

# Ультракаин

Латинское название: Ultracain

Действующее вещество: артикаин

Код АТХ: N01BB08

Производитель: Хехст АГ (Германия)

Условие отпуска из аптеки: по рецепту

Условия хранения: вдали от света и детей

Срок годности: 3 года

## Введение в тему

«Ультракаин» – местный анестетик амидного типа, который ингибирует натриевые каналы и уменьшает болевые ощущения. Адреналин может быть добавлен в качестве вазоконстриктора для продления его активности. «Ультракаин» широко используется в стоматологии. Препарат бывает в меньшей степени, чем другие местные анестетики проникают через плацентарный барьер. В сыворотке новорожденных достигается примерно 1/3 материнской концентрации. Потенциальные побочные эффекты – парестезии, нарушения чувствительности и расстройства координации движений.

## Состав и форма выпуска

Действующее вещество:

- Артикаина гидрохлорид.

«Ультракаин» выпускается в виде раствора для инъекций, который содержит по 0,01 или 0,02 г активного вещества. Средняя рыночная стоимость лекарственного препарата составляет 1250 российских рублей.

## Фармакологические свойства

Артикаин блокирует нервную проводимость путем обратимого связывания с  $\alpha$ -субъединицей натриевых каналов во внутренней полости нерва, подобно другим местным анестетикам. Связывание артикаина с натриевым каналом уменьшает приток натрия, поэтому пороговый потенциал не будет достигнут. Блокирующее действие артикаина на натриевый канал зависит от состояния: оно имеет самое высокое сродство к открытому состоянию, промежуточное сродство к инактивированному состоянию и самое низкое сродство к состоянию покоя.

На степень нейрональной блокады влияет диаметр нерва. Волокна большего диаметра (осязание/давление/моторика) требуют более высоких концентраций местного анестетика по сравнению с мелкими миелинизированными волокнами (болевыми). Артикаин является жирорастворимым, с высоким содержанием белка (94%) и имеет константу диссоциации (pKa) 7,8. Артикаин – местный анестетик короткого действия средней активности с быстрым началом действия.

Приписывание местноанестезирующей активности является попыткой определить чувствительность нервов к различным местным анестетикам и оценить потребности в анестезии. Активность местных анестетиков увеличивается параллельно с увеличением растворимости липидов.

Было также обнаружено, что способность местных анестетиков связываться с фосфолипидной мембраной в результате физико-химических свойств и взаимодействия *in vivo* прямо параллельна действию. В клинической практике другие факторы влияют на потенцию местного анестетика, в том числе:

- Баланс ионов водорода
- Размер волокна, тип и миелинизация
- Сосудорасширяющие/вазоконстрикторные свойства (влияет на скорость поглощения сосудов)
- Частота нервной стимуляции
- pH окружающей среды (более низкий pH приводит к большей ионизации и снижению эффективности)
- Концентрации электролитов (гипокалиемия и гиперкальциемия противодействуют блокаде).

Для оценки эффективности различных местных анестетиков изучают определение дозы, однократные нервные блоки, чтобы определить среднюю эффективную дозу или минимальную местную анальгетическую дозу.

#### Показания к применению

При амбулаторной спинальной анестезии у дневных пациентов предпочтительным является местный анестетик короткого действия. В дополнение к небольшой продолжительности моторной блокады и послеоперационной дисфункции мочевого пузыря, быстрое начало и низкая токсичность являются качествами благоприятного профиля.

Артикаин имеет общее с лидокаином, прилокаином и хлорпрокаином то, что он соответствует этим качествам. Взаимное сравнение этих четырех местных анестетиков не выявило явных существенных клинических преимуществ по сравнению с другими.

Хотя артикаин обладает благоприятными фармакокинетическими свойствами, клинических испытаний для изучения эффективности и безопасности при эпидуральной анестезии было мало. В 1977 году, в двойном слепом исследовании, артикаин сравнивали с лидокаином для эпидуральной анестезии. Однократная эпидуральная анестезия с использованием 10 мл 2% раствора с адреналином 1: 200 000 была выполнена у 116 урологических пациентов.

