



## ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства  
(информация для специалистов)  
**АРТИКАИН С ЭПИНЕФРИНОМ**

**Торговое название:** Артикаин с эпинефрином.

**Международное непатентованное наименование:** -.

**Лекарственная форма:** раствор для инъекций (40 мг + 0,005 мг)/1мл.

**Описание:** прозрачная бесцветная или с зеленоватым оттенком жидкость.

**Состав:** одна ампула (2 мл) содержит: *действующих веществ* - артикаина гидрохлорида – 80 мг, адреналина (в виде адреналина тартрата) – 0,010 мг (0,018 мг); *вспомогательные вещества:* динатрия эдетат, натрия хлорид, раствор хлористоводородной кислоты 0,1 М, воду для инъекций.

**Фармакотерапевтическая группа:** средства для местной анестезии. Амиды.

**Код АТХ – N01BB58**

**Фармакологические свойства**

*Фармакодинамика*

Артикаин с эпинефрином – местный анестетик для инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологической практике. Оказывает быстрое действие (латентный период - от 1 до 3 минут). Продолжительность анестезии составляет около 45 мин.

Предполагается, что механизм действия артикаина основан на ингибировании проводимости нервных волокон за счет блокады потенциалозависимых  $\text{Na}^+$  каналов клеточной мембраны.

Вследствие низкого содержания эpineфрина в лекарственном средстве его влияние на сердечно-сосудистую систему выражено незначительно: почти не отмечается повышения артериального давления и увеличения частоты сердечных сокращений.

#### Педиатрические пациенты

В ходе клинических исследований, включавших до 210 пациентов, было показано, что у детей в возрасте от 3,5 до 16 лет Артикаин с эpineфрином в дозах до 5 мг/кг артикаина в виде (нижнечелюстной) инфильтрации или (верхнечелюстной) нервной блокады обеспечивают успешную местную анестезию. Продолжительность анестезии была схожа с продолжительностью для всех возрастных групп и зависела от введенного объема.

#### *Фармакокинетика*

Связывание с белками плазмы артикаина составляет 95 %. После инъекции в подслизистую оболочку полости рта период полувыведения составляет в среднем  $25,3 \pm 3,3$  мин. 10 % артикаина метаболизируется в печени, в основном плазменными и тканевыми эстеразами. Артикаин затем выводится через почки, главным образом, в виде артикаиновой кислоты.

У детей общая экспозиция после щечной инфильтрации схожа с экспозицией у взрослых, но максимальная концентрация в сыворотке достигается быстрее.

#### **Показания к применению**

Для проводниковой и инфильтрационной анестезии при стандартных стоматологических операциях, таких как неосложненное удаление одного или нескольких зубов, препарирование кариозных полостей и подготовка зубов к протезированию.

#### **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к артикаину или к другим местноанестезирующим средствам амидного типа, за исключением случаев, когда при

гиперчувствительности к местноанестезирующим средствам в виде аллергии к артикаину была исключена с помощью соответствующих исследований, проведенных с соблюдением всех необходимых правил и требований.

Повышенная чувствительность к эпинефрину или к любому другому компоненту лекарственного средства.

Тяжелые нарушения функции синусового узла или тяжелые нарушения проводимости (такие, как выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада 2-3 степени).

Острая некомпенсированная сердечная недостаточность, резко выраженная артериальная гипотензия.

Так как в лекарственном средстве содержится эпинефрин, он противопоказан в следующих случаях:

- при пароксизмальной тахикардии и других нарушениях сердечного ритма, а также при закрытоугольной форме глаукомы;
- при приеме неселективных бета-адреноблокаторов, например, анаприлина (риск развития гипертонического криза и тяжелой брадикардии);
- пациенты с гипертиреозом;
- пациенты с феохромоцитомой;
- пациенты, недавно перенесшие (3 - 6 месяцев) инфаркт миокарда;
- пациенты, недавно перенесшие (3 месяца) операцию по аортокоронарному шунтированию,
- пациенты с тяжёлой артериальной гипертензией;
- при анестезии концевых элементов конечностей, таких как пальцы рук и ног (опасность ишемии);
- сопутствующая терапия трициклическими антидепрессантами или ингибиторами МАО, поскольку эти активные субстанции могут усиливать сердечно-сосудистые эффекты эпинефрина. Это может происходить вплоть до 14 дней после окончания терапии МАО.

