

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Ультракаин Д, 40 мг/мл, раствор для инъекций

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: артикин.

В 1 мл раствора содержится: 40 мг артикина гидрохлорида.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрий (см. раздел 4.4).

Полный список вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для инъекций.

Прозрачная бесцветная жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Ультракаин Д показан к применению у взрослых и детей старше 4 лет для местной анестезии (инфильтрационной и проводниковой) в стоматологии.

Артикаин без эпинефрина применяется преимущественно для коротких процедур у пациентов, у которых применение эпинефрина недопустимо (например, при сердечно-сосудистых заболеваниях или при наличии аллергии к сульфитам), или при необходимости введения небольших объемов препарата (в области передних зубов, нёба).

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

При инфильтрационной анестезии при отсутствии воспаления обычно вводят 1,7 мл Ультракаина Д на зуб или на два смежных зуба. При проводниковой анестезии нижнего альвеолярного нерва примерно требуется 1-1,7 мл препарата. Для дополнительных инъекций следует применять половину дозы или полную дозу.

Максимальная доза для взрослых составляет 4 мг артикаина гидрохлорида на кг массы тела.

Для того, чтобы избежать случайного попадания препарата в кровеносные сосуды, перед его введением всегда следует проводить аспирационную пробу (в два этапа). Инъекционное давление во время введения препарата должно корректироваться в зависимости от тканевой чувствительности.

Одновременное применение седативных препаратов: у пациентов, которые принимают седативные препараты, следует рассмотреть вопрос о снижении дозы местных анестетиков из-за дополнительного угнетения центральной нервной системы.

Способ применения

Препарат предназначен для инфильтрации и перинеурального введения в ротовой полости и может вводиться только в ткани, где отсутствует воспаление.

Проводить инъекцию в воспаленные ткани нельзя.

Препарат нельзя вводить внутривенно.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к артикину или к другим местноанестезирующим средствам амидного типа, или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- тяжелые нарушения функции синусового узла или тяжелые нарушения проводимости (такие как выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада II-III степени);
- острая декомпенсированная сердечная недостаточность;
- тяжелая артериальная гипотензия;
- детский возраст до 4-х лет (отсутствие достаточного клинического опыта);
- эпилепсия, которая не контролируется в должной степени с помощью лекарственных препаратов.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- недостаточность холинэстеразы: применение возможно только в случае крайней необходимости, так как возможно пролонгирование и выраженное усиление действия препарата;
- эпилепсия в анамнезе (см. раздел 4.8);
- миастения гравис, по поводу которой пациент принимает ингибиторы ацетилхолинэстеразы. Для проведения эффективной анестезии необходимо применять более низкие дозы препарата;
- порфирия. У пациентов с острой порфирией препарат следует применять только в случае, если недоступны другие альтернативные методы. У всех пациентов с порфирией следует предпринимать соответствующие меры предосторожности, поскольку данный лекарственный препарат может усугубить течение порфирии.

Доза препарата должна быть снижена в случае снижения количества кислорода в тканях организма (гипоксия), высокого содержания калия (гиперкалиемия) и метаболических расстройств, возникших в результате повышенного уровня кислоты в крови (метаболический ацидоз).

Такие нежелательные явления, как повышенная возбудимость, беспокойство, нервозность, мышечный тремор или подергивания, шум в ушах, нечеткое зрение или двоение в глазах, нарушение речи (дизартрия, логорея) могут быть признаками угнетения ЦНС. В случае появления данных симптомов следует попросить пациента выполнить гипервентиляцию и производить за ним соответствующее наблюдение.

Особые указания

Препарат не предназначен для длительного введения (более 20 мин) и для обширных стоматологических хирургических вмешательств.

Следует отметить, что при лечении антикоагулянтными препаратами (такими как гепарин или ацетилсалициловая кислота), как правило, повышается вероятность кровотечения, таким образом, случайное повреждение сосудов во время местной анестезии может привести к серьезному кровотечению.

Перед установкой картриджа в шприц следует осмотреть его на наличие дефектов или поврежденных деталей (например, деформированный поршень или его наконечник). Нельзя использовать шприц, если он не в идеальном состоянии, так как это может привести к повреждению картриджа.

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

Открытые картриджи нельзя использовать повторно для других пациентов!

Нельзя использовать для инъекций поврежденный картридж.

Пациентам требуется наблюдение за состоянием сердечно-сосудистой системы, дыхательной системы, ЦНС. Следует соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов со стенокардией, атеросклерозом, нарушениями свертывания крови, тяжелыми нарушениями функции печени или почек.

Для того, чтобы избежать риска развития побочных реакций, необходимо использовать минимальные эффективные дозы препарата и перед его введением проводить двухэтапную аспирационную пробу.

Регионарная и местная анестезия должна проводиться опытными специалистами в соответствующим 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 и других осложнений.

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

Вспомогательные вещества

Натрий

Ультракаин Д содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на 1 мл, то есть, по сути, не содержит натрия.

Дети

Детей и их родителей следует предупреждать о риске случайного повреждения мягких тканей зубами (прикусывание) из-за снижения чувствительности тканей вследствие действия препарата.

