МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-004580-121217
СОГЛАСОВАНО

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Цертакаин

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Цертакаин

Международное непатентованное или группировочное наименование:

Артикаин + [Эпинефрин]

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав

1 мл препарата содержит:

Действующие вещества:	*40 мг/мл + 0,005 мг/мл*	*40 мг/мл + 0,01 мг/мл*
Артикаина гидрохлорид	40,0 мг	
Адреналина тартрат в пересчете на адреналин (эпинефрин)	0,005 мг	0,010 мг
Вспомогательные вещества:		
Натрия хлорид	1,23 мг	
Хлористоводородной кислоты раствор 5 М или натрия гидроксида раствор 3 М	до pH 2,7 – 5,2	
Вода для инъекций	до 1,0 мл	

Описание

Прозрачная бесцветная или коричневато-желтая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Местноанестезирующее средство + альфа- и бета-адреномиметик.

Код АТХ: N01BB58

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Препарат Цертакаин, применяемый для местной инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологии, является комбинированным препаратом, в состав которого входит артикаин (местноанестезирующее средство амидного типа) и адреналин (эпинефрин) (сосудосуживающее средство). Эпинефрин добавляется в состав препарата

для пролонгирования действия анестезии. Артикаин оказывает местноанестезирующее действие за счет блокады потенциал-зависимых натриевых каналов в клеточной мембране нейронов, что приводит к обратимому угнетению проводимости импульсов по нервному волокну и обратимой потере чувствительности.

Препарат Цертакаин оказывает быстрое действие (латентный период – от 1 до 3 мин). Продолжительность анестезии составляет для дозировки 40 мг/мл + 0,005 мг/мл - не менее 45 мин, для дозировки 40 мг/мл + 0,01 мг/мл - не менее 75 мин. Вследствие низкого содержания эпинефрина в препарате его влияние на сердечно-сосудистую систему незначительно: почти не отмечается повышение артериального давления и увеличения частоты сердечных сокращений.

Дети

Опубликованные исследования показали, что у детей в возрасте от 3,5 до 16 лет применение препарата в дозе 5 мг/кг массы тела обеспечивало достаточное местноанестезирующее действие при проведении нижнечелюстной инфильтрационной или верхнечелюстной проводниковой анестезии. Продолжительность анестезии была сопоставима во всех возрастных группах и зависела от введенного объема препарата.

Фармакокинетика

Артикаин быстро и практически сразу после введения метаболизируется (путем гидролиза) неспецифическими плазменными эстеразами в тканях и крови (90 %); остальные 10 % дозы артикаина метаболизируется микросомальными ферментами печени. Образующийся при этом главный метаболит артикаина – артикаиновая кислота – не обладает местноанестезирующей активностью и системной токсичностью, что позволяет проводить повторные введения препарата.

Концентрации артикаина в крови в области альвеол зуба после подслизистого введения в сотни раз превышают концентрации артикаина в системном кровотоке. Связывание артикаина с белками плазмы крови составляет приблизительно 95 %.

Артикаин выводится через почки, главным образом, в виде артикаиновой кислоты. После подслизистого введения период полувыведения составляет приблизительно 25 мин.

Артикаин проникает через плацентарный барьер, практически не выделяется с грудным молоком.

Показания к применению

Показан для местной анестезии (инфильтрационная и проводниковая анестезия) в стоматологии.

Для дозировки 40 мг/мл + 0,005 мг/мл: при плановых вмешательствах, таких как неосложненное удаление одного или нескольких зубов, обработка кариозных полостей и обтачивание зубов перед протезированием.

Для дозировки 40 мг/мл + 0,01 мг/мл: при травматических вмешательствах и при необходимости выраженного гемостаза или улучшения визуализации операционного поля: стоматологические операции 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; чрескостный остеосинтез; эксцизия кист; вмешательства на слизистой оболочке десны; резекция верхушки корня зуба.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к артикаину или к другим местноанестезирующим средствам амидного типа, эпинефрину, сульфитам (в частности, у пациентов, страдающих бронхиальной астмой с повышенной чувствительностью к сульфитам, так как возможны острые аллергические реакции с симптомами анафилактического шока, таким как бронхоспазм), или к любому другому из вспомогательных компонентов препарата.

