

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

Orabloc Forte
40 mg/ml + 0,01 mg/ml injekčný roztok

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

1 ml injekčného roztoku obsahuje 40 mg artikaínium-chloridu a 0,01 mg adrenalínu (epinefrínu) vo forme adrenalínium-hydrogentartarátu.

Jedna náplň s 1,8 ml injekčného roztoku obsahuje 72 mg artikaínium-chloridu a 0,018 mg adrenalínu (epinefrínu) vo forme adrenalínium-hydrogentartarátu.

Pomocné látky so známym účinkom:

Obsahuje 0,5 mg/ml disiričitanu sodného (E223).

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Injekčný roztok.

Číry, bezfarebný injekčný roztok.

pH injekčného roztoku sa pohybuje medzi 3,0 až 4,5.

Osmolarita: 270 mOsm/kg

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Orabloc Forte je indikovaný dospelým, dospievajúcim a deťom od 4 rokov na lokálnu anestéziu (infiltračná a zvodová anestézia) v zubnom lekárstve:

- chirurgia sliznice a kostí vyžadujúca väčšiu ischémiu (lokálne nedokrvenie tkaniva);
- chirurgia zubnej drene (amputácia a extirpácia);
- odstránenie zlomeného zuba (osteotómia);
- dlhšie chirurgické zákroky;
- perkutánnu osteosyntézu;
- cystektómia;
- mukogingiválne zákroky;
- odstránenie hrotov zubného koreňa (apicektómia).

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Pri nekomplikovanej extrakcii horných zubov pomocou klieští bez prítomnosti zápalu obyčajne postačuje vestibulárna injekcia 1,8 ml na jeden zub. V ojedinelých prípadoch môže byť na dosiahnutie úplnej anestézie potrebná ďalšia vestibulárna injekcia 1 – 1,8 ml. Bolesťová palatinálna injekcia zvyčajne nie je potrebná.

V prípade potreby rezu alebo stehov na podnebí postačuje depot do podnebia približne 0,1 ml na jednu punkciu. Pri viacpočetných extrakciách susediacich zubov je možné vo väčšine prípadov znížiť počet potrebných vestibulárnych injekcií.

Pri nekomplikovanej extrakcii dolných črenových zubov pomocou klieští bez prítomnosti zápalu obvykle postačuje injekcia 1,8 ml na jeden zub. Ak sa však nedosiahne úplná anestézia, odporúča sa podať ďalšiu vestibulárnu injekciu 1 – 1,8 ml. Konvenčná mandibulárna anestézia sa indikuje iba v prípadoch, keď sa nedosiahne úplná anestézia vyššie opísaným postupom.

Pri chirurgických zákrokoch sa odporúča dávku Orablocu Forte upraviť individuálne podľa závažnosti a trvania zákroku.

V priebehu liečby je možné podať dospelým najviac 7 mg artikaínu na kg telesnej hmotnosti. Pri použití techniky aspirácie boli dobre tolerované dávky do 500 mg (čo zodpovedá 12,5 ml injekčného roztoku).

Starší pacienti a pacienti so závažnou poruchou funkcie pečene a obličiek

U starších pacientov a pacientov so závažnou poruchou funkcie pečene a obličiek sa môže zvýšiť hladina artikaínu v plazme. U týchto pacientov sa vyžaduje osobitná opatrnosť s cieľom podať najnižšiu dávku potrebnú na dosiahnutie požadovanej anestézie.

Pediatrická populácia

Pri používaní Orablocu Forte u detí a dospievajúcich sa má použiť minimálny objem potrebný na dosiahnutie primeranej anestézie; množstvo injekčného roztoku je potrebné individuálne upraviť podľa veku a hmotnosti dieťaťa a dospievajúceho.

Nemá sa presiahnuť maximálna dávka 5 mg artikaínu na kg telesnej hmotnosti.

U detí mladších ako 1 rok sa použitie tohto lieku neskúmalo.

Spôsob podávania

Len na použitie v dentálnej anestézii.

