

**ИНСТРУКЦИЯ**  
**по применению лекарственного препарата для медицинского применения**  
**Артикаин с адреналином форте**

Регистрационный номер: ЛСР-008523/10

Торговое название препарата: Артикаин с адреналином форте

Группировочное название: артикаин + эпинефрин

Лекарственная форма: раствор для инъекций (40 мг + 0,01 мг)/мл.

**Состав**

1 мл раствора содержит:

**активные вещества:**

артикаина гидрохлорид - 40 мг

эпинефрина гидротартрат – 0,018 мг (в пересчете на эпинефрин – 0,010 мг);

**вспомогательные вещества**

натрия дисульфит – 0,50 мг

натрия хлорид – 1,60 мг

динатрия эдетат – 0,25 мг

1 М раствор натрия гидроксида до pH 5,0

вода для инъекций до 1 мл.

**Описание**

Прозрачный бесцветный или с желтоватым оттенком раствор.

**Фармакотерапевтическая группа**

Местноанестезирующее средство + альфа- и бета-адреномиметик.

Код АТХ: N01BB58

**Фармакологическое действие**

**Фармакодинамика**

Артикаин с адреналином форте - комбинированный препарат, в состав которого входит артикаин (местноанестезирующее средство амидного типа) и эпинефрин (сосудосуживающее средство), которое добавляют 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 нервных клеток для ионов натрия.

Артикаин с адреналином 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 минут.

**Фармакокинетика**

Связь артикаина с белками плазмы крови 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 % артикаина 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 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.

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**

Инфильтрационное обезболивание вмешательств на верхней челюсти и в переднем участке (включая премоляры) нижней челюсти, проводниковая анестезия.

**Противопоказания**

Повышенная чувствительность к артикаину, эпинефрину, сульфатам (непереносимость сульфогрупп - особенно при бронхиальной астме) или к любому другому из вспомогательных компонентов препарата.

**Противопоказания, относящиеся к артикаину:**

- нарушение функции синусового узла или тяжелые нарушения проводимости (такие как, выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада II-III степени);
- острая декомпенсация сердечной недостаточности;
- артериальная гипотензия;
- анемия (в том числе В<sub>12</sub> дефицитная анемия);
- метгемоглобинемия;
- гипоксия;
- дети до 4-х летнего возраста (отсутствует опыт клинического применения).

**Противопоказания в связи с наличием в составе препарата эпинефрина:**

- пароксизмальная тахикардия, тахикардия, тахикардия, закрытоугольная глаукома;
- одновременный прием неселективных бета-адреноблокаторов (риск гипертонического криза и выраженной брадикардии);
- гипертиреоз;
- феохромоцитомы;
- артериальная гипертензия.

**С осторожностью:** стенокардия; атеросклероз; постинфарктный кардиосклероз; нарушения мозгового кровообращения; инсульт в анамнезе; 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/или почек; выраженное возбуждение.

**Применение при беременности и в период грудного вскармливания**

Артикаин проходит через плацентарный барьер. Ввиду недостаточности клинических данных о применении препарата во время беременности, решение о применении препарата принимается врачом-стоматологом только в том случае, если потенциальная польза от применения препарата для матери оправдывает потенциальный риск для плода.

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 применения только в ротовой полости и может вводиться только в ткани, где отсутствует воспаление.**

**Препарат нельзя вводить внутривенно!**

При неосложненном удалении зубов верхней челюсти в невоспалительной стадии обычно вводят под слизистую оболочку в области переходной складки - вестибулярное дело 1,7 мл препарата (на каждый зуб). В отдельных случаях может потребоваться дополнительное введение от 1,0 до 1,7 мл препарата для достижения полной анестезии. В большинстве случаев нет необходимости выполнять болезненные инъекции с небной стороны.

Для анестезии при небных разрезах и наложении швов с целью создания небного депо необходимо около 0,1 мл препарата на укол. При удалении нескольких рядом расположенных зубов количество инъекций обычно удается ограничить.

При удалении премоляров нижней челюсти при отсутствии воспаления можно обойтись без мандибулярной анестезии, так как инфильтрационная анестезия, обеспечиваемая инъекцией 1,7 мл на зуб, как правило, достаточна. Если же этим путем не удалось достичь желаемого эффекта, следует выполнить дополнительную инъекцию 1,0 – 1,7 мл препарата под слизистую оболочку в области переходной складки нижней челюсти с вестибулярной стороны. Если же и в этом случае не удалось достичь полной анестезии, необходимо провести блокаду нижнечелюстного нерва.

При препарации полостей и обточке зубов для коронок, за исключением моляров нижней челюсти, - вестибулярная инъекция 0,5-0,7 мл на зуб. При хирургических вмешательствах Артикаин с адреналином форте в зависимости от тяжести и длительности вмешательства дозируется индивидуально. Максимальная доза - 7 мг/кг.

Продолжительность анестезии, в течение которой можно провести вмешательство, составляет 30-45 минут.

Давление инъекции должно соответствовать чувствительности тканей.

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

У пациентов детского возраста (старше 4 лет) доза препарата Артикаин с адреналином 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/или печеночной недостаточностью возможно создание повышенных плазменных концентраций артикаина. У этих пациентов следует применять минимальные дозы, необходимые для достижения достаточной глубины анестезии.

#### **Побочное действие**

*Со стороны центральной нервной системы:* в зависимости от примененной дозы возможны случаи нарушения сознания, вплоть до его потери; нарушение дыхания вплоть до его остановки; мышечный тремор; непроизвольные подергивания мышц, иногда прогрессирующие, вплоть до генерализованных судорог; головокружение, парестезии, гипестезии, головная боль.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота.

