

Состав

действующие вещества: Артикаин гидрохлорид, эпинефрин (адреналин) гидрохлорид;

1 мл артикаина гидрохлорида 40 мг и эпинефрина (адреналина) гидрохлорида 0,012 мг;

вспомогательные вещества: натрия метабисульфит (Е 223), натрия хлорид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость, практически свободная от примесей.

Фармакотерапевтическая группа

Средства для местной анестезии. Амиды. Артикаин, комбинации. Код АТХ N01B B58.

Фармакодинамика

Ультракаин® Д-С форте - местный анестетик амидного типа, который применяют в стоматологии для инфильтрационной и проводниковой анестезии. Препарат имеет быстрое начало действия (латентный период - 1-3 минуты), сильный обезболивающий эффект. Продолжительность эффективной анестезии составляет примерно 75 минут.

Считается, что механизм действия артикаина заключается в уменьшении проведения импульсов по нервным волокнам путем блокирования потенциалозависимых натриевых каналов клеточных мембран.

Клинические исследования, в которых было задействовано до 210 пациентов, показали, что применение детям в возрасте от 3,5 до 16 лет препаратов Ультракаин® Д-С в дозах до 5 мг/кг артикаина и Ультракаин® Д-С форте в дозе до 7 мг/кг артикаина обеспечивало надежное местное обезболивание при введении путем инфильтрационной (для нижней челюсти) и проводниковой (для верхней челюсти) анестезии. Продолжительность анестезии была одинаковой во всех возрастных группах и зависела от количества введенного анестетика.

Фармакокинетика

Уровень связывания артикаина с белками плазмы крови составляет 95%. После инъекции под слизистую оболочку полости рта период полувыведения составляет $25,3 \pm 3,3$ минуты. 10% артикаина метаболизируется в печени, преимущественно под действием эстераз, содержащихся в плазме крови и тканях. Артикаин выводится из организма преимущественно почками в виде артикаиновой кислоты.

У детей общая экспозиция после проведения инфильтрационной анестезии с вестибулярной стороны была подобна таковой у взрослых, однако максимальная концентрация в сыворотке крови достигались быстрее.

Доклинические данные по безопасности.

Результаты доклинических стандартных исследований по фармакологии безопасности, хронической токсичности, репродуктивной токсичности и генотоксичности свидетельствуют об отсутствии особой опасности для человека при применении терапевтических доз. В дозах, превышающих терапевтические, Артикаин оказывает кардиодепрессорное действие и может обнаруживать сосудорасширяющий эффект. Эпинефрин подавляет эффекты симпатомиметиков.

Во время исследований эмбриотоксичности артикаина не наблюдалось увеличения частоты фетальной смертности или возникновения пороков развития при ежедневном введении препарата в дозе до 20 мг/кг (крысы) и 12,5 мг/кг (кролики). Эпинефрин продемонстрировал токсическое воздействие на репродуктивную функцию у животных в дозах от 0,1 до 5 мг/кг (это в несколько раз превышает максимальную дозу эпинефрина, что попадает в организм при применении препарата Ультракаин® Д-С форте), который проявлялся возникновением врожденных пороков развития и нарушением маточно-плацентарного кровообращения.

Во время исследований эмбриофетотоксичности артикаина и эпинефрина не наблюдалось увеличения частоты пороков развития при ежедневном подкожном введении артикаина в дозах до 80 мг/кг (крысы) и 40 мг/кг (кролики).

Во время исследования влияния препарата на фертильность и ранней эмбриофетальной развитие у крыс не наблюдалось никакого негативного влияния на фертильность самок и самцов при применении доз, которые вызывают токсические явления в родительских особей.

Показания

Хирургические вмешательства на слизистой оболочке и костях, требующие более интенсивной ишемии; хирургические вмешательства на пульпе зуба (ампутация и экстирпация) удаление парадонтитных или сломанных зубов (остеотомия) длительные хирургические вмешательства чрескожный остеосинтез; удаление кист; хирургические вмешательства на слизистой оболочке десен; резекция вершины корня зуба.