Противопоказано внутривенное введение.

## Способ применения и дозы

При неосложненном удалении зубов верхней челюсти при отсутствии воспаления обычно вводят в подслизистую в области переходной складки с вестибулярной стороны 1,7 мл лекарственного средства (на каждый зуб). В редких случаях требуется дополнительное введение от 1 мл до 1,7 мл для достижения полной анестезии. От болезненной небной инъекции в большинстве случаев можно отказаться. Для анестезии при небных разрезах и наложении швов с целью создания небного депо необходимо около 0,1 мл анестетика на инъекцию. При удалении нескольких рядом расположенных зубов количество инъекций обычно удается ограничить.

В случае удаления премоляров нижней челюсти при отсутствии воспаления можно обойтись без мандибулярной анестезии, так как инфильтрационная анестезия, обеспечиваемая инъекцией 1,7 мл лекарственного средства на зуб, как правило, достаточна.

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 блокаду нижнечелюстного нерва.

При хирургических вмешательствах ЛС Артикаин с эпинефрином, в зависимости от тяжести и длительности вмешательства, дозируется индивидуально. При выполнении одной лечебной процедуры взрослым можно вводить до 7 мг артикаина на 1 кг массы тела. Отмечено, что пациенты хорошо переносят дозы до 500 мг (соответствует 12,5 мл раствора для инъекций).

### *Дети*

У детей доза лекарственного средства подбирается в зависимости от возраста и массы тела ребенка, но она не должна превышать 7 мг артикаина на 1 кг массы тела. Использование лекарственного средства у детей до одного года не изучалось.

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

Возможно повышение плазменных уровней артикаина у пациентов пожилого возраста и у пациентов с тяжелым нарушением функций почек и печени. Для таких пациентов особенно важно использовать минимальные дозы, необходимые для достаточно глубокой анестезии.

Лекарственное средство Артикаин с эпинефрином предназначено для использования в ротовой полости.

Во избежание внутрисосудистой инъекции принципиально необходимо проводить тест на аспирацию. Аспирацию следует проводить в две стадии, т.е. с поворотом иглы на 90 градусов, а лучше – на 180 градусов. Избежать случайного внутрисосудистого введения и сопутствующих ему значительных системных реакций можно за счёт техники введения – провести аспирацию, затем медленно ввести 0,1–0,2 мл лекарственного средства и по истечении не менее 20–30 секунд медленно ввести оставшуюся часть дозы. Инъекционное давление должно соответствовать чувствительности ткани.

Для предотвращения инфекций необходимо следить за тем, чтобы при каждом заборе раствора из флаконов или ампул всегда использовались новые стерильные шприцы и иглы.

**Противопоказано внутривенное введение!**

**Нельзя производить инъекцию в воспаленную область!**

### **Побочное действие**

Лекарственное средство обычно хорошо переносится пациентами. Однако возможно развитие побочных явлений.

Для классификации частоты возникновения побочных эффектов применяют следующие категории: очень часто ( $\geq 1/10$ ); часто ( $\geq 1/100$  до  $<1/10$ ); нечасто ( $\geq 1/1\ 000$  до  $<1/100$ ); редко ( $\geq 1/10\ 000$  до  $<1/1\ 000$ ); очень редко ( $<1/10\ 000$ ), неизвестно (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

*Со стороны центральной нервной системы:* часто - парестезия, гипестезия, головная боль, по-видимому, вследствие наличия адреналина (эпинефрина) в составе лекарственного средства; нечасто - головокружение; частота неизвестна:

- дозозависимое (особенно при слишком высоком внутрисосудистом введении) – могут наступить нарушения деятельности центральной нервной системы: возбуждение, нервозность, ступор (иногда вплоть до потери сознания), кома, нарушения дыхания до угрожающей для жизни остановки, мышечный тремор и подёргивания мышц, вплоть до генерализованных судорог;

- повреждение нервов теоретически возможно в случае любого стоматологического вмешательства из-за неправильной техники введения или вследствие анатомических характеристик места введения. В этих случаях возможно повреждение лицевого нерва, которое может привести к развитию паралича лицевого нерва. Это может привести к снижению вкусовой чувствительности.

*Со стороны органов зрения:* частота неизвестна - нарушения зрения (нечёткость зрительного восприятия, двоение в глазах, мидриаз, слепота), обычно обратимые, возникающие во время или через короткое время после инъекции местноанестезирующего средства в области головы.

*Со стороны желудочно-кишечного тракта:* часто - тошнота, рвота.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* нечасто - тахикардия; брадикардия, сердечная недостаточность и шок (возможно опасный для жизни); частота неизвестна - сердечная аритмия, повышение артериального давления, гипотензия.

Другие побочные действия, обусловленные адреналином (эпинефрином) – нарушения сердечного ритма, повышение артериального давления – при небольшой концентрации 1:200000 (0,5 мг/100 мл) и 1:100000 (1,0 мг/100 мл).

*Со стороны иммунной системы:* частота неизвестна - аллергические реакции могут проявляться в виде отека или воспаления в месте инъекции, гиперемии кожи, зуда, конъюнктивита, ринита, отечности лица (отек Квинке) с опуханием верхней и/или нижней губы, отека голосовых связок с чувством кома в горле и затрудненным глотанием, крапивницы, затруднения дыхания. Все эти проявления могут перерасти в анафилактический шок.

*Общие нарушения и нежелательные реакции в месте инъекции*  
неизвестна - случайная внутрисосудистая инъекция может привести к появлению зон ишемии вплоть до некроза тканей в месте инъекции (см. также «Меры предосторожности»).

#### Сообщение о предполагаемых побочных реакциях

Медицинским работникам рекомендуется направлять информацию о любых подозреваемых нежелательных реакциях и неэффективности лекарственного средства по адресу: Республиканское унитарное предприятие «Центр экспертиз испытаний в здравоохранении», [www.rceth.by](http://www.rceth.by).

#### **Меры предосторожности**

Пациентам с дефицитом холинэстеразы Артикаин с эпинефрином должен назначаться только в случае особой необходимости, поскольку действие препаратов, скорее всего, будет пролонгироваться и может оказаться слишком сильным.

Артикаин с эпинефрином нельзя пациентам с тяжёлой бронхиальной астмой. У таких пациентов Артикаин с эпинефрином может вызвать острые аллергические реакции с симптомами анафилаксии, такими как бронхоспазм.

Артикаин с эпинефрином следует применять с особой осторожностью при:

- нарушениях свертывания крови;
- тяжёлой почечной или печеночной недостаточности;
- сопутствующем лечении галогенированными ингаляционными анестетиками (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);

- эпилепсии (см. раздел «Побочное действие»).

Артикаин с эпинефрином должен применяться с осторожностью при:

- сердечно-сосудистых заболеваниях (например, сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, стенокардия, инфаркт миокарда в анамнезе, нарушения ритма сердца, гипертония),

- атеросклерозе,

- нарушениях мозгового кровообращения, инсульте в анамнезе,

- хроническом бронхите, эмфиземе,
- сахарном диабете,
- тяжелых тревожных расстройствах.