Pred injekciou sa vždy odporúča aspirácia, aby sa zabránilo intravaskulárnej injekcii. Aspirácia sa má robiť v dvoch fázach, a to rotáciou ihly o 90° alebo ešte lepšie o 180°.

Veľkým systémovým reakciám v dôsledku náhodnej intravaskulárnej injekcie sa dá vo väčšine prípadov zabrániť injekčnou technikou – pomalá injekcia 0,1 – 0,2 ml po aspirácii a potom pomalé podanie zvyšku injekcie – až po uplynutí 20 – 30 sekúnd.

Na zabránenie rizika infekcie (napr. prenos hepatitídy) sa musia pri podaní injekčného roztoku používať vždy nové a sterilné injekčné striekačky a ihly.

Na jednorazové použitie. Všetok nepoužitý roztok sa musí zlikvidovať.

Tento liek sa nesmie použiť, ak je zakalený alebo sfarbený.

4.3 Kontraindikácie

Precitlivosť na liečivá alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.

Orabloc Forte sa pre účinok artikaínu nesmie použiť:

- pri precitlivenosti na iné lokálne anestetiká amidového typu;
- pri závažných poruchách tvorby srdcových vzruchov a vedenia (napr. AV blokáda 2. alebo 3. stupňa, výrazná bradykardia);

- pri akútnom dekompenzovanom zlyhávaní srdca (akútne kongestívne zlyhávanie srdca);
- pri závažnej hypotenzii;
- u detí mladších ako 4 roky.

Orabloc Forte sa pre účinok adrenalínu (epinefrínu) nesmie použiť:

- pri anestézii terminálnych nervových vetiev;
- u pacientov s glaukómom úzkeho uhla;
- u pacientov s hypertyreózou;
- u pacientov s paroxyzmálnou tachykardiou alebo úplnou arytmiou s rýchlym srdcovým rytmom;
- u pacientov s nedávnym (3 až 6 mesiacov) infarktomyokardu;
- u pacientov s nedávnym (3 mesiace) chirurgickým bypassom koronárnej artérie;
- u pacientov užívajúcich neselektívne betablokátory (napr. propranolol) (riziko hypertenznej krízy alebo závažnej bradykardie);
- u pacientov s feochromocytómom;
- u pacientov so závažnou hypertenziou;
- pri súbežnej liečbe tricyklickými antidepresívami alebo inhibítormi MAO, pretože tieto liečivá môžu zosilniť kardiovaskulárne účinky adrenalínu (epinefrínu). Môže k tomu dôjsť do 14 dní po ukončení liečby inhibítorom MAO.

Intravenózne použitie je kontraindikované.

Orabloc Forte sa nesmie použiť u ľudí, ktorí majú bronchiálnu astmu s precitlivosťou na siričitany. V takýchto prípadoch môže Orabloc Forte vyvolať akútne alergické reakcie s príznakmi anafylaxie, napr. bronchospazmus.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

U pacientov s deficitom cholinesterázy sa môže Orabloc Forte podávať iba pri závažných indikáciách, pretože jeho účinok sa môže predĺžiť a niekedy môže byť príliš silný.

Orabloc Forte je nutné používať s mimoriadnou opatrnosťou v týchto prípadoch:

- poruchy zrážavosti krvi;
- závažné poruchy funkcie obličiek a pečene;
- súbežná liečba halogénovými inhalačnými anestetikami (pozri časť 4.5);
- epilepsia v anamnéze (pozri časť 4.8);

a je potrebné zvážiť prednostné použitie Orablocu, 40 mg/ml + 0,005 mg/ml injekčného roztoku pred Orablocom Forte, 40 mg/ml + 0,010 mg/ml injekčným roztokom pre nižší obsah adrenalínu (epinefrínu) 0,005 mg/ml u pacientov:

- s chorobami srdca a ciev (napr. zlyhávanie srdca, ischemická choroba srdca, *angina pectoris*, infarkt myokardu v anamnéze, srdcová arytmia, hypertenzia);
- s arteriosklerózou;
- s poruchami cerebrálnej cirkulácie, s cievnou mozgovou príhodou v anamnéze;
- s chronickou bronchitídou, emfyzémom pľúc;
- s *diabetom mellitus*;
- so závažnými stavmi úzkosti.