Противопоказания

Ультракаин® Д-С форте нельзя применять при повышенной чувствительности к действующим веществам эpineфрина и артикаина, а также к сульфитов (мета бисульфита (Е 223) или к любой из вспомогательных веществ препарата.

В связи с наличием в составе препарата Ультракаин® Д-С форте артикаина его нельзя применять в случае:

- повышенной чувствительности к другим местным анестетикам амидного типа;
- тяжелых нарушений образования сердечных импульсов или нарушений проводимости (AV-блокады II-III степени, выраженной брадикардии);
- острой декомпенсированной сердечной недостаточности (острой застойной сердечной недостаточности);
- тяжелой артериальной гипотензии.

В связи с наличием в составе препарата Ультракаин® Д-С форте эpineфрина его нельзя применять:

- пациентам с закрытоугольной формой глаукомы;
- пациентам с гипертиреозом;
- пациентам с пароксизмальной тахикардией или абсолютной аритмией с тахикардией;
- пациентам, которые недавно (от 3 до 6 месяцев назад) перенесли инфаркт миокарда;
- пациентам, которые недавно (до 3 месяцев назад) перенесли операцию аортокоронарного шунтирования;
- пациентам, которые принимают неселективные бета-блокаторы, например пропранолол (существует риск развития гипертонического криза или тяжелой брадикардии)
- пациентам с феохромоцитомой;
- пациентам с тяжелой артериальной гипертензией;
- при одновременном лечении трициклическими антидепрессантами или ингибиторами МАО, поскольку их действующие вещества могут усиливать

сердечно-сосудистые эффекты адреналина. Это явление может наблюдаться в течение 14 дней после прекращения лечения ингибиторами МАО.

Противопоказано введение препарата.

В связи с наличием эpineфрина в составе препарата Ультракаин® Д-С форте его не следует применять для проведения анестезии конечностей (например пальцев рук), поскольку существует риск возникновения ишемии.

Ультракаин® Д-С форте нельзя применять пациентам с бронхиальной астмой при повышенной чувствительности к сульфитов. У таких пациентов введение препарата Ультракаин® Д-С форте может спровоцировать острую аллергическую реакцию с симптомами анафилаксии, например бронхоспазм.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Комбинации различных анестетиков имеют аддитивный эффект и оказывают более выраженное влияние на сердечно-сосудистую систему и ЦНС.

Гипертензивные эффекты вазоконстрикторов симпатомиметической типа (например эpineфрина) могут быть усилены трициклическими антидепрессантами или ингибиторами МАО. Поэтому такие комбинации противопоказаны (см. Раздел «Противопоказания»).

Препарат Ультракаин® Д-С форте запрещено применять пациентам, которые принимают неселективные бета-блокаторы, например пропранолол (см. Раздел «Противопоказания»).

Эpineфрин может блокировать высвобождение инсулина поджелудочной железой, в результате чего снижается действие пероральных противодиабетических препаратов.

Некоторые ингаляционные анестетики, такие как галотан, могут повышать чувствительность миокарда к катехоламинам, вызывая желудочковую аритмию после введения препарата Ультракаин® Д-С форте.

Следует помнить, что у пациентов, получающих лечение антикоагулянтами средствами (например гепарином, ацетилсалициловой кислотой), случайный прокол сосуда во время местной анестезии может вызвать серьезное кровотечение. У таких пациентов вообще существует повышенная склонность к кровотечениям.

Особенности применения

Пациентам с дефицитом холинэстеразы Ультракаин® Д-С форте можно назначать только при наличии абсолютных показаний для применения, поскольку в этом случае существует большая вероятность увеличения продолжительности действия препарата, а иногда и нежелательного усиления его действия.

Ультракаин® Д-С форте следует с осторожностью применять при:

- нарушениях свертывания крови;
- тяжелых нарушениях функции почек или печени;
- одновременном применении средств для ингаляционного наркоза, содержащие галогены (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»);
- наличии эпилепсии в анамнезе (см. раздел «Побочные реакции»).

