

УТВЕРЖДЕНА

Приказом председателя Комитета
контроля медицинской и
фармацевтической деятельности
Министерства здравоохранения и
социального развития Республики
Казахстан

от « ____ » _____ 201__ года
№ _____

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

УБИСТЕЗИН ФОРТЕ

Торговое название

УБИСТЕЗИН ФОРТЕ

Международное патентованное название

Нет

Лекарственная форма

Раствор для подслизистых инъекций в стоматологии 4% 1,7 мл

Состав

1 мл раствора содержит

активные вещества: артикаина гидрохлорид 40 мг

эпинефрина гидрохлорид 0,012 мг,

вспомогательные вещества: натрия сульфит, кислота хлористоводородная (хлороводородная), натрия гидроксид, натрия хлорид, вода для инъекций.

Описание

Бесцветный, прозрачный не опалесцирующий раствор.

Фармакотерапевтическая группа

Анестетики. Анестетики местные. Амиды. Артикаин в комбинации с другими препаратами.

Код АТХ N01BB58

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

УБИСТЕЗИН ФОРТЕ всасывается быстро и почти полностью.

Максимальный уровень артикаина в плазме после внутривидовой инъекции достигается приблизительно через 10 - 15 минут. Объем распределения составляет 1,67 л/кг, период полураспада - приблизительно 20 минут и T_{max} составляет приблизительно 10 – 15 мин.

Артикаин связывается до 95% с белками плазмы крови.

Артикаин быстро гидролизуется холинэстеразами плазмы крови в первичный метаболит - артикаиновую кислоту, которая далее метаболизируется в глюкуронид артикаиновой кислоты. Артикаин и его метаболиты выводятся из организма с мочой.

Эпинефрин быстро катаболизируется в печени и других тканях. Метаболиты выводятся через почки.

Фармакодинамика

УБИСТЕЗИН ФОРТЕ – комбинированный препарат для местной анестезии в стоматологии. Содержит артикаин, который является анестезирующим средством местного действия амидного типа и эпинефрин - адреномиметик, увеличивающий продолжительность действия местных анестетиков. Артикаин приводит к обратимому ингибированию чувствительности вегетативных, сенсорных и моторных нервных волокон. Механизм действия заключается в блокировании потенциалзависимых натриевых каналов на мембране нервного волокна. Эпинефрин приводит на местном уровне к сужению кровеносных сосудов, результатом является более высокая концентрация местного анестетика в месте введения в течение длительного времени, а также уменьшение вероятности возникновения общих нежелательных побочных эффектов.

Данный препарат характеризуется низким уровнем токсичности.

Действие препарата начинается быстро (через 1 - 3 минуты после инъекции). Препарат обеспечивает надежный анестезирующий эффект, обладает хорошей переносимостью. Продолжительность действия УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ при анестезии пульпы составляет не менее 75 минут, а при анестезии мягких тканей 120-240 минут.

Показания к применению

Убистезин форте показан для вмешательств, требующих глубокого обезболивания и выраженного ограничения кровотока, таких как:

- операции на слизистой оболочке или костной ткани полости рта
- ампутация и экстирпация пульпы зуба
- экстирпация и трепанация зубов и извлечение сломанного зуба (остеотомия)
- длительные хирургические вмешательства, такие как операция Калдвелл-Люка, чрезкожный костный остеосинтез, кистэктомия, операции на слизистой десны и полости рта, апекэктомия

Способ применения и дозы

По мере возможности следует использовать наименьший объём раствора, способствующий эффективной анестезии.

Рекомендуются следующие дозировки:

Для удаления зубов верхней челюсти в большинстве случаев достаточной является инфильтрационная анестезия с использованием 1,7 мл УБИСТЕЗИН ФОРТЕ из расчета на один зуб; таким образом можно обходиться без болезненных небных инъекций. В случае последовательного удаления

соседних зубов нередко является возможным уменьшение инъекций.

Для анестезии при разрезах или наложения швов на небе показано около 0,1 мл из расчета на одну инъекцию.

При несложном удалении премоляров нижней челюсти достаточной является инфльтрационная анестезия с использованием 1,7 мл УБИСТЕЗИН ФОРТЕ из расчета на один зуб; в отдельных случаях может потребоваться дополнительная инъекция под слизистую в области переходной складки в количестве от 1 до 1,7 мл препарата. Мандибулярная анестезия показана в редких случаях.