<p><b>СОГЛАСОВАНО</b>          МИНИСТЕРСТВОм ЗДРАВООХРАНЕНИЯ          РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ          Приказ Министерства здравоохранения          Республики Беларусь</p>
---

Не рекомендуется введение лекарственного средства в воспаленную (инфицированную) область (увеличение накопления лекарственного средства с понижением эффективности). Перед использованием лекарственного средства необходимо выяснить анамнез пациента и информацию о сопутствующих терапиях, с пациентом следует поддерживать вербальный контакт и сделать пробную инъекцию с использованием 5 % или 10 % от обычной дозы на случай риска аллергии.

Для предотвращения неблагоприятных эффектов следует учитывать следующие аспекты:

- использовать как можно меньшую дозу;
- перед инъекцией следует провести аспирацию в две стадии (для предотвращения случайной внутрисосудистой инъекции).

Принимать пищу можно лишь по возвращении чувствительности. Артикаин с эпинефрином содержит натрий, но в количестве менее 1 ммоль (23 мг) натрия на мл – 0,201 мг/мл.

#### Педиатрические пациенты

Опекунов маленьких детей следует проинформировать о риске случайного повреждения мягких тканей от самокусков вследствие продолжительного онемения мягких тканей.

#### *Дети*

При применении лекарственного средства у детей количество введенного лекарственного средства необходимо корректировать индивидуально в зависимости от возраста и массы тела ребенка. Нельзя превышать максимальную дозу, которая составляет 7 мг артикаина на 1 кг массы тела.

*Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами*



Только стоматолог должен решать, с какого ~~времени~~ после введения лекарственного средства 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 лекарственным средством не вызывает какого-либо заметного ухудшения способности управлять транспортным средством. У чувствительных пациентов возможно появление нежелательных реакций со стороны центральной нервной системы (см. раздел «Побочные реакции»).

#### *Применение в период беременности и в период лактации*

Ввиду недостаточности клинических данных, решение о назначении лекарственного средства врачом может быть принято только после тщательного изучения соотношения польза-риск.

При необходимости применения артикаина во время беременности, предпочтительнее использование данного лекарственного средства ввиду меньшего содержания эpineфрина.

Артикаин проходит через плацентарный барьер в меньшем количестве, чем другие местные анестетики. В связи с очень быстрым падением уровня артикаина и быстрым выведением его из организма он поступает в материнское молоко в клинически незначимых количествах. Поэтому прерывать кормление грудью не требуется.

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

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

Гипертензивные эффекты вазоконстрикторов симпатомиметического типа (например, адреналина) могут быть усилены трициклическими антидепрессантами или ингибиторами MAO. Поэтому такие комбинации противопоказаны (см. раздел «Противопоказания»).

**СОГЛАСОВАНО**  
МИНИСТЕРСТВОм ЗДРАВООХРАНЕНИЯ  
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ  
Приказ Министрства Здравоохранения  
Республики Беларусь

Адреналин может блокировать высвобождение ионов железа дочной железой, вследствие чего снижается действие пероральных противодиабетических препаратов.

Некоторые ингаляционные наркотические лекарственные средства, такие как галотан, могут повышать чувствительность миокарда к катехоламинам, вызывая аритмию после введения лекарственного средства.

Об одновременном применении неселективных бета-блокаторов см. раздел «Противопоказания».

### **Передозировка**

#### *Симптомы передозировки*

Стимулирование ЦНС: беспокойное состояние, тревожность, спутанность сознания, учащенное дыхание, тахикардия, повышение артериального давления с покраснением лица, тошнота, рвота, тремор, судорожные движения, тонико-клонические судороги.

Угнетение ЦНС: головокружение, нарушение слуха, потеря речи, ступор, потеря сознания, мышечная атония, вазомоторный паралич (слабость, бледность), диспноэ, смерть в результате паралича дыхания.

Угнетение сердечнососудистой системы: брадикардия, аритмия, фибрилляция желудочков, падение артериального давления, цианоз, остановка сердца.

#### *Экстренные меры и антидоты*

При появлении первых признаков побочного действия или интоксикации, например, тошноты, двигательного беспокойства, помутнения сознания во время инъекции, ее следует прервать, пациента перевести в горизонтальное положение, придать нижним конечностям возвышенное положение, очистить дыхательные пути, контролировать пульс и артериальное давление. Рекомендуется обеспечить внутривенный доступ, даже если симптомы кажутся не слишком выраженными.