Injekcia sa nemá podávať do zapálenej (infikovanej) oblasti (zvýšená absorpcia Orablocu Forte so zníženým účinkom).

Pred použitím tohto lieku je potrebné sa opýtať pacienta na jeho anamnézu, súbežnú liečbu a udržiavať verbálny kontakt s pacientom a taktiež pri riziku alergie urobiť injekčný test, pričom sa podá 5 % alebo 10 % dávky.

Na zabránenie výskytu nežiaducich účinkov je potrebné vziať do úvahy:

- stanovenie najnižšej možnej dávky;
- pred injekciou aspirácia v dvoch fázach (zabránenie neželanej intravaskulárnej injekcii).

Vybavenie a lieky potrebné na monitorovanie a núdzovú resuscitáciu (kyslík, antikonvulzívne lieky ako benzodiazepíny alebo barbituráty, svalové relaxanciá, atropín a vazopresín alebo adrenalín (epinefrín) pre prípad závažných alergických alebo anafylaktických reakcií) majú byť k dispozícii na okamžité použitie.

Odporúča sa, aby pacient nejedol, až kým anestézia neodznie.

Pediatrická populácia

Opatrovatelia malých detí musia byť upozornení na riziko náhodného poranenia mäkkého tkaniva následkom sebahryznutia pri predĺženom znecitlivení mäkkého tkaniva.

Tento liek obsahuje disiričitan sodný (E223), ktorý môže ojedinele vyvolať závažné reakcie z precitlivenosti a kŕč svalstva priedušiek (bronchospasmus).

Tento liek obsahuje menej ako 1 mmol sodíka (23 mg) v jednej dávke, t. j. v podstate zanedbateľné množstvo sodíka.

4.5 Liekové a iné interakcie

Kombinácia rôznych anestetík spôsobuje aditívne účinky na kardiovaskulárny systém a centrálny nervový systém (CNS).

Krvný tlak zvyšujúce účinky vazokonstrikčných sympatomimetík (ako je adrenalín) sa môžu zintenzívniť tricyklickými antidepresívami alebo inhibítormi MAO, a preto sú kontraindikované (pozri časť 4.3).

Pre informácie o súbežnom použití neselektívnych betablokátorov pozri časť 4.3.

Adrenalín (epinefrín) môže inhibovať uvoľňovanie inzulínu v pankrease, čím zoslabuje účinok perorálnych antidiabetík.

Určité inhalačné anestetiká, ako je halotan, môžu zvýšiť citlivosť myokardu na katecholamíny a môžu preto po podaní Orablocu Forte vyvolať arytmie.

Fenotiazíny môžu ovplyvniť účinok adrenalínu (epinefrínu) na zvyšovanie krvného tlaku. Preto sa nemajú užívať súbežne. Ak je nevyhnutné ich súbežné užívanie, pacient musí byť starostlivo monitorovaný.

Je potrebné mať na pamäti, že u pacientov s antikoagulačnou liečbou (napr. heparín alebo kyselina acetylsalicylová) môže neželaná vaskulárna punkcia počas lokálnej anestézie spôsobiť závažné krvácanie a že títo pacienti majú vo všeobecnosti zvýšenú tendenciu ku krvácaniu.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

S použitím artikaínu u gravidných žien, okrem použitia pri pôrode, nie sú žiadne skúsenosti. Štúdie na zvieratách nepreukázali priame alebo nepriame škodlivé účinky na graviditu, embryonálny/fetálny vývin, pôrod alebo postnatálny vývin. Štúdie na zvieratách preukázali, že adrenalín (epinefrín) je toxický na reprodukciu pri dávkach vyšších, ako je maximálna odporúčaná dávka (pozri časť 5.3).