При препарировании кариозной полости и подготовке культи зуба под искусственную коронку допускаются *инъекции* с вестибулярной стороны в количестве *по 0,5-1,7 мл* УБИСТЕЗИН ФОРТЕ из расчета на один зуб.

При лечении премоляров нижней челюсти следует применять проводниковую анестезию. 1,7 мл УБИСТЕЗИН ФОРТЕ является достаточным.

При всех оперативных вмешательствах дозирование УБИСТЕЗИН ФОРТЕ должно подбираться индивидуально для каждого пациента в зависимости от масштабов и продолжительности операции.

Для детей с весом 20 – 30 кг достаточной является доза 0,25-1 мл; для детей с весом 30 – 45 кг – дозы 0,5 – 2 мл.

Убистезин форте не должен применяться детям до 4 лет.

У пожилых пациентов, в силу сниженных метаболических процессов и более низкого объема распределения может иметь место повышение уровня УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ в плазме крови.

Риск кумуляции УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ особенно повышается после повторного применения (например, повторная инъекция). Аналогичный эффект может наблюдаться при ухудшении общего состояния пациента, а также при тяжелых нарушениях функций печени и почек (см. «Меры предосторожности»). Таким образом, во всех подобных случаях рекомендуется более низкая доза препарата (минимальное количество для достаточной глубины анестезии).

Доза УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ должна быть снижена у больных, страдающих стенокардией, атеросклерозом.

Максимальная рекомендуемая доза:

Взрослые

Для взрослых максимальная доза составляет 500 мг артикаина (7 мг/кг массы тела), что эквивалентно 12,5 мл УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ, соответственно - 7 картриджей.

Дети

Количество препарата, подлежащее введению, должно определяться по возрасту и массе тела ребенка, а также масштабам операции. Нельзя превышать эквивалент 7 мг артикаина/кг (0,175 мл УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ/кг) массы тела.

Препарат предназначен для инъекций в качестве местного анестетика для стоматологического назначения.

С целью исключения возможности внутрисосудистого введения необходимо всегда применять аспирационный контроль в двух проекциях (с ротацией иглы на 180°), хотя его отрицательный результат не всегда исключает неумышленное или незамеченное внутрисосудистое введение.

Скорость инъекции не должна превышать 0,5 мл в 15 сек., т. е. 1 картридж в минуту.

Основных системных реакций в результате случайного внутрисосудистого введения в большинстве случаев можно избежать, применяя следующую технику введения - после аспирационного контроля медленно ввести 0,1 - 0,2 мл и не ранее 20-30 секунд спустя медленно ввести остальной раствор.

Открытые картриджи не должны применяться для других пациентов.

Остатки должны быть ликвидированы.

Побочные действия

Побочные действия могут возникать в результате передозировки, случайного внутрисосудистого введения или патологической абсорбции, например, в воспаленных или васкуляризированных тканях, и проявляют себя в виде симптомов нарушений центральной нервной системы и/или сердечно-сосудистой системы.

Данный препарат обычно хорошо переносится пациентами, однако возможно развитие следующих побочных явлений:

Содержание в препарате артикаина может привести к следующим побочным эффектам:

Редко ($\geq 0,01$ %)

- артериальная гипотензия
- нарушения проводимости
- брадикардия, сердечно-сосудистая недостаточность
- асистолия, остановка сердца
- металлический привкус во рту
- шум в ушах
- тошнота, рвота
- возбужденность, беспокойство, раздражительность, гипервентиляция
- сонливость, тремор, нервозность, нистагм, логорея (*речевое возбуждение*), головокружение, головная боль, мышечный тремор и/или тонико-клонические судороги
- кома
- парестезия губ и/или языка
- тахипноэ
- брадипноэ, которое может привести к апноэ
- дыхательный паралич

Очень редко ($< 0,01$ %)

- аллергические реакции

Возможно проявление гиперчувствительности к артикаину в виде высыпаний, отека, зуда, покраснения кожи, крапивницы, ангионевротического отека, конъюнктивита, ринита, бронхоспазма или анафилактического шока. У больных с бронхиальной астмой возможны проявления в виде тошноты, диареи. Сообщалось о перекрестной гиперчувствительности на артикаин у пациентов с замедленной аллергической реакцией на прилокаин.