С особой осторожностью Ультракаин® Д-С форте также следует применять пациентам с:

- сердечно-сосудистыми заболеваниями (например сердечной недостаточностью, ишемической болезнью сердца, стенокардией, инфарктом миокарда в анамнезе, сердечной аритмией, артериальной гипертензией)
- атеросклерозом;
- нарушениями мозгового кровообращения, инсультом в анамнезе
- хроническим бронхитом, эмфиземой легких,
- сахарным диабетом;
- значительно выраженной тревожностью.

Кроме этого, Ультракаин® Д-С содержит меньшее количество эпинефрина чем Ультракаин® Д-С форте, поэтому в случаях, указанных выше, целесообразнее применять Ультракаин® Д-С.

Нельзя проводить инъекции в зоне воспаления (инфицирование) (усиливается всасывание препарата Ультракаин® Д-С форте, что приводит к уменьшению его эффективности).

Перед тем как применять этот препарат, необходимо опросить больного, собрать медицинский анамнез, информацию о сопутствующих лекарственных средствах, которые он принимает, а также постоянно во время введения препарата поддерживать словесный контакт с пациентом. Нужно выполнить инъекционную пробу с введением от 5 до 10% дозы, если существует риск возникновения аллергической реакции.

Во избежание появления побочных эффектов необходимо:

- применять по лучшей дозу;
- перед инъекцией проводить аспирационную пробу в два этапа (во избежание внутрисосудистого введения препарата).

Рекомендуется, чтобы пациент принимал пищу только после полного восстановления чувствительности.

Ультракаин® Д-С форте содержит натрий, однако его количество не превышает 1 ммоль (23 мг) на 1 мл.

Применение детям.

Лиц, ухаживающих за маленькими детьми, следует предупредить о возможности повреждения мягких тканей вследствие их прикусывания в результате более длительного онемения мягких тканей после анестезии.

Натрия метабисульфит редко может вызывать реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

Препарат содержит менее 1 ммоль/дозу натрия, то есть практически свободный от натрия.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Только стоматолог должен решать, с какого времени после введения препарата Ультракаин® Д-С форте пациент снова может управлять транспортным средством или работать с механизмами. Страх, связанный с ожиданием стоматологической манипуляции, и стресс, которым она сопровождается, могут привести к изменению способности эффективно действовать, однако соответствующие исследования показали, что местная анестезия артикаина не вызывает какого-либо заметного ухудшения способности управлять транспортным средством.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Опыта применения артикаина беременным женщинам нет, за исключением его применения во время родов. В ходе исследований на животных каких-либо признаков прямого или косвенного негативного влияния артикаина на беременность, эмбриофетальное развитие, роды или постнатальное развитие не обнаружено. Исследования на животных показали, что адреналин в дозах, более высоких, чем максимальные рекомендованные, имеет токсическое воздействие на репродуктивную функцию (см. Раздел «Доклинические данные

по безопасности»). Эпинефрин и Артикаин проходят через плацентарный барьер, хотя Артикаин проходит значительно меньшей степени по сравнению с другими местными анестетиками. Концентрации артикаина в сыворотке крови новорожденных составляли примерно 30% его концентрации в крови матери. При случайном внутрисосудистом введении матери эпинефрин (адреналин) может уменьшать скорость кровотока в матке. Применение препарата Ультракаин® Д-С форте во время беременности возможно только после тщательного анализа соотношения польза-риск.

Предпочтительны препарата Ультракаин® Д-С, поскольку он содержит меньше эпинефрина (1: 200000), чем Ультракаин® Д-С форте.

Кормления грудью. В связи с быстрым уменьшением плазменных концентраций и быстрым выводом артикаина из организма он не обнаруживается в грудном молоке в количествах, которые должны клиническое значение. Эпинефрин проникает в грудное молоко, однако он также быстро распадается. При непродолжительном применении препарата нет необходимости прекращать кормление грудью.

Фертильность.

Исследования на лабораторных животных, которым вводили Артикаин 40 мг/мл + эпинефрин 0,01 мг/мл, не выявили никакого негативного влияния на фертильность (см. Раздел «Фармакологические свойства»). При применении препарата в терапевтических дозах отрицательного влияния препарата на фертильность человека не ожидается.