*Со стороны органа зрения:* преходящие зрительные расстройства (нечеткость зрительного восприятия, слепота, двоение в глазах), возникающие во время или через короткое время после инъекции местноанестезирующего средства.

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

*Аллергические реакции:* гиперемия и зуд кожи, конъюнктивит, ринит, ангионевротический отек различной степени выраженности (включая отек верхней и/или нижней губы и/или щек, голосовой щели с затруднением акта глотания, крапивницу, затруднение дыхания). Все эти явления могут прогрессировать вплоть до развития анафилактического шока.

*Местные реакции:* отек или воспаление в месте инъекции; появление ишемических зон в месте введения (вплоть до развития тканевого некроза - при случайном внутрисосудистом введении); повреждение нерва, в частности в стоматологической практике, лицевого нерва (вплоть до развития паралича) - возникает только при нарушении техники инъекции.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты не указанные в инструкции, **сообщите об этом врачу.**

#### **Передозировка**

При появлении первых признаков передозировки (головокружение, двигательное возбуждение, потеря сознания) во время инъекции необходимо прекратить введение препарата, перевести пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями, обеспечить свободную проходимость дыхательных путей, контролировать АД, ЧСС.

При одышке, апноэ - кислород, эндотрахеальная интубация, искусственная вентиляция легких (введение центральных аналептиков противопоказано).

При судорогах - внутривенно медленно барбитураты короткого действия с одновременной подачей кислорода и контролем показателей гемодинамики.

При тяжелых нарушениях кровообращения и шоке - внутривенная инфузия растворов электролитов и плазмозаменителей, глюкокортикостероиды, альбумин.

При сосудистом коллапсе и нарастающей брадикардии - внутривенно медленно эpineфрин (адреналин) 0,1 мг, далее внутривенно капельно под контролем ЧСС и АД.

При выраженной тахикардии и тахикардии - внутривенно бета-адреноблокаторы (селективные).

При повышении АД - периферические вазодилататоры. Оксигенотерапия и контроль состояния кровообращения необходимы во всех случаях.

#### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

Трициклические антидепрессанты, ингибиторы моноаминоксидазы усиливают гипертензивное действие.

Местноанестезирующее действие артикаина усиливают и удлиняют сосудосуживающие лекарственные средства.

Неселективные бета-адреноблокаторы увеличивают риск развития гипертонического криза и выраженной брадикардии.

При одновременном применении с гепарином, ацетилсалициловой кислотой - риск кровотечений в месте инъекции возрастает.

При одновременном применении с миорелаксантами - усиление и удлинение действия миорелаксантов.

С ингибиторами холинэстеразы - замедление метаболизма местноанестезирующего средства.

С гипогликемическими средствами для приема внутрь: эpineфрин может ингибировать высвобождение инсулина из бета-клеток поджелудочной железы и уменьшить эффект гипогликемических средств для приема внутрь.

*С некоторыми средствами для ингаляционного наркоза (галотан)*

Галотан может повышать чувствительность сердца к катехоламинам и поэтому увеличивать риск развития нарушений ритма сердца после инъекций препарата Артикаин с адреналином 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!**

Во избежание внутрисосудистой инъекции необходимо проводить тест на аспирацию.

Инъекционное давление должно соответствовать чувствительности ткани.

Нельзя проводить инъекцию в воспаленную область.

Прием пищи возможен только после восстановления чувствительности.

Для предотвращения инфекции (в том числе вирусного гепатита) необходимо при каждом заборе раствора из ампулы всегда использовать новые стерильные шприцы и иглы.

Открытые картриджи нельзя использовать снова для других пациентов (опасность гепатита).

Нельзя использовать поврежденный картридж.

##### **Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами**

Возможность допуска пациента к управлению транспортными средствами или к занятию деятельностью, требующей высокой психической и двигательной реакции, определяется врачом индивидуально.

#### **Форма выпуска.**

Раствор для инъекций (40 мг + 0,01 мг)/мл.

По 1,7 мл препарата в картридже. По 10 картриджей в контурной пластиковой упаковке (поддоне) или в контурной ячеевой упаковке или во вкладыше для фиксации картриджей из картона. 1, 5, 10 контурных пластиковых упаковок (поддонов) или контурных ячеевых упаковок или вкладышей с картриджами вместе с инструкцией по применению в пачке из картона. На пачку с картриджами наклеивают две защитные этикетки с логотипом фирмы (контроль первого вскрытия).

По 1 мл или 2 мл препарата в ампулы нейтрального стекла. По 5 ампул в контурной пластиковой упаковке (поддоне) или в контурной ячеевой упаковке. По 1, 2 контурных пластиковых упаковок (поддонов) или контурных ячеевых упаковок вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.

##### **Упаковка для стационаров**

По 20, 50 контурных пластиковых упаковок (поддонов) или контурных ячеевых упаковок с ампулами вместе с инструкциями по применению в коробке из картона.

#### **Срок годности**

2 года - картриджи; 3 года - ампулы.

Не использовать по истечению срока годности, указанного на упаковке.

#### **Условия хранения**

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С, не допускать замораживания.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **Условия отпуска из аптек**

Отпускают по рецепту.

#### **Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии:**

ЗАО «Бинергия»,

Россия, 143910, Московская область, г. Балашиха, ул. Крупешина, д. 1.

Тел.: 8-495-580-55-02

Факс: 8-495-580-55-03

#### **Произведено:**

ФКП «Армавирская биофабрика»

#### **Юридический адрес/Адрес производственной площадки:**

Россия, 352212, Краснодарский край, Новокубанский район, пос. Прогресс, ул. Мечникова, д. 11.