

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

Ультракаин® Д-С форте

Регистрационный номер: П N015117/01

Торговое название препарата: Ультракаин® Д-С форте

МНН или группировочное название: артикаин + эпинефрин&

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав

В 1 мл раствора содержится:

активные вещества: артикаина гидрохлорид - 40 мг и эпинефрина гидрохлорид – 0,012 мг (эквивалентно содержанию основания эпинефрина – 0,010 мг, что соответствует содержанию эпинефрина в растворе 1:100 000);

вспомогательные вещества: натрия дисульфит (натрия метабисульфит), натрия хлорид, вода для инъекций.

Описание

Прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: местноанестезирующее средство + альфа- и бета-адреномиметик.

Код АТХ: N01BB58.

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Ультракаин® Д-С форте – комбинированный препарат, в состав которого входит артикаин (местноанестезирующее средство амидного типа) и эпинефрин (сосудосуживающее средство), которое добавляется в состав препарата для пролонгирования продолжительности анестезии.

Артикаин является местноанестезирующим средством, используемым для инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологической практике. Амидная структура артикаина подобна таковой у других местноанестезирующих средств, но в его молекуле содержится одна дополнительная эфирная группа, которая в организме человека быстро гидролизруется 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 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.

Ультракаин® Д-С форте оказывает быстрое (латентный период - от 1 до 3 минут) и сильное анестезирующее действие и имеет хорошую тканевую переносимость. Продолжительность анестезии составляет не менее 75 мин.

Фармакокинетика

Все местноанестезирующие средства амидного типа метаболизируются в микросомах печени. Кроме этого артикаин в тканях и крови ещё инактивируется неспецифическими плазменными эстеразами путем гидролиза в карбоксильной группе. Так как 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.

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

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

После подслизистого введения 2 мл препарата Ультракаин® Д-С форте 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.

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

Связь артикаина с белками плазмы составляет 95%.

Показания

Инфильтрационная и проводниковая анестезия при стоматологических операциях на слизистой оболочке или костях, требующие создания условий более выраженной ишемии; операции на пульпе зуба (ампутация или экстирпация), удаление сломанного зуба (остеотомия) или 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.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность 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.

- Повышенная чувствительность к эpineфрину; сульфитам (в том числе проявляющаяся в виде бронхиальной астмы); повышенная чувствительность к любым другим вспомогательным ингредиентам препарата.

Противопоказания, относящиеся к артикаину

- Тяжелые нарушения функции синусового узла или тяжелые нарушения проводимости (такие как, выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада 2-3 степени).
- Острая декомпенсированная сердечная недостаточность.
- Резко выраженная артериальная гипотензия.
- Анемия (в том числе В-12 дефицитная анемия).
- Метгемоглобинемия.
- Гипоксия.
- Детский возраст до 4-х лет (отсутствие клинического опыта).

Противопоказания в связи с наличием в составе препарата эpineфрина

- 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: 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, так как возможно пролонгированное и чрезмерно сильное действие препарата), нарушениями свертываемости крови, тяжелыми нарушениями функции печени и почек, выраженным возбуждением.

Беременность и период лактации

Артикаин проходит через плацентарный барьер.

Ввиду недостаточности клинических данных решение о назначении препарата врачом стоматологом может быть принято только в том случае, если потенциальная польза от его применения для матери оправдывает потенциальный риск для плода. При необходимости применения артикаина во время беременности лучше использовать препараты, не содержащие эpineфрин или препараты с меньшей концентрацией эpineфрина (препараты Ультракаин® Д и Ультракаин® Д-С).

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

Способ применения и дозы

Препарат предназначен для использования 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 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 нёбной инъекции. При удалении нескольких рядом расположенных зубов количество инъекций обычно удается ограничить.

Для анестезии при разрезах и наложении швов в области нёба с целью создания нёбного 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 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 Ультракаин® Д-С форте в зависимости от тяжести и длительности вмешательства дозируется индивидуально.

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

У пациентов детского возраста (старше 4 лет) доза препарата Ультракаин® Д-С форте 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. У этих пациентов следует применять минимальные дозы, необходимые для достижения достаточной глубины анестезии.

Для того чтобы избежать случайного внутрисосудистого введения препарата, всегда перед его введением следует проводить аспирационную пробу (см. «Особые указания»).