Пациентам с выраженной гиперчувствительностью к артикаину или другим амидам для последующих процедур рекомендуется применение местных анестетиков сложноэфирных групп.

У пациентов с бессимптомным течением метгемоглобинемии введение больших доз артикаина может вызывать клинические проявления.

Содержание в препарате эpineфрина в качестве вазоконстрикторного компонента может привести к следующим побочным эффектам

Редко ($\geq 0,01$ %)

- ощущение жара
- потливость
- мигреноподобная головная боль
- повышение артериального давления
- боль за грудиной
- тахикардия
- тахиаритмия, сердечно-сосудистая недостаточность
- остановка сердца
- острый отек щитовидной железы

Содержание в препарате натрия сульфита в качестве вспомогательного вещества, может привести к следующим побочным эффектам

Очень редко ($< 0,01$ %)

- аллергические реакции

Аллергические реакции или гиперчувствительность у пациентов с бронхиальной астмой проявляются в виде, бронхоспазма, острого приступа астмы, потери сознания или шока, рвоты, диареи.

Содержание в препарате активных компонентов артикаина и эpineфрина, может привести к следующим побочным эффектам

Не исключена вероятность отсроченного развития паралича лицевого нерва в течение 2 недель с момента введения препарата. Имеются данные, что это явление может иметь место и по прошествии 6 месяцев.

Одновременное возникновение различных осложнений и побочных эффектов могут быть результатом взаимного влияния компонентов препарата на клиническую картину.

Местные реакции: отек и воспаление в месте инъекции.

Противопоказания

- детский возраст до 4 лет
- гиперчувствительность к любому из активных и вспомогательных компонентов препарата

Вследствие наличия в составе артикаина, УБИСТЕЗИН ФОРТЕ не разрешен к применению в следующих случаях

- гиперчувствительность к местным анестетикам амидного типа
- тяжелые нарушения передачи нервных импульсов и проводимости сердца (напр.: АВ-блокада II и III степени, выраженная брадикардия);
- острая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации
- тяжелая артериальная гипотензия
- у пациентов с дефицитом холинэстеразы
- геморрагический диатез (особенно при проведении проводниковой анестезии)
- инъекции в воспаленную область

Вследствие наличия в составе эпинефрина в качестве вазоконстрикторного компонента УБИСТЕЗИН ФОРТЕ не разрешается к применению в следующих случаях

- нестабильная стенокардия
- недавно перенесенный инфаркт миокарда
- недавняя операция по аорто-коронарному шунтированию
- рефрактерная аритмия
- пароксизмальная тахикардия или постоянная аритмия с высокой частотой сердцебиения
- нелеченная или неконтролируемая тяжелая форма артериальной гипертензии
- нелеченная или неконтролируемая застойная сердечная недостаточность
- сопутствующая терапия с использованием ингибиторов моноаминоксидазы (МАО) или трициклических антидепрессантов

Вследствие наличия в составе натрия сульфита в качестве вспомогательного вещества, УБИСТЕЗИН ФОРТЕ не разрешается к применению в следующих случаях

- гиперчувствительность к натрию сульфиту
- тяжелая форма бронхиальной астмы

Лекарственные взаимодействия

Симпатомимический эффект эпинефрина может усиливаться при одновременном приеме ингибиторов моноаминоксидазы или трициклических антидепрессантов.

Эпинефрин может задерживать выделение инсулина в поджелудочной железе и, таким образом, снижать эффект пероральных антидиабетических средств.

Сопутствующее применение бета-блокаторов некардиоселективного действия может приводить к повышению артериального давления из-за содержания эпинефрина в УБИСТЕЗИНЕ ФОРТЕ.

Некоторые ингаляционные лекарственные средства, такие, как, галотан, могут повышать чувствительность миокарда к катехоламинам, приводя к аритмии во время применения УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ.

Особые указания

Не применять внутривенно! Во избежание внутрисосудистой инъекции необходимо проводить тест на аспирацию путем контроля сопротивления тканей вводимому раствору. Инъекционное давление должно соответствовать плотности ткани.

Не производить инъекцию в воспаленную область.

Прием пищи возможен только после восстановления чувствительности.

Не использовать открытые картриджи для других пациентов.

Запрещается использовать поврежденные картриджи.