4.5. Взаимодействия с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Лекарственные средства, угнетающие центральную нервную систему (ЦНС): местноанестезирующие средства усиливают действие лекарственных средств, угнетающих ЦНС. Наркотические анальгетики усиливают действие местноанестезирующих средств и повышают риск угнетения дыхания.

Гепарин, ацетилсалициловая кислота: при проведении инъекций препарата Ультракаин Д пациентам, получающим гепарин или ацетилсалициловую кислоту, возможно развитие кровотечений в месте инъекции.

Ингибиторы холинэстеразы: замедление метаболизма местноанестезирующих лекарственных средств, в результате чего возможно пролонгирование и выраженное усиление действия артикаина.

Сосудосуживающие средства: местноанестезирующее действие артикаина усиливают и удлиняют сосудосуживающие лекарственные средства.

Седативные препараты (такие как бензодиазепины, опиоиды): у пациентов, которые принимают седативные препараты, следует рассмотреть вопрос о снижении дозы местных анестетиков из-за дополнительного угнетения центральной нервной системы.

Другие местные анестетики: совместное применение препарата с другими местными анестетиками может привести к усилению побочных эффектов (токсичности). В этих случаях необходимо снижать дозу применяемых местных анестетиков.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

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

Ввиду недостаточности клинических данных решение о применении препарата врачом-стоматологом может быть принято только в том случае, если потенциальная польза от его применения для матери оправдывает потенциальный риск для плода.

Лактация

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.

Из-за быстрого снижения уровня артикаина в сыворотке крови и его быстрой экскреции клинически значимые количества артикаина в грудном молоке не обнаруживаются.

Фертильность

В исследованиях фертильности у крыс при применении артикаина в токсических дозах не отмечено влияния на фертильность у особей мужского и женского пола. Не ожидается влияния на фертильность у человека при применении артикаина в терапевтических дозах.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Решение о том, когда пациент после стоматологического вмешательства сможет вернуться к управлению транспортными средствами или занятиям другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций, должен принимать врач.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Наиболее часто возникающими нежелательными реакциями при применении препарата Ультракаин Д являются нарушения чувствительности, опухание и изъязвления в месте введения.

Резюме нежелательных реакций

Возможные нежелательные реакции при применении препарата Ультракаин Д приведены ниже в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения по нисходящей частоте возникновения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: аллергические и аллергоподобные реакции. В месте инъекции они могут проявляться в виде отека или воспаления слизистой оболочки. Проявлениями, не связанными с местом введения, могут быть гиперемия кожных

покровов, зуд, 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 затруднениями глотания, крапивницей и затруднением дыхания. Любые из этих проявлений могут прогрессировать до анафилактического шока.

Психические нарушения

Частота неизвестна: беспокойство, чувство тревоги и эйфорическое настроение.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: парестезия, гипестезия (устойчивая гипестезия, агевзия и дисгевзия) после проведения анестезии нижнечелюстного или нижнего зубного нерва.

Нечасто: головокружение

Частота неизвестна: дозозависимые реакции со стороны центральной нервной системы: агитация, нервозность, ступор, иногда прогрессирующий до потери сознания, кома, дыхательные расстройства, иногда прогрессирующие до остановки дыхания, мышечный тремор, мышечные подергивания, иногда прогрессирующие до генерализованных судорог.

Нарушения со стороны органа зрения

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

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Частота неизвестна: гиперacusия и шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца

Частота неизвестна: брадикардия, сердечная недостаточность.

Нарушения со стороны сосудов

Частота неизвестна: снижение артериального давления, шок.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Частота неизвестна: бронхоспазм, бронхиальная астма, одышка и дисфония (осиплость голоса).

Желудочно-кишечные нарушения

Часто: припухший язык, припухлость губ, десен и лица, эксфолиация (отслоение)/изъязвление слизистой оболочки полости рта, стоматит, глоссит, боль в языке, дисфагия, диарея, тошнота и рвота.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани

Частота неизвестна: боль в шее, усугубление нейромышечных проявлений синдрома Кернса — Сейра и тризмы.

Описание отдельных нежелательных реакций

Парестезия может проявляться в виде различных симптомов патологических ощущений. Парестезия может быть определена как спонтанное, обычно безболезненное, нарушение чувствительности (например, ощущение жжения, укола, покалывания или зуда), значительно превышающее ожидаемую продолжительность анестезии. Большинство выявленных случаев парестезии вследствие проведения лечения зубов являются временными и разрешаются в течение нескольких дней, недель или месяцев. Устойчивая парестезия, возникающая в большинстве случаев вследствие проводниковой анестезии нижней челюсти, характеризуется медленным, неполным выздоровлением или его отсутствием.

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.

Дети

Профиль безопасности был сходным у детей и подростков в возрасте от 4 до 18 лет по сравнению со взрослыми.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения "польза - риск" лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр.1

Телефон: +7(800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Виды передозировки

Передозировка местными анестетиками часто используется для описания:

- абсолютной передозировки;
- относительной передозировки, такой как:
 - случайное введение в кровеносный сосуд, или
 - патологически быстрое всасывание в системный кровоток, или
 - замедленный метаболизм и выведение лекарственного препарата.