Давление инъекции должно соответствовать чувствительности тканей.

Побочное действие

Со стороны центральной нервной системы

- Зависящие от дозы реакции со стороны центральной нервной системы: ступор, иногда прогрессирующий до потери сознания, дыхательные расстройства, иногда прогрессирующие до остановки дыхания, мышечный тремор, мышечные подергивания иногда прогрессирующие до генерализованных судорог.
- 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 эpineфрина

Со стороны желудочно-кишечного тракта

- Тошнота, рвота

Со стороны сердечно-сосудистой системы

- Снижение артериального давления, брадикардия, сердечная недостаточность и шок.
- Очень редко вследствие содержания в составе препарата эpineфрина возможно развитие тахикардии, нарушений сердечного ритма, повышение артериального давления.

Со стороны иммунной системы

- Могут развиваться аллергические и алергоподобные реакции. В месте инъекции они могут проявляться как отечность или воспалительная реакция слизистой оболочки. Проявлениями, не связанными с местом введения, могут быть гиперемия кожных покровов, 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 затруднением глотания, крапивницей и затруднением дыхания. Любые из этих проявлений могут прогрессировать до анафилактического шока.

Общие нарушения и нежелательные реакции в месте введения

- В отдельных случаях при случайном внутрисосудистом введении возможно появление зон ишемии в месте введения, вплоть до некроза тканей.

Передозировка

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, поставить внутривенный катетер для того, чтобы в случае необходимости иметь возможность немедленно проводить 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 контролем врача (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, альбумина.

При развитии циркуляторного 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.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Противопоказанные комбинации

С кардионеселективными бета-адреноблокаторами, например, пропранололом.

Риск развития гипертонического криза и выраженной брадикардии.

Взаимодействия, которые следует принимать во внимание

С трициклическими антидепрессантами или ингибиторами моноаминоксидазы (МАО)

Действие вазоконстрикторов, повышающих артериальное давление, типа 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 препарате Ультракаин® Д-С форте ниже – 1:100 000. Однако учитывать возможности такого усиления действия необходимо.

С лекарственными средствами, угнетающими центральную нервную систему (ЦНС).

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

С гепарином, ацетилсалициловой кислотой

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

С миорелаксантами

Усиление и удлинение действия миорелаксантов.

С антимиастеническими лекарственными средствами

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

С ингибиторами холинэстеразы

Замедление метаболизма местноанестезирующих лекарственных средств.

С гипогликемическими средствами для приема внутрь

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

С некоторыми средствами для ингаляционного наркоза (галотан).

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

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

Препарат нельзя вводить внутривенно!

Нельзя проводить инъекцию в воспаленную область!

Во избежание внутрисосудистой инъекции следует обязательно проводить аспирационный тест.

Инъекционное давление должно соответствовать чувствительности ткани.

Для предотвращения занесения инфекций (в том числе и 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 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 управлять автомобилем и выполнять работы, связанные с повышенной опасностью

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.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 40 мг/мл+0,010 мг/1 мл, в ампулах по 2 мл и картриджах по 1,7 мл.

Ампулы: по 2 мл в ампулу прозрачного бесцветного стекла (тип I). По 10 ампул помещают в картонную пачку вместе с инструкцией по применению.

Картриджи: по 1,7 мл в картридж прозрачного, бесцветного стекла (тип I). По 10 картриджей помещают в блок из гофрированного картона. По 10 блоков из гофрированного картона помещают в картонную пачку вместе с инструкцией по применению.

Условия хранения

Ампулы. При температуре не выше 25°С в защищенном от света месте.

Картриджи. При температуре не выше 30°С в защищенном от света месте.

Хранить препарат в недоступном для детей месте.

Список Б.

Срок годности

Ампулы - 36 месяцев. Картриджи – 30 месяцев.

По истечении срока годности препарат применять нельзя.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Название производителя

Санofi-Авентис Дойчланд ГмбХ, Германия

Индустрипарк Хехст,

D-65926 Франкфурт-на-Майне, Германия.

Претензии потребителей направлять по адресу:

115035, Москва, ул. Садовническая, 82, стр. 2.

Телефон (495) 721-14-00. Факс (495) 721-14-11