УБИСТЕЗИН ФОРТЕ должен использоваться с особой осторожностью в случаях:

- стенокардии
- атеросклероза
- существенного ухудшения коагуляции крови
- тиреотоксикозе
- узкоугольной глаукоме
- сахарном диабете
- заболеваний легких – в особенности бронхиальной астме
- феохромоцитоме
- эпилепсии
- артериальной гипертензии
- внутрижелудочковой и артериовентрикулярной блокады I степени, хронической сердечной недостаточности
- печеночной недостаточности
- почечной недостаточности
- одновременного приема фенотиазина, кардиоселективных бета-адреноблокаторов, антикоагулянтов и антиагрегантов
- тяжелого общего состояния, ослабленных больных
- пожилого возраста.

Не рекомендуется применять УБИСТЕЗИН ФОРТЕ во время лечения пациентов с аллергическими реакциями или гиперчувствительностью к сульфитам, а также во время лечения пациентов, страдающих тяжелой формой бронхиальной астмы. Применение УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ может

привести к аллергическим реакциям с анафилактическими симптомами (например: бронхоспазм).

Случайное внутрисосудистое введение препарата может сопровождаться судорогами с последующими торможением деятельности центральной нервной системы или остановкой сердечно-сосудистой деятельности. При возникновении данных симптомов необходимо незамедлительное проведение реанимационных мероприятий с применением реанимационного оборудования, кислорода и других реанимационных лекарственных средств.

Поскольку местные анестетики амидного типа также метаболизируются печенью, УБИСТЕЗИН ФОРТЕ должен с осторожностью использоваться при лечении пациентов с заболеваниями печени, так как повышается риск развития токсической концентрации препарата в плазме крови.

УБИСТЕЗИН ФОРТЕ должен с осторожностью применяться при лечении у пациентов с нарушениями сердечно-сосудистой деятельности, так как у таких больных может наблюдаться снижение способности к компенсации функциональных изменений, связанных с замедлением атриовентрикулярной проводимости, вызванной препаратом.

Препарат должен с осторожностью применяться при лечении пациентов, имеющих в анамнезе эпилепсию.

Имеется вероятность положительных результатов при проведении допинг-тестов у спортсменов.

Необходимо принимать во внимание то, что во время лечения с использованием ингибиторов свёртывания крови и агрегации (например, гепарин или ацетилсалициловая кислота), случайное внутрисосудистое введение местного анестетика может привести к серьезному кровотечению.

Следует избегать случайных внутрисосудистых введений (см. Раздел «Способ применения и дозы»)

При препарировании кариозной полости под коронку эпинефрин приводит к снижению кровотока в ткани пульпы, что приводит к повышению риска вскрытия пульпы зуба.

При применении местного анестетика в распоряжении врача должны иметься следующие лекарственные средства / мероприятия терапии:

- Противосудорожные препараты (например, бензодиазепины или барбитураты), мышечные релаксанты, атропин и вазопрессоры или адреналин для тяжелых аллергических и анафилактических реакций.
- Реанимационное оборудование (в особенности источник кислорода), обеспечивающие возможность проведения искусственной вентиляции легких в случае необходимости.
- Тщательное и постоянное наблюдение за основными показателями состояния ЦНС, сердечно-сосудистой и дыхательной систем и сознанием после каждой инъекции местного анестетика. Возбужденность, беспокойство, шум в ушах, головокружение, потемнение в глазах, тремор, депрессия или сонливость могут быть ранними предупредительными сигналами токсического воздействия на центральную нервную систему (см. раздел «Передозировка»).

Фенотиазины могут снижать прессорный эффект эпинефрина. Следует избегать одновременного использования таких препаратов. В тех случаях, когда сопутствующая терапия является необходимой, обеспечить тщательный контроль за пациентом.

Сопутствующее применение бета-блокаторов не кардиоселективного действия может привести к повышению артериального давления, обусловленного содержанием эпинефрина (см. раздел «Лекарственные взаимодействия»).

Беременности и период лактации

Беременность

Нет достаточных клинических данных по применению препарата женщинам во время беременности и кормления грудью. При использовании артикаина во время беременности не было установлено неблагоприятного воздействия на развитие плода. Данный препарат должен использоваться во время беременности только в случаях крайней необходимости, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Период лактации

Нет достаточно данных о выделении артикаина и его метаболитов в грудное молоко. Однако доклинические данные свидетельствуют о том, что концентрация артикаина в грудном молоке не достигает клинически значимой величины. В связи с этим после анестезии с применением УБИСТЕЗИНА ФОРТЕ необходимо сцеживать первую порцию грудного молока, не применять сцеженное молоко для кормления.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами.

