадикардии);

— гипертиреоз;

— феохромоцитома;

— тяжелая артериальная гипертензия;

— терминальная анестезия;

— недавно перенесенный инфаркт миокарда (до 6 месяцев), недавно перенесенное коронарное шунтирование (до 3 месяцев);

— одновременное применение ингибиторов МАО.

С осторожностью

Стенокардия, атеросклероз, постинфарктный кардиосклероз (давность инфаркта миокарда >6 мес), нарушения мозгового кровообращения, инсульт в анамнезе, иные сердечно-сосудистые заболевания (не описанные в разделе "Противопоказания"), хронический бронхит, эмфизема легких, сахарный диабет, недостаточность холинэстеразы (применение возможно только в случае крайней необходимости, так как возможно пролонгированное и чрезмерно сильное действие препарата), нарушения свертываемости крови, тяжелые нарушения функции печени и почек, одновременное применение средств для общей анестезии (производные галогенизированных углеводородов), судороги, тяжелая тревога.

Способ применения и дозы:

Препарат 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.

Для *анестезии при неосложненном удалении зубов верхней челюсти при отсутствии воспаления* обычно достаточно создания депо Артикаина с адреналином в области переходной складки путем его введения в подслизистую оболочку с вестибулярной стороны (по 1,7 мл препарата на зуб). В редких случаях для достижения полной анестезии может потребоваться дополнительное введение от 1 мл до 1,7 мл. В большинстве случаев это позволяет не проводить болезненной небной инъекции. При удалении нескольких рядом расположенных зубов количество инъекций обычно удается ограничить.

Для *анестезии при разрезах и наложении швов в области неба с целью создания небного депо* необходимо около 0,1 мл препарата на каждую инъекцию.

В случае *удаления премоляров нижней челюсти при отсутствии воспаления* можно обойтись без мандибулярной анестезии, так как обычно достаточной является инфильтрационная анестезия, обеспечиваемая инъекцией 1,7 мл на зуб. Если же таким путем не удалось достичь желаемого эффекта, следует выполнить дополнительную инъекцию 1-1,7 мл анестетика в подслизистую оболочку в области переходной складки нижней челюсти с вестибулярной стороны. Если же и в этом случае не удалось достичь полной анестезии, необходимо провести проводниковую блокаду нижнечелюстного нерва.

При *обработке полостей и обтачивании зубов под коронки, за исключением нижних коренных зубов*, в зависимости от объема и продолжительности лечения показано введение Артикаина с адреналином в область переходной складки с вестибулярной стороны в дозе 0,5-1,7 мл на зуб.

При выполнении одной лечебной процедуры **взрослым** можно вводить артикаин в дозе до 7 мг на 1 кг массы тела. Отмечено, что пациенты хорошо переносили дозы до 500 мг (соответствует 12,5 мл раствора для инъекций).

Для **пациентов детского возраста (старше 4 лет)** доза Артикаина с адреналином подбирается в зависимости от возраста и массы тела ребенка, но она не должна превышать 5 мг артикаина на 1 кг массы тела.

У **пациентов пожилого возраста** и всех **пациентов с тяжелой почечной и печеночной недостаточностью** возможно создание повышенных плазменных концентраций артикаина. Для этих пациентов следует применять минимальные дозы, необходимые для достижения достаточной глубины анестезии.

Во избежание случайного попадания препарата в кровеносные сосуды, перед его введением всегда следует проводить двухэтапную аспирационную пробу с поворотом иглы на 90 и 180°(см. "Особые указания").

Тяжелые системные реакции вследствие непреднамеренного внутрисосудистого введения препарата можно предотвратить путем медленного введения: сначала вводят 0,1-0,2 мл препарата, затем, спустя 20-30 с медленно вводят оставшуюся часть препарата.

Давление инъекции должно соответствовать чувствительности тканей.

Побочное действие:

Частота побочных реакций определяется по следующим категориям:

Очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10000, <1/1000), очень редко (<1/10000), частота неизвестна (не может быть определена по имеющимся данным).