Adrenalin (epinefrín) a artikaín prechádzajú cez placentárnu bariéru, aj keď artikaín prechádza v menšom rozsahu ako iné lokálne anestetiká. Koncentrácia artikaínu meraná v plazme u novorodencov bola približne 30 % z hladiny nameranej u matky. V prípade nežiaduceho intravaskulárneho podania matke môže adrenalin (epinefrín) znížiť prerušenie maternice. Počas gravidity sa Orabloc Forte môže použiť len po dôkladnej analýze pomeru prínosu a rizika.

Vzhľadom na nižší obsah adrenalinu (epinefrínu) je potrebné uprednostniť použitie Orablocu, 40 mg/ml + 0,005 mg/ml pred Orablocom Forte, 40 mg/ml + 0,010 mg/ml.

Dojčenie

V materskom mlieku sa nenašli klinicky relevantné množstvá artikaínu vďaka rýchlemu poklesu jeho hladiny v plazme a rýchlej eliminácii. Adrenalin prechádza do materského mlieka, ale taktiež má krátky polčas. Pri krátkodobom používaní zvyčajne nie je potrebné dojčenie ukončiť.

Fertilita

Štúdie na zvieratách s artikaínom 40 mg/ml + adrenalinom (epinefrínom) 0,010 mg/ml nepreukázali účinky na fertilitu (pozri časť 5.3). Pri terapeutických dávkach sa neočakávajú nežiaduce účinky na fertilitu u ľudí.

4.7 Oplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Po podaní Orablocu Forte musí zubný lekár rozhodnúť, kedy je pacient opäť schopný viesť vozidlo alebo obsluhovať stroje.

Obavy a stres zo zákroku môžu mať vplyv na výkonnosť, hoci príslušné testy nepreukázali, že by lokálna anestézia s použitím artikaínu významne zhoršila normálnu schopnosť viesť vozidlo.

4.8 Nežiaduce účinky

Na klasifikáciu frekvencie nežiaducich účinkov sa používajú nasledujúce kategórie:

Veľmi časté ($\geq 1/10$)

Časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$)

Menej časté ($\geq 1/1\ 000$ až $< 1/100$)

Zriedkavé ($\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1\ 000$)

Veľmi zriedkavé ($< 1/10\ 000$)

Neznáme (z dostupných údajov)

Poruchy imunitného systému

Neznáme: alergické reakcie alebo alergii podobné reakcie z precitlivenosti. Môžu sa prejavovať ako opuch a/alebo zápal v mieste podania injekcie alebo prejavy objavujúce sa nezávisle od miesta podania injekcie zahŕňajúce sčervenenie kože, svrbenie, konjunktivitídu, rinitídu, opuch na tvári (angioedém) s opuchom hornej a/alebo dolnej pery a/alebo líc, opuch hlasiviek s *globus pharyngeus* a ťažkosti pri prehltaní, žihľavka a ťažkosti s dýchaním, ktoré môžu prerásť do anafylaktického šoku.

Poruchy nervového systému

Časté: parestézia, hypestézia; bolesť hlavy, spôsobená pravdepodobne adrenalinom.

Menej časté: závrat.

Neznáme:

- v závislosti od dávky (najmä pri výrazne vysokých dávkach alebo po nežiaducej intravaskulárnej injekcii) sa môžu vyskytnúť reakcie centrálného nervového systému: agitácia, nervozita, stupor, niekedy prechádzajúci do straty vedomia, kóma, poruchy dýchania, niekedy prechádzajúce do zástavy dýchania, svalový tras a svalové záškľby, niekedy prechádzajúce do generalizovaných kŕčov.
- nervové lézie (napr. ochrnutie tvárového nervu) a zníženie chuťovej citlivosti v orofaciálnej oblasti nie sú nežiaducimi účinkami špecifickými pre artikaín. Takéto reakcie sú však teoreticky možné pri

každom dentálnom zákroku vzhľadom na anatomicke pomery v oblasti podania alebo pri nesprávnej injekčnej technike.

Poruchy oka

Neznáme: dočasné poruchy videnia (rozmazané videnie, slepota, dvojité videnie) vyskytujúce sa počas podávania injekcie alebo krátko po podaní lokálneho anestetika v oblasti hlavy.

