

## Местные анестетики

### **АРТИКАИН**

1. Артикаин.

2. Артикаина гидрохлорид.

3. Анестетики, миорелаксанты (Местные анестетики).

4. Местный анестетик для терминальной и проводниковой анестезии, обладает выраженным анальгетическим эффектом. Средней продолжительности действия амидного типа. Единственный местный анестетик на основе тиофенового кольца. Обратимо блокирует проведение импульса по нервному волокну за счет взаимодействия с рецептором натриевых каналов.

5. Местно-анестезирующее действие. Уровень убедительности доказательств А.

6. Нет данных.

7. Местно-анестезирующее действие препарата обусловлено снижением проницаемости клеточной мембраны для ионов натрия. Выход натрия из клетки через поры регулируется тем, что ворота открыты или закрыты, так как избыток кальция препятствует повышению проницаемости. Открытие натриевого канала объясняют перемещением кальция во внеклеточную жидкость в процессе деполяризации. В состоянии покоя ионы кальция сохраняют канал закрытым. Препарат конкурирует с ионами кальция за размещение в натриевом канале, который контролирует проницаемость для натрия. Блокирует проводимость по всем видам аксонов смешанного нерва, для чего необходимо достижение площади контакта раствора с поверхностью нерва на протяжении не менее 1 см. Применяется для инфильтрационной и проводниковой анестезии. Местно-анестезирующая активность в 5 раз выше по сравнению с прокакаином и в 1,5 раза по сравнению с лидокаином. По латентному периоду (от момента введения до наступления анестезии) не уступает лидокаину. Отличается быстрой первой фазой периода полувыведения ( $T_{1/2 \alpha}$ )  $25,3 \pm 3,3$  мин после подслизистого введения в стоматологии. Плазматический клиренс очень высок и составляет свыше 3500 мл/мин. По сравнению с другими амидными анестетиками артикаин уникален тем, что первичный гидролиз происходит с участием эстераз плазмы крови; при этом образуется фармакологически неактивная артикаиновая кислота с периодом полувыведения ( $T_{1/2 \beta}$ )  $131,4 \pm 58,8$  мин. Объем распределения артикаина составляет  $329 \pm 212$  л, по сравнению с его метаболитом –  $38,4 \pm 7,5$  л. Связь с белками плазмы составляет 94%. Сочетание высокой степени связывания с белками и с низкой жирорастворимостью обеспечивает препарату минимальную системную токсичность, что особенно актуально при использовании местных анестетиков у беременных. Из организма выводится главным образом с мочой: в виде артикаиновой кислоты ( $64,2 \pm 14,4\%$ ); глюкуронида артикаиновой кислоты ( $13,4 \pm 4,97\%$ ) и артикаина ( $1,45 \pm 0,77\%$ ).

8. В общехирургической, акушерской практике: эпидуральная анестезия и анальгезия при травме, хирургических вмешательствах, обезболивание операций кесарева сечения, ретробульбарная анестезия.

9. Гиперчувствительность; аллергические реакции на серосодержащие вещества, артериальная гипотензия, гиповолемический шок.

10. Развитие анестезии и анальгетического эффекта.

11. Эпидуральная анестезия – 2% раствор до 7 мг/кг, но не более 500 мг. Обязательно проведение тест дозы в объеме 2 – 3 мл. После введения тест-дозы на протяжении 3 – 5 мин постоянный мониторинг артериального давления и частоты сердечных сокращений, тестирование симптомов наступления субарахноидального блока или системной токсичности, проведение аспирационных проб на кровь в ликворе. Индукционную дозу вводят болюсно по 2 мл на протяжении 1 мин с 2-х минутными интервалами до получения необходимого для выполнения вмешательства уровня гипоальгезии и затем выжидают 4 – 5 мин до наступления операционного обезболивания. Для блокад периферических нервов и нервных сплетений используют 1% раствор. Для блокады межреберных нервов по 2 – 3 мл (20-30 мг) на 1 нерв, но суммарно не более 200-300 мг. Для блокад плечевого сплетения: надключичный, межлестничные доступы до 400-450 мг (40-45 мл); аксиллярный доступ до 600 мг. При всех проводниковых блокадах обязательно проведение аспирационных проб на всем протяжении введения местного анестетика.