Со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: аллергические или псевдоаллергические реакции (гиперчувствительность). Могут проявляться в виде отека и (или) воспаления в месте инъекции, но также могут возникать независимо от места инъекции и проявляться в виде эритемы, кожного зуда, конъюнктивита, ринита, ангионевротического отека лица с отеком верхней губы и (или) нижней губы и (или) отеком щеки, отека гортани с затруднением глотания, крапивницы и затруднения дыхания, которые могут доходить до анафилактического шока.

Со стороны нервной системы

Часто: парестезии, гипестезия, головная боль, вероятно, вследствие наличия в составе препарата эпинефрина.

Нечасто: головокружение.

Частота неизвестна: дозозависимые реакции со стороны центральной нервной системы (в том числе при чрезмерно высоких дозах или после случайной внутрисосудистой инъекции): ажитация, беспокойство, ступор, прогрессирующий в некоторых случаях до потери сознания, кома, нарушение дыхания (в некоторых случаях вплоть до остановки дыхания), мышечный тремор и подергивания, иногда прогрессирующие до генерализованных судорог. Реакции в месте введения: поражение нерва (например, парез лицевого нерва), снижение вкусовых ощущений.

Со стороны органа зрения

Частота неизвестна: преходящие нарушения зрения (затуманивание зрения, слепота, диплопия).

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Нечасто: тахикардия

Частота неизвестна: нарушения сердечного ритма, повышение или снижение артериального давления, брадикардия, сердечная недостаточность и шок.

Со стороны пищеварительной системы

Часто: тошнота, рвота.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Частота неизвестна: случайное внутрисосудистое введение может привести к возникновению ишемии в месте инъекции, иногда прогрессирующей до некроза.

Дети

Опубликованные исследования показывают, что профиль безопасности у детей и подростков в возрасте от 4 до 18 лет сопоставим с таковым у взрослых. Тем не менее, случайные травмы мягких тканей чаще наблюдаются у детей (до 16 % детей), особенно в возрасте от 4 до 7 лет (в связи с длительной анестезией мягких тканей).

Передозировка:

При первых проявлениях токсического действия, таких как головокружение, двигательное 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 нетяжелыми, установить 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 мониторированием 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, 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 введения доз, превышающих 0,1 мг, эпинефрин следует вводить инфузионно, отрегулировав скорость введения под контролем числа сердечных сокращений и артериального давления.

Тяжелые тахикардии и тахиаритмии могут купироваться введением антиаритмических препаратов, за исключением кардионеселективных бета-адреноблокаторов (см. раздел «Противопоказания»).

Повышение артериального давления у пациентов с артериальной гипертензией при необходимости должно снижаться с помощью вазодилататоров.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Артикаин проходит через плацентарный барьер.

Ввиду недостаточности клинических данных, применение препарата возможно только в том случае, если потенциальная польза от его применения для матери оправдывает потенциальный риск для плода. Так как

эпинефрин может снизить перфузию матки, при необходимости применения артикаина во время беременности лучше применять препараты, не содержащие эпинефрин или с концентрацией эпинефрина 0,005 мг/мл.

В период лактации нет необходимости прерывать грудное вскармливание, так как в грудном молоке не обнаруживается клинически значимых концентраций артикаина.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Противопоказанные комбинации

Одновременное применение с неселективными бета-адреноблокаторами, например, пропранололом, ввиду риска развития гипертонического криза и тяжелой брадикардии.

Взаимодействия, которые следует принимать во внимание

Одновременное применение с трициклическими антидепрессантами или ингибиторами МАО

Действие вазоконстрикторов, повышающих артериальное давление, в том числе адреномиметиков, таких, например, как эпинефрин, может усиливаться трициклическими антидепрессантами или ингибиторами МАО. Подобные наблюдения были описаны для концентраций норэпинефрина 1:25 000 и эпинефрина 1:80 000 при их применении в качестве вазоконстрикторов. Концентрация эпинефрина в Артикаине с адреналином ниже - 1:200 000. Однако необходимо учитывать возможность такого усиления действия.