Результаты не показали статистически значимой разницы в отношении латентности, разброса, продолжительности или моторной блокады, полученных с двумя веществами. Отмеченных различий в предопределенных побочных эффектах или их частоте не отмечено.

Фармакокинетические исследования были выполнены на шести пациентах после эпидурального введения 600 мг артикаина; периоды полувыведения артикаина составляли 0,6 часа (первая фаза: распределение) и 2,5 часа (вторая фаза: гидролиз в плазме) и 2,5 часа для метаболита артикаиновой кислоты.

Дальнейшее эпидуральное применение артикаина ограничено обезболиванием при родах. Небольшое исследование показало адекватную анальгезию с использованием 4–8 мл/ч артикаина в непрерывной цервикальной эпидуральной анестезии для операции на руке. Артикаин не является местным анестетиком первого выбора для эпидуральной анестезии.

Внутривенная регионарная анестезия в основном используется для процедур максимум до 45 минут. После введения местный анестетик блокирует периферические нервы и более крупные нервы через внутривенное венозное распределение. Лидокаин и прилокаин доказали свою безопасность и эффективность на протяжении десятилетий использования.

В двух сравнительных исследованиях артикаин оказался одинаково подходящим для внутривенной регионарной анестезии. Действие артикаина начиналось несколько быстрее – через 2,5–5 минут после введения 200 мг (40 мл, 0,5%) – по сравнению с лидокаином и прилокаином.

Артикаин широко используется в стоматологической хирургии. Стоматологи начали использовать артикаин в 1977 году. В стоматологии артикаин широко исследовался. Клинические испытания, сравнивающие артикаин в основном с лидокаином, различались по дизайну исследования и месту действия.

Эффективность 2% артикаина с 1: 200 000 адреналина сравнивали с эффективностью смеси 0,5% бупивакаина и 2% лидокаина для перibuльбарной анестезии в хирургии катаракты с использованием одной инъекции. Артикаин 9,7 мл имел более быстрое начало действия, что приводило к лучшей акинезии через 5 минут. Продолжительность блокады была адекватной для операции во всех случаях.

Добавление адреналина не рекомендуется, в основном из-за спазма сосудов и аритмии после случайного внутрисудистого введения. В сопоставимом рандомизированном контролируемом исследовании достаточно было 4 мл 4% артикаина у всех, кроме одного из 31 пациента. Ни у одного из пациентов в группах артикаина не было никаких клинически значимых проблем подвижности глаза после операции.

#### Инструкция по применению

Согласно инструкции по применению, «Ультракаин» в стоматологии используется для уменьшения болевых ощущений в дозе 5-10 мл. «Ультракаин» при беременности не противопоказан, однако не используется вместе с адреналином. «Ультракаин» при грудном вскармливании рекомендуется обсудить с врачом.

#### Противопоказания и побочные эффекты

Абсолютные противопоказания к применению:

- Гиперчувствительность к лекарственному средству
- Декомпенсированная сердечная недостаточность
- Брадикардия
- Расстройства кровообращения.

Потенциальные побочные эффекты – атриовентрикулярная блокада, брадикардия, боль в животе, нарушения сознания и кома. Редкие побочные действия – расстройства кровообращения и остановка сердца.

Подавляющее большинство ссылок в литературе, описывающих предполагаемую нейротоксичность артикаина, касается парестезии и продолжительного онемения после стоматологических процедур. Отличный обзор стоматологической литературы был опубликован в прошлом году.

Авторы пришли к выводу, что артикаин является безопасным и эффективным местным анестезирующим препаратом для использования во всех аспектах клинической стоматологии для пациентов всех возрастов, со свойствами, сопоставимыми с другими распространенными местными анестетиками.

Ограниченная диффузия местного анестетика является основным недостатком перibuльбарной анестезии, приводящей к невозможности достижения акинезии глазного яблока у 50% пациентов. Артикаин был изучен для хирургии глаза, потому что он диффундирует через ткани с большей готовностью, чем другие местные анестетики.

