

ИНСТРУКЦИЯ

ЛП - 004013 - 081216

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

СОГЛАСОВАНО

Артикаин-Бинергия с адреналином

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Артикаин-Бинергия с адреналином

Группировочное наименование: Артикаин + [Эпинефрин]

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав

1 мл препарата с дозировкой (10 мг + 0,005 мг)/мл содержит:

действующие вещества: артикаина гидрохлорид (в пересчете на 100 % вещество) - 10 мг и эпинефрина гидротартрат (в пересчете на 100 % вещество) - 0,009 мг (в пересчете на эпинефрин - 0,005 мг, что соответствует содержанию эпинефрина в растворе 1:200 000);

вспомогательные вещества: натрия дисульфит - 0,50 мг, натрия хлорид - 7,0 мг, динатрия эдетат - 0,25 мг, 1 М раствор натрия гидроксида до pH 5,0, вода для инъекций до 1 мл.

1 мл препарата с дозировкой (20 мг + 0,005 мг)/мл содержит:

действующие вещества: артикаина гидрохлорид (в пересчете на 100 % вещество) - 20 мг и эпинефрина гидротартрат (в пересчете на 100 % вещество) - 0,009 мг (в пересчете на эпинефрин - 0,005 мг, что соответствует содержанию эпинефрина в растворе 1:200 000);

вспомогательные вещества: натрия дисульфит - 0,50 мг, натрия хлорид - 5,2 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 + α - и β -адреномиметик.

Код АТХ: N01BB58

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Артикаин-Бинергия с адреналином является комбинированным препаратом, в состав которого входит артикаин (местноанестезирующее средство амидного типа) и эпинефрин (сосудосуживающее средство), который добавляют в состав препарата для пролонгации 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 обратной потере чувствительности.

При всех способах введения артикаин оказывает быстрое (латентный период - от 1 до 11 минут) и сильное анестезирующее действие и имеет хорошую тканевую переносимость. Продолжительность анестезии для растворов с добавлением эпинефрина составляет от 120 до 420 минут. Для поверхностной анестезии артикаин обладает очень небольшим анестезирующим эффектом.

Фармакокинетика

Связывание артикаина с белками плазмы крови составляет приблизительно 95 %.

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. Артикаин выводится почками, главным образом, в виде артикаиновой кислоты.

После внутримышечного введения максимальная концентрация артикаина в крови достигается через 20-40 минут, период полувыведения составляет $39,8 \pm 3,1$ минут.

Показания к применению

Артикаин-Бинергия с адреналином применяется для местной и регионарной блокады нервных окончаний.

Противопоказания

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

Противопоказания, относящиеся к артикаину

- повышенная чувствительность к другим местноанестезирующим средствам амидного типа;
- тяжелые нарушения функции синусового узла или тяжелые нарушения проводимости (такие, как тяжелая брадикардия, атриовентрикулярная блокада 2-й или 3-й степени);
- острая декомпенсированная сердечная недостаточность (острое нарушение функционального состояния сердца);
- тяжелая артериальная гипотензия, шок.

Противопоказания, относящиеся к эпинефрину

- анестезия концевых фаланг пальцев рук и ног (риск ишемии);
- пароксизмальная тахикардия, тахиаритмия;
- недавно перенесенный (3-6 месяцев назад) инфаркт миокарда;
- недавно проведенное (3 месяца назад) аортокоронарное шунтирование;
- одновременный прием неселективных бета-адреноблокаторов, например, пропранолола (риск развития гипертонического криза и тяжелой брадикардии);
- закрытоугольная глаукома;
- гипертиреоз;
- феохромоцитома;
- тяжелая артериальная гипертензия;
- одновременный прием трициклических антидепрессантов или ингибиторов моноаминоксидазы (МАО), так как эти активные вещества могут усиливать действие эпинефрина на сердечно-сосудистую систему. Это касается периода времени до 14 дней после окончания лечения ингибиторами МАО.

Внутривенные инъекции противопоказаны.

С осторожностью

- у пациентов с нарушениями свертываемости крови;
- у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени или почек;
- при одновременном применении с галогенсодержащими средствами при проведении ингаляционной анестезии (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);
- у пациентов с эпилепсией в анамнезе;
- у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, ишемической болезнью сердца, стенокардией, инфарктом миокарда в анамнезе, нарушениями ритма сердца, артериальной гипертензией;
- у пациентов с атеросклерозом;
- у пациентов с цереброваскулярными нарушениями, инсультом в анамнезе;
- у пациентов с хроническим бронхитом, эмфиземой легких;
- у пациентов с сахарным диабетом;
- у пациентов с тяжелыми формами тревожного невроза.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Опыт применения артикаина беременными женщинами отсутствует, за исключением его применения во время родов.