В специальных тестах не было выявлено отчетливого влияния препарата на концентрацию внимания и быстроту двигательных реакций. Однако в связи с тем, что предоперационное беспокойство больного и стресс, обусловленный оперативным вмешательством, могут оказывать влияние на эффективность деятельности, вопрос о допуске пациента к вождению транспортного средства или к работе с потенциально опасными механизмами решается врачом индивидуально в каждом конкретном случае.

Передозировка

Симптомы: могут возникать сразу при случайной внутрисосудистой инъекции или при условиях патологической абсорбции (напр.: воспаленная или васкуляризированная ткань), и в более поздний период, и проявляются как симптомы нарушения функции центральной нервной системы и/или сосудистые симптомы.

Симптомы, вызванные действием артикаина: проявляются как симптомы нарушения функции центральной нервной системы (металлический привкус во рту, шум в ушах, головокружение, тошнота, рвота, возбужденность, беспокойство, увеличение частоты дыхания, сонливость, спутанность сознания, тремор, мышечные подергивания, тонико-клонические судороги,

кома и дыхательный паралич) и/или сердечно-сосудистые симптомы (падение АД, нарушения проводимости сердечных импульсов, брадикардии, остановка сердца).

Симптомы, вызванные действием эпинефрина: проявляются как симптомы нарушения функции сердечно-сосудистой системы (ощущение жара, потливость, мигреноподобная головная боль, повышение АД, боли за грудиной, тахикардия, тахиаритмия и остановка сердца).

Одновременное возникновение различных осложнений и побочных эффектов может быть результатом взаимного влияния компонентов препарата на клиническую картину.

Лечение: в случае возникновения побочных эффектов немедленно прекратить введение местного анестетика.

Основные общие меры

Диагностика (дыхание, кровообращение, сознание), поддержание/восстановление жизненно важных функций дыхания и кровообращения, применение кислорода, внутривенный доступ.

Специальные меры

Гипертензия: приподнять верхнюю часть тела пациента, при необходимости дать нифедипин сублингвально.

Конвульсии: предохранить пациента от сопутствующих ушибов, при необходимости диазепам в/в.

Гипотензия: горизонтальное положение тела больного, при необходимости внутрисосудистое вливание электролитных растворов, вазопрессоров (например, эпинефрин в/в).

Брадикардия: атропин в/в.

Анафилактический шок: связаться с врачом экстренной помощи. Тем временем придать пациенту горизонтальное положение, приподнять нижнюю часть тела, интенсивная инфузия электролитных растворов, при необходимости – эпинефрин в/в, глюкокортикоид в/в.

Кардиогенный шок: приподнять верхнюю часть тела больного, связаться с врачом экстренной помощи.

Остановка сердца: немедленная сердечно-легочная реанимация, связаться с врачом экстренной помощи.

Форма выпуска и упаковка

Раствор для подслизистых инъекций в стоматологии 4 % 1,7 мл

По 1,7 мл в стоматологических цилиндрических картриджах. По 50 картриджами вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках вкладывают в жестяную банку. По 10 банок в групповой упаковке.

Условия хранения

Хранить в месте, недоступном для детей!

Хранить в оригинальной упаковке-в защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Срок хранения

2 года

Препарат следует использовать до даты, указанной на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

3M Deutschland GmbH//3M Дойчланд ГмбХ
Carl-Schurz-Strasse 1/ Карл-Шурц-Штрассе 1
D-41453 Neuss/ Нойс
Germany / Германия

телефон: +49 (0) 8152 700-0

факс: +49 (0) 8152 700-1366

электронная почта: info3MESPE@mmm.com

Владелец регистрационного удостоверения

3M Deutschland GmbH//3M Дойчланд ГмбХ
Carl-Schurz-Strasse 1/ Карл-Шурц-Штрассе 1
D-41453 Neuss/ Нойс
Germany / Германия

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству продукции (товара)

050051 г. Алматы, ул. Фонвизина 17а, Бизнес Центр «Коктем», 3-й этаж

телефон: +7 (727) 333 0000

факс: +7 (727) 333 0001

электронная почта: gimantaeva2@mmm.com