Противопоказания в связи с наличием в составе препарата артикаина

- тяжелые нарушения функции синусового узла или тяжелые нарушения проводимости (например, выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада II или III степени);
- острая декомпенсированная сердечная недостаточность;
- тяжелая форма артериальной гипотензии.

Противопоказания в связи с наличием в составе препарата эпинефрина

- закрытоугольная глаукома;
- гиперфункция щитовидной железы;
- пароксизмальная тахикардия, тахиаритмия;
- недавно перенесенный инфаркт миокарда (до 6 месяцев);
- недавно перенесенное аортокоронарное шунтирование (до 3 месяцев);
- прием неселективных бета-адреноблокаторов, например, пропранолола (риск гипертонического криза и тяжелой формы брадикардии);
- феохромоцитома;
- тяжелая форма артериальной гипертензии.

С осторожностью

- у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, ишемической болезнью сердца, стенокардией, атеросклерозом, инфарктом миокарда в анамнезе, нарушениями ритма сердца, артериальной гипертензией;
- у пациентов с цереброваскулярными нарушениями, инсультом в анамнезе;
- у пациентов с хроническим бронхитом, эмфиземой легких;
- у пациентов с сахарным диабетом (потенциальный риск изменения концентрации глюкозы в крови);
- у пациентов с недостаточностью холинэстеразы (применение возможно только в случае крайней необходимости, так как возможно пролонгирование и выраженное усиление действия препарата);
- у пациентов с нарушением свертываемости крови;
- у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени и почек;
- у пациентов с выраженным возбуждением;
- у пациентов с эпилепсией в анамнезе;
- при совместном применении с галогенсодержащими средствами при проведении ингаляционной анестезии (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Артикаин и эпинефрин проникают через плацентарный барьер. Концентрация артикаина в сыворотке крови у новорожденных (после введения препарата матери) составляет приблизительно 30 % от концентрации артикаина в сыворотке крови матери.

Решение о применении препарата может быть принято только в случае, если потенциальная польза от применения для матери превышает потенциальный риск для плода.

При случайном внутрисосудистом введении эпинефрин может уменьшать кровоснабжение матки.

Период грудного вскармливания

При краткосрочном применении препарата в период грудного вскармливания, как правило, не требуется прерывать кормление грудью, так как в грудном молоке не обнаруживается клинически значимых концентраций артикаина и эпинефрина.

Фертильность

В исследованиях на животных с применением артикаина 40 мг/мл и эпинефрина 0,01 мг/мл не отмечено влияния на фертильность у особей мужского и женского пола. Не ожидается влияния на фертильность у человека при применении артикаина и эпинефрина в терапевтических дозах.

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 того чтобы избежать случайного попадания препарата в кровеносные сосуды, перед его введением всегда следует проводить аспирационную пробу (в два этапа).

Основных системных реакций, которые могут развиться в результате случайного внутрисосудистого введения препарата, можно избежать, соблюдая технику инъекции: после проведения аспирационной пробы медленно вводят 0,1-0,2 мл препарата, затем, не ранее чем через 20-30 секунд, медленно вводят остальную дозу препарата. Давление инъекции должно соответствовать чувствительности тканей.

Для анестезии при неосложненном удалении зубов верхней челюсти при отсутствии воспаления обычно достаточно создания депо препарата 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 обработке полостей и обтачивании зубов под коронки, за исключением нижних коренных зубов, в зависимости от объема и продолжительности лечения показано введение препарата Цертакаин 40 мг/мл + 0,005 мг/мл в область переходной складки с вестибулярной стороны в дозе 0,5-1,7 мл на зуб.

При хирургических вмешательствах препарат Цертакаин 40 мг/мл + 0,01 мг/мл 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 переносили дозы до 500 мг (соответствует 12,5 мл раствора для инъекций).

Для пациентов детского возраста (старше 4 лет) следует применять минимальные дозы, необходимые для достижения адекватной анестезии, доза препарата Цертакаин подбирается в зависимости от возраста и массы тела ребенка, но доза артикаина не должна превышать 7 мг на 1 кг массы тела (0,175 мл/кг). Применение препарата у детей младше 1 года не изучалось.

Для 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.

