Ультракаин Д-С форте



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.

	1 мл
артикаина гидрохлорид	40 мг
эпинефрина гидрохлорид	12 мкг,
эквивалентно содержанию основания эпинефрина	10 мкг,
что соответствует содержанию эпинефрина в растворе 1:100 000	

Вспомогательные вещества: натрия дисульфит (натрия метабисульфит), натрия хлорид, вода д/и.

2 мл - ампулы бесцветного стекла (10) - пачки картонные.
1.7 мл - картриджи бесцветного стекла (10) - блоки из гофрированного картона (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный местноанестезирующий препарат, в состав которого входит артикаин (местноанестезирующее средство амидного типа) и эпинефрин (сосудосуживающее средство), которое добавляется в состав препарата для пролонгирования продолжительности анестезии.

Амидная структура артикаина подобна структуре 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 очень низкая системная токсичность препарата, позволяющая проводить повторные инъекции препарата.

Местноанестезирующие средства вызывают обратимую потерю чувствительности вследствие прекращения или уменьшения проводимости сенсорных нервных импульсов непосредственно в месте инъекции и вокруг него. Они обладают мембраностабилизирующим эффектом за счет снижения проницаемости мембран нервных клеток для ионов натрия.

Препарат оказывает быстрое (латентный период - от 1 до 3 мин) и сильное анестезирующее действие и имеет хорошую тканевую переносимость. Продолжительность анестезии составляет не менее 75 мин.

Фармакокинетика

Всасывание

После подслизистого введения 2 мл препарата T_{max} артикаина в плазме крови составляет 10-15 мин, а среднее значение в плазме крови C_{max} артикаина составляет приблизительно 400 мкг/л, T_{max} артикаиновой кислоты составляет 45 мин, 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.

Распределение

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

Связывание артикаина с белками плазмы составляет 95%.

Метаболизм

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

Выведение

После подслизистого введения выведение артикаина происходит экспоненциально с $T_{1/2}$ приблизительно 25 мин. Артикаин выводится главным образом почками в виде артикаиновой кислоты (64.2±14.4%), глюкуронида артикаиновой кислоты (13.4±5%) и неизмененного артикаина (1.45±0.77%).

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

Показания к применению:

Инфильтрационная и проводниковая анестезия при стоматологических операциях на слизистой оболочке или костях, когда требуется создание условий более выраженной ишемии:

— операции на пульпе зуба (ампутация или экстирпация);

— удаление сломанного зуба (остеотомия);

— удаление зуба, пораженного апикальным пародонтитом;

— продолжительные хирургические вмешательства (например, операция по Колдуэллу-Люку);

— чрескожный остеосинтез;

— эксцизия кист;

— вмешательства на слизистой оболочке десны;

— резекция верхушки корня зуба;

— обработка полостей и обтачивание перед протезированием высокочувствительных зубов.

Относится к болезням:

- Анестезия

- Пародонтит
- Пульпит
- Стоматит

Противопоказания:

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

— повышенная чувствительность к эпинефрину;

— повышенная чувствительность к вспомогательным компонентам препарата, в т.ч. к сульфитам (включая проявляющуюся в виде бронхиальной астмы).

Противопоказания, относящиеся к артикаину

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

— острая декомпенсированная сердечная недостаточность;

— резко выраженная артериальная гипотензия;

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

— метгемоглобинемия;

— гипоксия;

— детский возраст до 4 лет (отсутствие клинического опыта);

Противопоказания, относящиеся к эпинефрину

— пароксизмальная тахикардия, тахиаритмия;

— закрытоугольная глаукома;

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

— гипертиреоз;

— феохромоцитома;

— тяжелая артериальная гипертензия.