В ходе экспериментальных исследований на животных каких-либо признаков прямого или косвенного негативного влияния артикаина на беременность, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие не обнаружено. Результаты исследования на животных продемонстрировали, что эпинефрин обладает токсичностью в отношении репродуктивной функции у животных в дозах, превышающих максимальную рекомендованную дозу. Артикаин и эпинефрин проникают через плацентарный барьер в меньшей степени по сравнению с другими местными анестетиками.

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

При случайном внутрисосудистом введении эпинефрин может уменьшать кровоснабжение матки.

Решение о применении препарата Артикаин-Бинергия с адреналином может быть принято врачом только в том случае, если потенциальная польза от его применения для матери оправдывает потенциальный риск для плода.

Негативного влияния артикаина на новорожденных при использовании родовспомогательной анестезии не выявлено.

Период грудного вскармливания

В связи с коротким периодом полувыведения эпинефрина, а также с очень быстрым падением уровня в сыворотке крови и быстрым выведением из организма артикаина, в грудном молоке не обнаруживаются клинически значимых концентраций артикаина и эпинефрина. Поэтому при краткосрочном применении препарата в период грудного вскармливания, как правило, не требуется прерывать кормление грудью.

Фертильность

Экспериментальные исследования применения артикаина 40 мг/мл + эпинефрин 0,01 мг/мл на животных (что в несколько раз больше, чем в препарате Артикаин-Бинергия с адреналином) не показали воздействия на фертильность. При применении в терапевтических дозах негативное действие препарата на фертильность человека отсутствует.

Способ применения и дозы

Артикаин-Бинергия с адреналином применяется для эпидуральной и направленной локальной анестезии.

Следует вводить минимальную дозу, с помощью которой достигается желаемая достаточная анестезия.

Дозировку следует осуществлять индивидуально в соответствии с особенностями каждого конкретного случая.

Для детей и пациентов пожилого возраста необходим подбор дозы.

Рекомендуемая максимальная доза для взрослых: 5-6 мг/кг массы тела (не более 600 мг).

Ниже представлены ориентировочные дозы, которые необходимо корректировать в зависимости от глубины анестезии и состояния пациента.

Вид анестезии	Количество, мл	
	Для дозировки 10 мг/мл	Для дозировки 20 мг/мл
Блокада плечевого нервного сплетения	10-30	10-15
Перибульбарная или ретробульбарная анестезия	2-5	2-5
Перидуральная (эпидуральная) анестезия	10-30	10-15
Инфильтрационная анестезия	10-40	10-30

Во избежание случайной интраваскулярной инъекции, перед введением препарата и в ходе введения основной дозы, всегда следует проводить аспирационную пробу. Давление инъекции должно соответствовать чувствительности тканей.

Побочное действие

Частота развития побочных эффектов представлена в соответствии с классификацией, рекомендованной Всемирной Организацией Здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$), включая отдельные сообщения; частота неизвестна (не может быть определена по имеющимся данным).

Нарушения со стороны нервной системы

Часто

Парестезия, гипестезия, головная боль (вследствие наличия в составе препарата эпинефрина).

Нечасто

Головокружение.

Частота неизвестна

Дозозависимые реакции со стороны центральной нервной системы (особенно при введении слишком большой дозы или при случайной интраваскулярной инъекции): чувство тревоги, нервозность, ступор, помрачение сознания вплоть до потери сознания, кома, ды-

хательные 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, 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 сердечно-сосудистой системы

Нечасто

Тахикардия.

Частота неизвестна

Ощущение сердцебиения, аритмия, признаки стенокардии, повышение артериального давления, артериальная гипотензия, брадикардия, сердечная недостаточность и шок (при определенных обстоятельствах с угрозой для жизни).

В процессе родовспомогательной анестезии, в частности, при парацервикальной блокаде, у плода может появиться брадикардия. Рекомендуется тщательно контролировать тоны сердца плода.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна

Аллергические или аллергоподобные реакции. В месте инъекции они могут проявляться в виде отека/припухлости и/или воспаления. Проявлениями, не связанными с местом введения, могут быть гиперемия кожных покровов, зуд, конъюнктивит, ринит, отечность лица (ангионевротический отек). Ангионевротический отек может проявляться отеком верхней и/или нижней губы, и/или щек, отеком голосовых связок с ощущением «комка в горле» и затруднением глотания, крапивницей и затруднением дыхания вплоть до анафилактического шока.