12. Профилактика развития системной токсической реакции заключается в обязательном проведении аспирационных проб, инсуффляции кислорода и назначении в составе премедикации препаратов бензодиазепинового ряда.

Лечение системных токсических реакций начинается с инсуффляции высоких концентраций кислорода через лицевую маску, при необходимости с вентиляционной поддержкой мешком типа "Ambu". Не следует сразу переходить к интубации трахеи, чтобы не усугублять состояние гипоксемии. Тонико-клонические судороги купируют в/в введением диазепама в дозе 5-15 мг, сукцинилхолина в дозе 50-100 мг. При нормальных цифрах артериального давления можно использовать в/в введение 100-150 мг тиопентала натрия. Критическое снижение показателей гемодинамики, фибрилляция желудочков, асистолия требуют немедленного проведения реанимационных мероприятий в полном объеме.

13. Не применяется для в/в регионарной анестезии по Биру. Не применять у пациентов с указанием на аллергические реакции на серосодержащие препараты. Не использовать местные анестетики у больных с атрио-вентрикулярной блокадой III ст. Все манипуляции с использованием местных анестетиков в области голова-шея можно проводить лишь при наличии анестезиолого-реанимационного оборудования.

14. С осторожностью использовать у пациентов с нарушением функции почек и печени. Не использовать стоматологические формы артикаина в общехирургической практике и в акушерстве.

15. Онемение языка, эйфория, напеминающая алкогольное опьянение, головокружение, шум в ушах, нарушение зрения, тонико-клонические судороги, начинающиеся с мимической мускулатуры и нисходящие на скелетную мускулатуру тела и конечностей, нарушение внешнего дыхания, апноэ, атриоventрикулярная блокада, снижение артериального давления, брадикардия, желудочковая аритмия, фибрилляция желудочков, асистолия.

16. Ингибиторы моноаминоксидазы или трициклические антидепрессанты повышают риск развития артериальной гипотензии. Сочетание с общей ингаляционной анестезией галотаном увеличивает риск развития аритмии.

17. **Артикаин 4% с Эпинефрином ИНИБСА** (Laboratory Inibsa S.A., Испания) препарат, содержащий артикаина гидрохлорид 40 мг, эпинефрина битартрат 6/12 мкг.

**Брилокаин – адреналин** (Брынцалов – А ЗАО, Россия) препарат, содержащий артикаин 40 мг, эпинефрина битартрат 6 мкг.

**Брилокаин – адреналин форте** (Брынцалов – А ЗАО, Россия) препарат, содержащий артикаин 40 мг, эпинефрина битартрат 12 мкг.

**Септанест с адреналином** (Septodont, Франция) препарат, содержащий артикаина гидрохлорид 40 мг, эпинефрина гидрохлорид 6/12 мкг.

**Убистезин** (Espe Dental AG, Германия) препарат, содержащий артикаин 40 мг, эпинефрина гидрохлорид 6 мкг.

**Убистезин форте** (Espe Dental AG, Германия) препарат, содержащий артикаин 40 мг, эпинефрина гидрохлорид 12 мкг.

**Ультракаин Д-С** (Aventis Pharma Deutschland GmbH, Германия) препарат, содержащий артикаин 40 мг, эпинефрина гидрохлорид 6 мкг.

**Ультракаин Д-С форте** (Aventis Pharma Deutschland GmbH, Германия) препарат, содержащий артикаина гидрохлорид 40 мг, эпинефрина гидрохлорид 12 мкг.

**Цитокартин** (Molteni Farmaceutici, Италия) препарат, содержащий артикаина гидрохлорид 40 мг, эпинефрина битартрат 6/12 мкг.

18. Пациент информируется о возможности возникновения побочных эффектов.
  19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.
  20. Субстанция – порошок (банки темного стекла) 0,5, 1 кг.
- Фирма:** НИОПИК ГНЦ ФГУП, Россия.
21. В защищенном от света месте при комнатной температуре.