Способ применения и дозы

В случае неосложненного удаления щипцами зуба верхней челюсти при отсутствии воспаления достаточно ввести с вестибулярной стороны в переходную складку 1,7 мл препарата на каждый зуб. Иногда для достижения полной анестезии может потребоваться дополнительная вестибулярная инъекция 1-1,7 мл препарата. В большинстве случаев нет необходимости выполнять болезненную палатинальную инъекцию.

Если необходимо сделать разрез на небе или наложить на него швы, тогда с целью создания депо анестетика со стороны неба достаточно ввести 0,1 мл препарата.

При множественных экстракциях соседних зубов количество вестибулярных депо-инъекций в большинстве случаев можно уменьшить.

В случае неосложненного удаления щипцами премоляров нижней челюсти при отсутствии воспаления можно не проводить Мандибулярная анестезию, поскольку инфильтрационная анестезия, которая обеспечивается при введении 1,7 мл препарата на каждый зуб, обычно является достаточной. Если это не позволяет достичь полного обезболивания, сначала выполняется дополнительная вестибулярная инъекция в дозе 1-1,7 мл. И только тогда, когда это также не дало полной анестезии, показана стандартная нижнечелюстная анестезия.

Остатки, образующиеся после открывания ампул/использования картриджей, необходимо утилизировать.

Для хирургических вмешательств следует подобрать дозировку Ультракаину® Д-С форте в зависимости от серьезности и длительности операции.

В течение одного курса лечения взрослым можно вводить до 7 мг ультракаина (артикаина) на 1 кг массы тела. После предварительного проведения аспирационной пробы дозы до 500 мг (что составляет 12,5 мл раствора для инъекций) переносились хорошо.

Дети.

Лекарственное средство Ультракаин® Д-С форте следует вводить детям в минимальном количестве, которая позволяет достичь надлежащего обезболивания; количество вводимого препарата следует корректировать индивидуально, в зависимости от возраста и массы тела ребенка. Нельзя превышать максимальную дозу, которая составляет 7 мг артикаина на 1 кг массы тела.

Применение этого препарата детям в возрасте до 1 года не изучали.

Пациенты пожилого возраста и пациенты с тяжелой дисфункцией печени и почек.

У пациентов пожилого возраста и пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени и почек возможно увеличение концентрации артикаина в плазме крови. По таких пациентов следует проявлять особую осторожность и применять минимальную дозу, необходимую для достижения достаточной глубины анестезии.

Способ введения и длительность применения.

Ультракаин® Д-С форте предназначен для ввода под слизистую оболочку полости рта.

Во избежание внутрисосудистого введения препарата перед инъекцией всегда рекомендуется проводить аспирационную пробу. Аспирационную пробу проводят в два этапа, то есть повернув иглу на 90 ° или еще лучше на 180 °. Если применяются картриджи, то для выполнения этой пробы всего подходят шприцы «Юниджет® К» или «Юниджет® К варио».

Развития серьезных системных реакций, возникающих в результате случайного внутрисосудистого введения препарата, в большинстве случаев можно избежать, если применять такую технику выполнения инъекции после осуществления аспирации медленно вводят 0,1-0,2 мл, а затем, не ранее чем через 20-30 секунд, медленно вводят остальные препарата. Инъекционное давление должно соответствовать чувствительности ткани.

Применение соответствующих шприцов (для инфильтрационной анестезии – «Юниджет® К» или «Юниджет® К варио»; для интралигаментарно анестезии – «Ультраджет®») обеспечивает максимальную защиту от повреждения стекла картриджа и гарантирует плавность ввода. Для проведения инъекций нельзя использовать поврежденный картридж.

Во избежание инфицирования (например передачи вируса гепатита) для набора раствора всегда использовать новые стерильные иглы и шприцы.

Это лекарственное средство нельзя применять, если он мутный или изменил окраску.

Дети

Лекарственное средство Ультракаин® Д-С форте следует вводить детям в минимальном количестве, которая позволяет достичь надлежащего обезболивания; количество вводимого препарата следует корректировать индивидуально, в зависимости от возраста и массы тела ребенка. Нельзя превышать максимальную дозу, которая составляет 7 мг артикаина на 1 кг массы тела.