В случае относительной передозировки симптомы у пациентов в основном появляются в течение первых минут. В то время как в случае абсолютной передозировки признаки токсичности, в зависимости от места введения, появляются позже после инъекции.

Симптомы

При передозировке (абсолютной или относительной), поскольку возбуждение может быть преходящим или отсутствовать, первым проявлением может быть сонливость, переходящая в потерю сознания и остановку дыхания.

Выраженность симптомов зависит от дозы, с прогрессированием тяжести в виде неврологических проявлений токсичности (головная боль, беспокойство, агитация, тремор, спутанность сознания, нарушение ориентации, головокружение (предобморочное ощущение), ступор, пресинкопе, синкопе, потеря сознания, глубокое угнетение ЦНС, кома, судороги (включая тонико-клонический припадок), нарушение речи (например, дизартрия, логорея), вертиго, нарушение равновесия

(неустойчивость), нарушение со стороны органа зрения (мидриаз, помутнение в поле зрения, нарушение аккомодации), после чего наблюдаются нарушения со стороны сосудистой системы (бледность кожных покровов (местная, регионарная, общая), дыхательной системы (зевота, учащенное дыхание, замедленное дыхание, угнетение дыхания, остановка дыхания) и, наконец, со стороны сердца (угнетение функции миокарда, прекращение сердечной деятельности).

Ацидоз усугубляет токсическое действие местных анестетиков.

Лечение

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, ставить внутривенный катетер для того, чтобы в случае необходимости, иметь возможность немедленно провести 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 врачебным контролем (риск гемодинамических расстройств и угнетения дыхания) и с одновременной подачей кислорода и мониторированием 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, в том числе, альбумина.

При развитии 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: анестетики; местные анестетики; амиды.

Код АТХ: N01BB08

Ультракаин Д – местноанестезирующий препарат быстрого действия, содержащий активный компонент амидного типа – артикина гидрохлорид. Артикаин является местноанестезирующим средством амидного типа, применяемым для инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологии.

Препарат Ультракаин Д не содержит эпинефрин и применяется, когда добавление эпинефрина к местноанестезирующему средству необязательно, или применение эпинефрина противопоказано.

Механизм действия

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 обратной потере чувствительности.

Фармакодинамические эффекты

Действие препарата начинается быстро, в течение 1-3 мин. Продолжительность анестезии составляет примерно 20 мин.

5.2. Фармакокинетические свойства

Биотрансформация

Артикаин быстро и практически сразу после введения метаболизируется (путем гидролиза) неспецифическими плазменными эстеразами в тканях и крови (90 %); остальные 10 % дозы артикаина метаболизируются микросомальными ферментами печени. Образующийся при этом главный метаболит артикаина – артикаиновая кислота не обладает местноанестезирующей активностью и системной токсичностью, что позволяет проводить повторные введения препарата. Связывание артикаина с белками плазмы крови составляет приблизительно 95 %.

Элиминация

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.

5.3. Данные доклинической безопасности

На основании общепринятых исследований фармакологической безопасности, хронической токсичности, репродуктивной токсичности и генотоксичности, доклинические данные не указывают на какую-либо особую опасность для человека при терапевтических дозах. В дозах, превышающих терапевтические, артикаин обладает кардиодепрессивными свойствами и может оказывать сосудорасширяющее действие.

В исследованиях эмбриотоксичности артикаина не наблюдалось ни увеличения смертности плода, ни пороков развития при внутривенном введении суточных доз до 20 мг/кг (крысы) и 12,5 мг/кг (кролики).

В исследованиях эмбриофетальной токсичности артикаина и эпинефрина не наблюдалось увеличения числа пороков развития при суточных дозах артикаина до

80 мг/кг (крысы) и 40 мг/кг (кролики) при подкожном введении. В исследовании репродуктивной токсичности и токсического воздействия на раннее эмбриональное развитие у крыс не было выявлено никаких неблагоприятных последствий для фертильности самцов или самок при применении токсичных для родителей доз.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

натрия хлорид,
вода для инъекций.

6.2. Несовместимость

В связи с отсутствием исследований совместимости, данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами.

6.3. Срок годности

3 года

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

При температуре не выше 25°C. Не замораживать.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 1,7 мл в картридж прозрачного, бесцветного стекла (тип 1). По 10 картриджей помещают в блок из картона. По 1 блоку из картона помещают в картонную пачку вместе с листком-вкладышем.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата или работы с ним

Весь оставшийся лекарственный препарат и отходы следует уничтожить в установленном порядке.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Канада

Новокол Фармасьютикал оф Канада Инк.,
25 Вулсли Корт, Кембридж, провинция Онтарио, N1R 6X3

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения на территории Союза

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО "Биомапас"

105064, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Басманный, ул. Земляной Вал, д. 9,
помещ. 2/1.

Телефон: +7(499) 504-28-75

pv.ru@biomapas.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Ульттракаин Д доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>