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов со стенокардией, атеросклерозом, постинфарктным кардиосклерозом, нарушениями мозгового кровообращения, инсультом в анамнезе, хроническим бронхитом, эмфиземой легких, сахарным диабетом, недостаточностью холинэстеразы (применение возможно только в случае крайней необходимости, т.к. возможно пролонгированное и чрезмерно сильное действие препарата), нарушениями свертываемости крови, тяжелыми нарушениями функции печени и почек, выраженным возбуждением

Способ применения и дозы:

Препарат предназначен для применения в ротовой полости и может вводиться только в ткани, где отсутствует воспаление. Нельзя проводить инъекцию в воспаленные ткани.

Препарат нельзя вводить в/в.

Для анестезии при неосложненном удалении зубов верхней челюсти при отсутствии воспаления обычно достаточно создания депо препарата Ультракаин Д-С (Ультракаин Д-С форте) в области переходной складки путем его введения в подслизистую 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, т.к. обычно достаточной является инфильтрационная анестезия, обеспечиваемая инъекцией 1.7 мл препарата на зуб. Если же таким путем не удалось достичь желаемого эффекта, следует выполнить дополнительную инъекцию 1-1.7 мл препарата в подслизистую 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 хирургических вмешательствах доза препарата Ультракаин Д-С форте в зависимости от тяжести и длительности вмешательства устанавливается индивидуально.

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).

У **детей старше 4 лет** дозу препарата подбирают в зависимости от возраста и массы тела ребенка; доза не должна превышать 5 мг артикаина на 1 кг массы тела.

У **пациентов пожилого возраста** и **пациентов с тяжелой почечной и печеночной недостаточностью** возможно создание повышенных плазменных концентраций артикаина. У этих пациентов препарат следует применять в минимальной дозе, необходимой для достижения достаточной глубины анестезии.

Для того чтобы избежать случайного внутрисосудистого введения препарата, всегда перед его введением следует проводить аспирационную пробу.

Давление инъекции должно соответствовать чувствительности тканей.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: дозозависимые реакции - ступор, иногда прогрессирующий до потери сознания, дыхательные расстройства, иногда прогрессирующие до остановки дыхания, мышечный тремор, мышечные подергивания иногда прогрессирующие до генерализованных судорог; возможны - головокружение, парестезия, гипестезия, преходящие зрительные расстройства (нечеткость зрительного восприятия, слепота, двоение в глазах), возникающие во время или через короткое время после инъекции местноанестезирующего средства.

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

Часто - головная боль, главным образом, вследствие наличия в составе препарата эпинефрина.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, брадикардия, сердечная недостаточность, шок. Очень редко вследствие содержания в составе препарата эпинефрина возможно развитие тахикардии, нарушений сердечного ритма, повышение АД.

Аллергические реакции: возможны - гиперемия кожных покровов, конъюнктивит, ринит и ангионевротический отек. Ангионевротический отек может проявляться отеком верхней и/или нижней губ, щек, отеком голосовых связок с ощущением "комка в горле" и затруднениями глотания, крапивница, затруднение дыхания. Любые из этих проявлений могут прогрессировать до анафилактического шока.

Местные реакции: отечность или воспаление слизистой оболочки в месте инъекции. В отдельных случаях при случайном внутрисосудистом введении возможно появление зон ишемии в месте введения, вплоть до некроза тканей.

Передозировка:

Симптомы: первые проявления токсического действия - головокружение, моторное возбуждение или ступор; возможны брадикардия, резкое снижение АД, нарушения дыхания, мышечные подергивания, генерализованные судороги, тяжелые нарушения кровообращения, шок.

Лечение: при первых проявлениях симптомов токсического действия 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 (ЧСС и АД). Рекомендуется всегда, даже если симптомы интоксикации кажутся нетяжелыми, ставить в/в катетер для того, чтобы в случае необходимости, иметь возможность немедленно провести в/в 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 ИВЛ.

Введение аналептиков центрального действия противопоказано.

Мышечные подергивания и генерализованные судороги могут быть купированы в/в 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 АД могут быть устранены при простом переведении пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями.

При тяжелых нарушениях кровообращения и шоке, вне зависимости от их причины, введение препарата следует прекратить и пациент должен быть переведен в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями. Необходимо обеспечить подачу кислорода, в/в введение растворов электролитов, ГКС (250-1000 мг метилпреднизолона), при необходимости, плазмозаменителей, в т.ч. альбумина.