Прочие

Из-за наличия в составе препарата натрия дисульфита (натрия метабисульфита), очень редко могут возникать аллергические реакции в виде рвоты, диареи, тяжелого дыхания, острого приступа астмы, расстройства сознания или шока, в частности у пациентов, страдающих бронхиальной астмой.

Передозировка

Симптомы передозировки

Со стороны центральной нервной системы

Возбуждение центральной нервной системы: чувство тревоги, страха, спутанность сознания, гиперпноэ, тахикардия, увеличение артериального давления с покраснением лица, тошнота, рвота, тремор, подергивания, тонико-клонические судороги.

Угнетение центральной нервной системы: головокружение, нарушение слуха, потеря способности говорить, ступор, бессознательное состояние, атония, паралич сосудодвигательных нервов (слабость, бледность), одышка, смерть от паралича дыхательных путей.

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Угнетение сердечно-сосудистой системы: брадикардия, аритмия, мерцание желудочков, падение артериального давления, цианоз, остановка сердца.

Экстренная помощь и противодействующие средства

При появлении первых признаков побочного действия или интоксикации, таких как головокружение, моторное возбуждение, помрачение сознания или ступор во время введения препарата, следует прекратить его введение и перевести пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями. Необходимо обеспечить проходимость дыхательных путей и мониторировать показатели гемодинамики (число сердечных сокращений и артериальное давление).

Рекомендуется освободить доступ к венам (даже при симптомах, которые не кажутся серьезными) для того, чтобы в случае необходимости иметь возможность немедленно провести внутривенное введение необходимых лекарственных препаратов.

При нарушениях дыхания, в зависимости от их тяжести, рекомендуется подача кислорода, в случае необходимости - искусственное дыхание, а при определенных обстоятельствах - эндотрахеальная интубация и контролируемая искусственная вентиляция легких.

Мышечные подергивания и генерализованные судороги могут быть купированы внутривенным введением быстродействующего спазмолитического средства (например, суксаметония хлорид, диазепам). Также рекомендуется проведение искусственной вентиляции легких (подача кислорода).

Резкое снижение артериального давления, тахикардия или брадикардия могут устраняться при простом переведении пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями.

При тяжелых нарушениях кровообращения и шоке любого происхождения введение препарата должно быть прекращено. Необходимо перевести пациента в горизонтальное положение с приподнятыми нижними конечностями и освободить дыхательные пути (инсуффляция кислорода). Должны проводиться внутривенное введение сбалансированных растворов электролитов, глюкокортикостероидов (250-1000 мг преднизолона или эквивалентное количество производного, например, метилпреднизолона), заместительная инфузионная терапия (при необходимости дополнительно плазмозаменители, например, альбумин человека).

При развитии циркуляторного коллапса и усилении брадикардии внутривенно немедленно вводится эпинефрин (адреналин). После разведения 1 мл 0,1 % раствора эпинефрина (1:1000) до 10 мл, используя полученный 0,01 % раствор эпинефрина (1:10000), проводят медленное введение сначала 0,25-1 мл (0,025-0,1 мг эпинефрина), контролируя пульс и артериальное давление (осторожно: возможны нарушения сердечного ритма!). Не превышать разовую внутривенную дозу 1 мл (0,1 мг эпинефрина). При необходимости введения доз, превышающих разовую внутривенную дозу эпинефрина 0,1 мг, эпинефрин следует вводить с инфузионным раствором, отрегулировав капельную скорость введения в соответствии с частотой пульса и артериальным давлением.

Сильную тахикардию и тахиаритмию можно снимать антиаритмическими средствами, исключая неселективные бета-адреноблокаторы, такие, например, как пропранолол. В таких случаях необходимы подача кислорода и контроль кровообращения.

Повышение артериального давления у пациентов с артериальной гипертензией, при необходимости, купируется с помощью периферических сосудорасширяющих средств.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Сочетания различных местных анестетиков вызывают появление дополнительных воздействий на сердечно-сосудистую систему и центральную нервную систему.

Противопоказанные комбинации

С неселективными бета-адреноблокаторами, например, пропранололом

Риск развития гипертонического криза и выраженной брадикардии.

С трициклическими антидепрессантами или ингибиторами моноаминоксидазы

Возможно усиление гипертензивного действия эпинефрина (в период до 14 дней после прекращения лечения ингибиторами моноаминоксидазы).