Применение этого препарата детям в возрасте до 1 года не изучали.

Передозировка

Симптомы передозировки.

Признаки возбуждения ЦНС: беспокойство, тревога, спутанность сознания, учащенное дыхание, тахикардия, повышение артериального давления, которое сопровождается покраснением лица, тошнотой, рвотой, тремором,

непроизвольными мышечными сокращениями, тонико-клоническими судорогами.

Признаки угнетения ЦНС: головокружение, снижение слуха, потеря способности говорить, ступор, потеря сознания, мышечная атония, вазомоторный паралич (слабость, бледность кожных покровов), одышка, летальный исход в результате паралича дыхательного центра.

Признаки угнетения сердечно-сосудистой деятельности: брадикардия, аритмия, фибрилляция желудочков, снижение артериального давления, цианоз, остановка сердца.

Неотложные мероприятия и антидоты.

При появлении первых признаков побочной реакции или токсического действия (например головокружение, двигательного возбуждения или ступора) следует прекратить инъекцию и перевести пациента в горизонтальное положение. Следует обеспечить проходимость дыхательных путей пациента, контролировать пульс и артериальное давление.

Даже тогда, когда симптомы интоксикации не сдаются тяжелыми, рекомендуется установить катетер для обеспечения немедленного доступа, если он будет нужным.

При нарушениях дыхания в зависимости от тяжести состояния рекомендуется применять кислород, а также в случае необходимости – искусственное дыхание. Если нужно, проводят интубацию трахеи в сочетании с контролируемой вентиляцией легких.

Непроизвольные мышечные сокращения или генерализованные судороги купируют внутривенным введением спазмолитических средств короткого действия (например суксаметония хлорида, диазепама). Также рекомендуется применять искусственное дыхание (кислород).

Снижение артериального давления, тахикардия или брадикардия можно устранить путем перевода пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями.

При тяжелых нарушениях кровообращения, а также при шоке, независимо от причины, после прекращения инъекции следует принять неотложные меры, а именно:

- перевести пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями, а также обеспечить проходимость дыхательных путей

(инсуфляция кислорода);

- начать внутривенное инфузионное введение сбалансированного электролитного раствора;
применить внутривенное введение глюкокортикоидов (например 250-1000 мг преднизолона или соответствующего количества его производного, например метилпреднизолона);
- восстановить объем циркулирующей крови (дополнительно в случае необходимости применяют плазмозаменители, альбумин человека).

В случае угрозы циркуляторного коллапса и нарастающей брадикардии проводят немедленную внутривенную инъекцию эпинефрина (адреналина). Для этого необходимо развести 1 мл раствора эпинефрина 1: 1000 до 10 мл (вместо этого можно применять раствор эпинефрина 1: 10000) и медленно ввести 0,25-1 мл этого раствора (содержит 0,025-0,1 мг эпинефрина), контролируя частоту пульса и артериальное давление (внимание: возможно возникновение аритмии сердца). Не вводить более 1 мл этого раствора (0,1 мг эпинефрина) во время одной инъекции. Если этого количества эпинефрина недостаточно, то его рекомендуется добавлять инфузионных растворов (скорость инфузии корректируется в соответствии с частотой пульса и артериального давления).

Тяжелые формы тахикардии и тахиаритмии можно устранить применением антиаритмических препаратов (но не неселективных бета-блокаторов, таких как пропранолол (смотрите раздел «Противопоказания»). В таких случаях необходимо применение кислорода и контроль за кровообращением.

В случае повышения артериального давления больным артериальной гипертензией, если необходимо, следует применять периферические вазодилататоры.

Побочные реакции

Для классификации частоты возникновения побочных эффектов применяют следующие категории: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $<1/10$); нечасто ($\geq 1/1\ 000$, $<1/100$); редко ($\geq 1/10\ 000$, $<1/1\ 000$) очень редко ($<1/10\ 000$) частота неизвестна (частоту нельзя рассчитать по имеющимся данным).

Со стороны иммунной системы.