Побочное действие

Частота развития побочных эффектов представлена в соответствии с классификацией, рекомендованной Всемирной Организацией Здравоохранения:

очень часто (≥ 1/10);

часто (≥ 1/100, < 1/10);

нечасто (≥ 1/1000, < 1/100);

редко (≥ 1/10000, < 1/1000);

очень редко (< 1/10000), включая отдельные сообщения;

частота неизвестна (по имеющимся данным определить частоту встречаемости не представляется возможным).

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: парестезия, гипестезия; головная боль, главным образом, вследствие наличия в составе препарата эпинефрина.

Нечасто: головокружение.

Частота неизвестна: дозозависимые реакции со стороны центральной нервной системы:

ажитация, нервозность, ступор, иногда прогрессирующий до потери сознания, кома, дыхательные расстройства, иногда прогрессирующие до остановки дыхания, мышечный тремор, мышечные подергивания, иногда прогрессирующие до генерализованных судорог.

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

Нарушения со стороны органа зрения

Частота неизвестна: зрительные расстройства (нечеткость зрительного восприятия, мидриаз, слепота, двоение в глазах), обычно обратимые и возникающие во время или через короткое время после инъекции местноанестезирующего средства.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: тошнота, рвота.

Нарушения со стороны сердца и сосудов

Нечасто: тахикардия, нарушение сердечного ритма, повышение артериального давления.

Частота неизвестна: снижение артериального давления, брадикардия, сердечная недостаточность и шок.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: аллергические реакции (отечность и воспаление в месте инъекции), гиперемия кожных покровов, зуд, конъюнктивит, ринит, ангионевротический отек (отек верхней и/или нижней губы, щек, отек голосовых связок с ощущением «комка в горле», затруднения глотания, крапивница, затруднения дыхания). Любые из этих проявлений могут прогрессировать до анафилактического шока.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Частота неизвестна: при случайном внутрисосудистом введении возможно появление зон ишемии в месте введения, вплоть до некроза тканей.

Дети

В проведенных исследованиях профиль безопасности у детей и подростков в возрасте от 4 до 18 лет был сопоставим с таковым у взрослых пациентов. Однако вследствие пролонгированной анестезии мягких тканей ротовой полости у детей более часто отмечалось повреждение мягких тканей (у 16 % детей), особенно в возрасте от 3 до 7 лет. В ретроспективном исследовании детей в возрасте от 1 года до 4 лет в процессе которого стоматологические вмешательства проводились с применением препаратов, содержащих

артикаин 40 мг/мл + эпинефрин 0,005 мг/мл в дозе 4,2 мл о существовании побочных эффектов не сообщалось.

Передозировка

Симптомы

Наиболее распространенными симптомами являются реакции сердечно-сосудистой системы и нервной системы, тошнота, двигательное беспокойство, помутнение сознания во время инъекции, нарушения дыхания, подергивания мышц, судороги, шок.

Лечение

Лечение симптоматическое. При появлении первых признаков передозировки или побочных действий, например, тошноты, двигательного беспокойства, помутнения сознания во время инъекции, ее следует прервать, пациента перевести в горизонтальное положение, очистить дыхательные пути, контролировать пульс и артериальное давление. Рекомендуется, даже если симптомы кажутся не слишком выраженными, обеспечить внутривенный доступ. При нарушениях дыхания, в зависимости от степени тяжести, дать кислород, в некоторых случаях проводить искусственное дыхание. Центральные аналептики противопоказаны. Подергивания мышц или генерализованные судороги снимаются внутривенной инъекцией барбитуратов короткого или ультракороткого действия. Падение артериального давления, тахикардия или брадикардия часто устраняются при переводе пациента в горизонтальное положение. При тяжелых нарушениях кровообращения и шоке любого генеза после прекращения инъекции показаны экстренные меры: обеспечение проходимости дыхательных путей (кислородная инсуфляция), внутривенное вливание жидкости (электролитный раствор), глюкокортикостероидов. Дополнительно можно ввести плазмозаменители, альбумин.

При угрожающем нарушении кровообращения и нарастающей брадикардии вводится от 0,25 мл до 1 мл эпинефрина. Внутривенная инъекция эпинефрина должна производится медленно под контролем частоты пульса и артериального давления.