При нарушениях дыхания, в зависимости от тяжести нарушения: рекомендуется использование кислорода, при необходимости - искусственная

вентиляция легких, а в особых случаях - эндотрахеальная интубация и контролируемая вентиляция.

**СОГЛАСОВАНО**  
МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ  
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ  
Приказ Министерства здравоохранения  
Республики Беларусь

Центральные апноэтики противопоказаны.

Подергивания мышц или генерализованные судороги снимаются внутривенной инъекцией противосудорожных средств (например, диазепам). Рекомендуется вводить эти лекарственные средства медленно, под постоянным контролем производимого эффекта (риск гемодинамических расстройств и угнетения дыхания), с одновременной подачей кислорода и контролем функций системы кровообращения.

Падение артериального давления или брадикардия часто устраняются при переводе пациента в горизонтальное положение с приданием нижним конечностям возвышенного положения.

При тяжелых нарушениях кровообращения и шоке любого генеза введение лекарственного средства должно быть прекращено, и пациент должен быть переведен в горизонтальное положение с приданием нижним конечностям возвышенного положения. Должна проводиться подача кислорода и обеспечение проходимости дыхательных путей, внутривенное вливание жидкости (растворы электролитов), глюкокортикостероидов (например, 250 - 1000 мг преднизолона или эквивалентное количество его производных, например, метилпреднизолона). Дополнительно можно ввести плазмозаменители, альбумин.

При угрожающем нарушении кровообращения и нарастающей брадикардии следует немедленно ввести эпинефрин (адреналин) внутривенно. После разведения 1 мл коммерческого раствора эпинефрина 1:1000 до 10 мл (либо при использовании раствора эпинефрина 1: 10 000) 0,25 - 1 мл раствора (= 0,025 - 0,1 мг эпинефрина) медленно вводят при постоянном контроле частоты пульса и артериального давления (внимание: сердечные аритмии).

Однократная доза внутривенной инъекции эпинефрина не должна превышать 1 мл (0,1 мг эпинефрина), в дальнейшем при необходимости эпинеф-

рин можно вводить капельно (скорость вливания и время введения регулируется в зависимости от частоты пульса и давления крови).

Тяжелые формы тахикардии и тахиаритмии могут быть устранены применением антиаритмических лекарственных средств, однако не следует использовать неселективные бета-адрепоблокаторы (см. раздел «Противопоказания»). Подача кислорода и контроль за кровообращением необходимы в любом случае.

При повышении артериального давления у пациентов, страдающих артериальной гипертонией, следует, в случае необходимости, применять периферические вазодилататоры.

Следует помнить, что у пациентов, получающих антикоагулянтную терапию (например, гепарином или ацетилсалициловой кислотой), случайный прокол сосуда в ходе местной анестезии может привести к серьезному кровотечению, и что у данных пациентов в целом повышена тенденция к кровотечениям.

#### **Упаковка**

По 2 мл в ампулы из стекла.

10 ампул вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в коробку из картона с гофрированным вкладышем (№10).

10 ампул вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона с картонным вкладышем для фиксации ампул (№10).

#### **Условия хранения**

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

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **Срок годности**

2 года. Не использовать после окончания срока годности.

#### **Условия отпуска из аптек**

По рецепту.

#### **Информация о производителе**

**СОГЛАСОВАНО**

МИНИСТЕРСТВОм ЗДРАВООХРАНЕНИЯ  
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ  
Министерство Здравоохранения  
Республики Беларусь

Открытое акционерное общество «Борисовский завод медицинских препаратов», Республика Беларусь, Минская обл., г. Борисов, ул. Чапаева, 64, e-mail: [market@borimed.com](mailto:market@borimed.com), <http://www.borimed.com>, тел/факс +375 (177) 73 56 12, 73 11 56.