Взаимодействие, которое следует принимать во внимание

С гипогликемическими средствами для приема внутрь

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

С некоторыми средствами для ингаляционной анестезии (галотан)

Галотан может повышать чувствительность миокарда к катехоламинам и увеличивать риск развития нарушений сердечного ритма после инъекций препарата Артикаин-Бинергия с адреналином.

С антикоагулянтами и другими препаратами, уменьшающими свертываемость крови

При проведении инъекций препарата Артикаин-Бинергия с адреналином пациентам, получающим, например, гепарин или ацетилсалициловую кислоту, возможно развитие серьезных кровотечений при непреднамеренной перфорации сосуда, так как у таких пациентов склонность к кровотечениям выше.

Особые указания

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

Внутривенные инъекции противопоказаны!

Нельзя вводить препарат Артикаин-Бинергия с адреналином в воспаленные (инфицированные) участки ткани (усиление поглощения артикаина при уменьшении эффективности).

Для того, чтобы избежать риска развития побочных реакций, необходимо соблюдать следующие условия:

- у пациентов группы риска и при применении более высоких доз (более 25 % максимальной однократной дозы) следует освободить доступ к венам, чтобы при необходимости иметь возможность немедленно сделать внутривенную инъекцию;
- применять минимальные эффективные дозы препарата;
- до введения препарата провести двухэтапную аспирационную пробу в двух плоскостях (во избежание случайной интраваскулярной инъекции);
- регулярно контролировать жизненные показатели (контроль сердечно-сосудистой системы и сознания).

Для предотвращения инфицирования (в том числе, вирусным гепатитом) необходимо следить за тем, чтобы при заборе препарата из ампул и флаконов всегда использовались новые стерильные шприцы и иглы.

Открытые ампулы нельзя использовать повторно.

Лекарственный препарат не следует применять, если раствор изменил свой цвет или стал мутным.

Препарат Артикаин-Бинергия с адреналином содержит натрия дисульфит, поэтому его применение противопоказано у пациентов с бронхиальной астмой с повышенной чувствительностью к сульфитам, так как возможно развитие острых аллергических реакций, таких как бронхоспазм (см. раздел «Противопоказания»).

В 1 мл препарата Артикаин-Бинергия с адреналином раствор для инъекций (10 мг + 0,005 мг)/мл содержится 0,127 ммоль (2,9 мг) натрия.

В 1 мл препарата Артикаин-Бинергия с адреналином раствор для инъекций (20 мг + 0,005 мг)/мл содержится 0,096 ммоль (2,2 мг) натрия.

Эти данные следует учитывать при применении препарата Артикаин-Бинергия с адреналином у пациентов, контролирующих потребление натрия (диета с малым содержанием поваренной соли).

Влияние на способность управлять транспортными средствами и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности

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

Невроз ожидания и послеоперационный стресс могут привести к изменению способности к управлению транспортными средствами или другими видами деятельности, несмотря на то, что местная анестезия артикаином по результатам соответствующих тестов не показала определяемых отклонений от обычной способности управлять транспортными средствами.

Форма выпуска

Раствор для инъекций (10 мг + 0,005 мг)/мл.

Раствор для инъекций (20 мг + 0,005 мг)/мл.

По 5 мл, 10 мл или 20 мл препарата в ампулах из прозрачного бесцветного стекла.

По 10 мл препарата во флаконах из прозрачного бесцветного стекла, герметично закупоренных пробками из резины, обжатые алюминиевыми колпачками или колпачками алюминиевыми комбинированными или комбинированными колпачками с пластиковыми дисками.

5 флаконов или ампул в контурной пластиковой упаковке (поддоне). 1 или 2 контурные пластиковые упаковки (поддона) с ампулами по 5 мл или 1 контурная пластиковая упаковка (поддон) с ампулами по 10 мл или 20 мл или с флаконами по 10 мл вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.

1 контурная пластиковая упаковка (поддон) с ампулами по 20 мл вместе с инструкцией по применению в коробке из картона.

В пачки и коробки с ампулами дополнительно вкладывают нож ампульный или скарификатор ампульный. При использовании ампул с цветной точкой излома и насечкой

или цветным кольцом излома нож ампульный или скарификатор ампульный не вкладывают.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.
Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение/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

Производитель:

ФКП «Армавирская биофабрика»

Юридический адрес / Адрес производственной площадки:

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

Начальник отдела регистрации,
стандартизации и лицензирования
ЗАО «Бинергия»



Устинова Т.А.