Однократная доза внутривенной инъекции эпинефрина не должна превышать 0,1 мг, в дальнейшем при необходимости эпинефрин можно вводить капельно (скорость вливания через капельницу регулируется в зависимости от частоты пульса и давления крови). Тяжелые формы тахикардии и тахиаритмии могут быть устранены применением антиаритмических препаратов, однако не следует использовать неселективные бета-адреноблокаторы. Подача кислорода и контроль за кровообращением необходимы в любом случае. При повышении артериального давления у больных, страдающих

артериальной гипертонией, следует, в случае необходимости, применять периферические вазодилататоры.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Одновременное применение противопоказано

При одновременном применении с *некардиоселективными бета-адреноблокаторам, например, пропанололом,* возможно развитие гипертонического криза и выраженной брадикардии.

Одновременное применение возможно с осторожностью

Действие вазоконстрикторов, повышающих артериальное давление, например, эпинефрина, может усиливаться *трициклическими антидепрессантами или ингибиторами моноаминоксидазы*.

Местноанестезирующие средства усиливают действие *лекарственных средств, угнетающих центральную нервную систему*. Наркотические анальгетики усиливают действие местноанестезирующих средств, однако повышают риск угнетения дыхания.

При применении препарата Цертакаин у пациентов, принимающих *гепарин* или *ацетилсалициловую кислоту*, возможно развитие кровотечений в месте инъекций.

При одновременном применении с *ингибиторами холинэстеразы* возможно замедление метаболизма местноанестезирующих средств, в результате чего возможно пролонгирование и выраженное усиление действия артикаина.

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

Некоторые средства для ингаляционной анестезии, например, *галотан*, могут повышать чувствительность миокарда к катехоламинам и увеличивать риск развития нарушений сердечного ритма после инъекций препарата Цертакаин.

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

Особые указания

Регионарная и местная анестезия должна проводиться опытными специалистами в соотвествующем образом оборудованном помещении при доступности готового к немедленному использованию оборудования и препаратов, необходимых для проведения мониторинга сердечной деятельности и реанимационных мероприятий. Персонал, выполняющий анестезию, должен быть квалифицированным и обучен технике

выполнения анестезии, должен быть знаком с диагностикой и лечением системных токсических реакций, нежелательных явлений, реакций и других осложнений.

Для предотвращения инфицирования (в том числе, вирусом гепатита) необходимо следить за тем, чтобы при заборе раствора из ампул всегда использовались новые стерильные шприцы и иглы.

Во избежание развития побочных реакций необходимо применять минимальные эффективные дозы препарата и перед введением препарата проводить двухэтапную аспирационную пробу (см. раздел «Способ применения и дозы»).

При применении препарата возможно непреднамеренное травмирование губ, щек, слизистой оболочки и языка, особенно у детей, из-за снижения чувствительности. Пациента следует предупредить о том, что прием пищи возможен только после прекращения действия местной анестезии и восстановления чувствительности.

Препарат предназначен для применения в стоматологии. Использование для анестезии дистальных отделов конечностей недопустимо в связи с риском развития ишемии из-за содержания эпинефрина.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

Возможность допуска пациента к управлению транспортными средствами и механизмами определяется врачом.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 40 мг/мл + 0,005 мг/мл и 40 мг/мл + 0,01 мг/мл.

По 2 мл в ампулы из бесцветного или окрашенного стекла. По 5 или 10 ампул в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной или полиэтилентерефталатной с пленкой полимерной или фольгой алюминиевой лакированной или без пленки полимерной и фольги алюминиевой лакированной или в форме из картона с ячейками для укладки ампул.

По 1, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок или форм из картона с 10 ампулами или по 2, 10 или 20 контурных ячейковых упаковок или форм из картона с 5 ампулами вместе с инструкцией по применению и скарификатором ампульным или без него в пачке из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять после окончания срока годности!

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

ООО «Гротекс»

Россия, 195279, Санкт-Петербург

Индустриальный пр., д. 71, к. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

Производитель/организация, принимающая претензии

ООО «Гротекс»

Россия, 195279, Санкт-Петербург

Индустриальный пр., д. 71, к. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

www.solopharm.com

www.certacain.ru

Заместитель директора по развитию
ООО «Гротекс» С. В. Сергеев