Одновременное применение с лекарственными средствами, угнетающими ЦНС

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

Одновременное применение с гепарином, ацетилсалициловой кислотой

При проведении инъекций Артикаина с адреналином пациентам, получающим гепарин или ацетилсалициловую кислоту, возможно развитие кровотечений в месте инъекции.

Одновременное применение с миорелаксантами

Возможно усиление и удлинение действия миорелаксантов.

Одновременное применение с антимиастеническими лекарственными средствами

Антагонистическое воздействие на скелетную мускулатуру, особенно при применении в высоких дозах, требует дополнительной коррекции лечения миастении.

Одновременное применение с ингибиторами холинэстеразы

Возможно замедление метаболизма местноанестезирующих лекарственных средств.

Одновременное применение с гипогликемическими средствами для приема внутрь

Эпинефрин может ингибировать высвобождение инсулина из β-клеток поджелудочной железы и уменьшать эффекты гипогликемических средств для приема внутрь.

Одновременное применение с некоторыми средствами для ингаляционного наркоза (галотан)

Галотан может повышать чувствительность миокарда к катехоламинам и поэтому увеличивать риск развития нарушений сердечного ритма после инъекций Артикаина с адреналином.

Одновременное применение с дезинфицирующими растворами, содержащими тяжелые металлы

При обработке места инъекции местного анестетика дезинфицирующими растворами, содержащими тяжелые металлы, повышается риск развития местных реакций: отека, болезненности.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат нельзя вводить внутривенно!

Нельзя проводить инъекцию в воспаленную область!

Во избежание внутрисосудистой инъекции перед введением препарата следует обязательно проводить двукратный аспирационный тест.

Инъекционное давление должно соответствовать чувствительности ткани.

Для предотвращения занесения инфекций (в том числе, вирусного гепатита) необходимо следить за тем, чтобы при заборе раствора из ампул всегда использовались новые стерильные шприцы и иглы. Открытые картриджи нельзя использовать снова для других пациентов!

Нельзя использовать для инъекций поврежденный картридж.

У больных с заболеваниями сердечно-сосудистой системы (хроническая сердечная недостаточность, патология коронарных сосудов, стенокардия, нарушения ритма сердца, инфаркт миокарда в анамнезе, артериальная гипертензия), цереброваскулярными расстройствами, наличием инсульта в анамнезе, хроническим бронхитом, эмфиземой, сахарным диабетом, гипертиреозом, а также при наличии тяжелой тревоги, целесообразно применять артикаин без эпинефрина.

Принимать пищу можно лишь после прекращения действия местной анестезии (восстановления чувствительности).

Родители (опекуны) детей младшего возраста должны следить, чтобы последние не нанесли себе повреждения мягких тканей при укусе в период действия анестезии.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и выполнять работы, связанные с повышенной опасностью

По результатам клинических исследований установлено, что местная анестезия Артикаина с адреналином не вызывает какого-либо заметного нарушения способности управлять транспортными средствами. Однако решение о том, когда пациент после стоматологического вмешательства сможет вернуться к управлению транспортными средствами и занятиям потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, должен принимать врач.

При нарушениях функции почек

У всех пациентов с тяжелой почечной недостаточностью возможно создание повышенных плазменных концентраций артикаина. Для этих пациентов следует применять минимальные дозы, необходимые для достижения достаточной глубины анестезии.

При нарушениях функции печени

У всех пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью возможно создание повышенных плазменных концентраций артикаина. Для этих пациентов следует применять минимальные дозы, необходимые для достижения достаточной глубины анестезии.

Применение в пожилом возрасте

У пациентов пожилого возраста возможно создание повышенных плазменных концентраций артикаина. Для этих пациентов следует применять минимальные дозы, необходимые для достижения достаточной глубины анестезии.

Применение в детском возрасте

Для пациентов детского возраста (старше 4 лет) доза Артикаина с адреналином подбирается в зависимости от возраста и массы тела ребенка, но она не должна превышать 5 мг артикаина на 1 кг массы тела.

Условия хранения:

В защищенном от света месте при температуре не выше 25°С, не допускать замораживания. Хранить в недоступном для детей месте. Срок годности для картриджей - 2 года; для ампул - 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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