Частота неизвестна: могут возникать реакции гиперчувствительности (аллергические и псевдоаллергические). Они могут проявляться в виде отека и/или воспаления в месте инъекции, а также независимо от места инъекции в виде покраснения кожи, зуда, конъюнктивита, ринита, отека лица вроде ангионевротического отека, включая отек верхней и/или нижней губы и/или

щек, отека голосовых связок с возникновением ощущение кома в горле и затруднением глотания, крапивницы и затруднение дыхания, которое может перейти в анафилактический шок.

Со стороны нервной системы.

Часто парестезии, гипестезия, головные боли, обусловленные преимущественно наличием эпинефрина.

Нечасто: головокружение.

Частота неизвестна:

- При применении слишком больших доз препарата или при случайном внутрисосудистом введении возможно появление дозозависимых реакций со стороны центральной нервной системы: беспокойство, нервозность, ступор (который иногда может прогрессировать до потери сознания), кома, нарушение дыхания, которое иногда прогрессирует до остановки дыхания, тремор м мышц, непроизвольные мышечные сокращения, которые иногда прогрессируют до генерализованных судорог.
- Теоретическая возможность поражения нервов существует при проведении любых стоматологических вмешательств из-за нарушения техники инъекционного введения или вследствие особенностей анатомического строения инъекционной участка. В таких случаях возможно поражение лицевого нерва и возникновения пареза лицевого нерва. Это может приводить к снижению вкусовой чувствительности.

Со стороны органов зрения.

Частота неизвестна: во время инъекции местного анестетика (или вскоре после нее) в область головы возможно также развитие нарушения зрения (нечеткость зрения, двоение в глазах, мидриаз, слепота), которое, как правило, является временным.

Со стороны сердечно-сосудистой системы.

Нечасто тахикардия.

Частота неизвестна: сердечные аритмии, повышение артериального давления, артериальная гипотензия, брадикардия, сердечная недостаточность и шок (который может представлять угрозу для жизни).

Со стороны желудочно-кишечного тракта.

Часто: тошнота, рвота.

Нарушение общего состояния и реакции в месте введения препарата.

Частота неизвестна: при непреднамеренной внутрисосудистой инъекции в месте введения препарата могут появиться зоны ишемии, иногда прогрессируют к возникновению некроза тканей (см. Раздел «Способ применения и дозы»).

Особые предостережения.

В редких случаях, особенно у больных бронхиальной астмой, препарат может вызвать реакции гиперчувствительности в связи с наличием в его составе натрия метабисульфита. Эти реакции клинически могут проявляться рвотой, поносом, стридорозным дыханием, острым приступом астмы, расстройствами сознания или шоком.

Педиатрическая популяция.

Согласно опубликованным результатам исследований, профиль безопасности у детей в возрасте от 4 до 18 лет был подобен профилю безопасности у взрослых. Однако чаще (до 16% детей) наблюдались случайные повреждения мягких тканей вследствие пролонгированного анестезии мягких тканей, особенно у детей в возрасте от 3 до 7 лет. В ретроспективном исследовании, которое включало 211 детей в возрасте от 1 до 4 лет, лечение зубов проводилось с применением до 4,2 мл лекарственных средств Ультракаин® Д-С или Ультракаин® Д-С форте, при этом не поступало сообщений о побочных эффектах.

Сообщение о подозреваемых побочных реакции.

Сообщение о подозреваемых побочных реакции после одобрения лекарственного средства разрешительными органами является важной процедурой. Это позволяет осуществлять постоянный мониторинг соотношения польза/риск применения этого лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать обо всех подозреваемых побочных реакции через национальную систему сообщений.

Срок годности

2,5 года.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте. Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке для защиты от действия света.

Несовместимость. Препарат не следует смешивать с другими лекарственными средствами.

Упаковка

По 1,7 мл в картридже; по 10 картриджей в картонной ячейковой упаковке; по 10 картонных ячейковых упаковок в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Санофи-Авентис Дойчланд ГмбХ.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Индустрипарк Хьохст-Брюнингштрассе 50, Н500, Н590, Н600, Н750, Н785, Н790, Франкфурт-на-Майне, Гессен, 65926, Германия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).