При развитии коллапса и усилении брадикардии показано медленное в/в введение раствора эпинефрина (0.0025-0.1 мг) под контролем сердечного ритма и АД. При необходимости введения в дозах, превышающих 0.1 мг, эпинефрин следует вводить инфузионно, отрегулировав скорость введения под контролем ЧСС и АД.

Тяжелые тахикардии и тахиаритмии можно купировать введением антиаритмических препаратов, за исключением кардионеселективных бета-адреноблокаторов.

Повышение АД у пациентов с артериальной гипертензией при необходимости следует снижаться с помощью вазодилататоров.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Артикаин проникает через плацентарный барьер.

Ввиду недостаточности клинических данных решение о назначении препарата стоматологом может быть принято только в том случае, если потенциальная польза от его применения оправдывает потенциальный риск для плода. При необходимости применения артикаина при беременности предпочтительно использовать препараты, не содержащие эпинефрин (Ультракаин Д) или с меньшей концентрацией эпинефрина (Ультракаин Д-С).

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Противопоказанные комбинации

Противопоказана комбинация с кардионеселективными бета-адреноблокаторами, например, пропранололом, т.к. имеется риск развития гипертонического криза и выраженной брадикардии.

Взаимодействия, которые следует принимать во внимание

Возможно усиление действия вазоконстрикторов, повышающих АД, таких как эпинефрин, при одновременном применении трициклических антидепрессантов или ингибиторов 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 препарате Ультракаин Д-С форте ниже - 1:100 000. Однако учитывать возможности такого усиления действия необходимо.

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

При проведении инъекций препарата Ультракаин Д-С форте пациентам, получающим гепарин или ацетилсалициловую кислоту, возможно развитие кровотечений в месте инъекции.

Ультракаин Д-С форте увеличивает интенсивность и длительность действия миорелаксантов.

Ультракаин Д-С форте проявляет антагонизм в отношении воздействия на склелетную мускулатруру с препаратами для лечения миастении, поэтому при его применении, особенно в высоких дозах, требуется дополнительная коррекция лечения миастении.

Ультракаин Д-С форте вызывает замедление метаболизма местноанестезирующих лекарственных средств.

При одновременном применении с ингибиторами холинэстеразы происходит замедление метаболизма местноанестезирующих лекарственных средств.

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

Галотан может повышать чувствительность сердца к катехоламинам и поэтому повышать риск развития нарушений сердечного ритма после инъекций препарата Ультракаин Д-С форте.

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 в/в. Нельзя проводить инъекцию в воспаленную область. Во избежание внутрисосудистого введения необходимо всегда проводить аспирационный тест.

Инъекционное давление должно соответствовать чувствительности ткани.

Для предотвращения занесения инфекций (в т.ч. 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 пациентов 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 выраженного беспокойства целесообразно использование препарата Ультракаин Д-С, содержащего меньшее количество эпинефрина, или препарата Ультракаин Д, не содержащего эпинефрин.

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Местная анестезия препаратом Ультракаин Д-С форте, как показали испытания, не вызывает какого-либо заметного отклонения от обычной способности к управлению автомобилем и участию в уличном движении. Однако решение о том, когда пациент после стоматологического вмешательства сможет вернуться к вождению автотранспорта и занятиям потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, должен принимать врач.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени.

Применение в пожилом возрасте

У **пациентов пожилого возраста** возможно создание повышенных плазменных концентраций артикаина. У этих пациентов препарат следует применять в минимальной дозе, необходимой для достижения достаточной глубины анестезии.

Применение в детском возрасте

Противопоказано применение у детей в возрасте до 4 лет (отсутствие клинического опыта).

Условия хранения:

Список Б.

Ампулы следует хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Срок годности - 36 месяцев.

Картриджи следует хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 30°С. Срок годности - 30 месяцев.

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ultrakain_D-S_forte