Poruchy srdca a ciev

Menej časté: tachykardia.

Neznáme: srdcové arytmie, zvýšenie krvného tlaku, hypotenzia, bradykardia, zlyhávanie srdca a šok (môže byť život ohrozujúci).

Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína

Neznáme: poruchy dýchacej sústavy (tachypnea, bradypnea), ktoré môžu viesť k zástave dýchania.

Poruchy gastrointestinálneho traktu

Časté: nauzea a vracanie.

Celkové poruchy a reakcie v mieste podania

Neznáme: nežiaduca intravaskulárna injekcia môže viesť k rozvoju ischemických zón v mieste podania injekcie, čo niekedy prechádza do nekrózy tkaniva (pozri tiež časť 4.2).

Pretože tento liek obsahuje disiričitan sodný, môže vyvolať reakcie z precitlivenosti, a to najmä u pacientov s bronchiálnou astmou. Tieto reakcie sa môžu prejaviť ako vracanie, hnačka, dýchavičnosť, akútne astmatické záchvaty, poruchy vedomia alebo šok.

Pediatrická populácia

V publikovaných štúdiách bol bezpečnostný profil u detí a dospievajúcich vo veku od 4 do 18 rokov podobný ako u dospelých. Častejšie sa však pozorovalo náhodné poranenie mäkkého tkaniva (najviac u 16 % detí), najmä u detí vo veku od 3 do 7 rokov v dôsledku predĺženej anestézie mäkkého tkaniva. V retrospektívnej štúdii, kde bolo zaradených 211 detí vo veku 1 až 4 rokov, bola vykonaná dentálna liečba s použitím najviac 4,2 ml 4 % artikaínu + 0,005 mg/ml alebo 0,010 mg/ml adrenalínu (epinefrínu) a nezaznamenali sa žiadne nežiaduce reakcie.

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na [národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V](#).

4.9 Predávkovanie

a) Príznaky predávkovania

Stimulácia CNS: nepokoj, úzkosť, zmätenosť, hyperpnoe, tachykardia, zvýšenie krvného tlaku spojené so sčervenením tváre, nevoľnosť, vracanie, tras, záškľby, tonicko-klonické kŕče.

Útlm CNS: závrat, zhoršenie sluchu, strata rečovej schopnosti, strata vedomia, ochabnutosť svalstva, vazomotorická paralýza (slabosť, bledosť), dýchavičnosť, smrť v dôsledku paralýzy dýchacích ciest.

Kardiovaskulárny útlm: bradykardia, arytmia, ventrikulárna fibrilácia, pokles krvného tlaku, cyanóza, zástava srdca.

b) Opatrenia pri predávkovaní a antidotá

Pri prvých príznakoch nežiaducich účinkov alebo intoxikácie, napr. závrat, motorický nepokoj alebo stupor, sa podávanie injekcie má zastaviť a pacienta treba dať do horizontálnej polohy. Dýchacie cesty pacienta sa majú udržiavať priechodné a je potrebné monitorovanie pulzu a krvného tlaku.

Odporúča sa zaviesť i.v. katéter, a to aj vtedy, keď sa príznaky intoxikácie nezdaajú byť závažné, aby bolo možné v prípade potreby okamžite podať intravenóznou injekciu.

Pri poruchách dýchania sa podľa ich závažnosti odporúča podávanie kyslíka, a ak je to potrebné, aj umelé dýchanie. Ak je to potrebné, odporúča sa tiež endotracheálna intubácia a kontrolovaná ventilácia.

Svalové záškľby alebo generalizované kŕče možno odstrániť intravenóznou injekciou krátko účinkujúceho spazmolytika (napr. suxametónium-chloridu, diazepamu). Odporúča sa tiež umelé dýchanie (kyslík).

Pokles krvného tlaku, tachykardia alebo bradykardia sa môže upraviť jednoduchým uvedením pacienta do horizontálnej polohy alebo do polohy s hlavou mierne nižšie ako telo.

Pri závažných obehových poruchách a pri šoku – nezávisle od príčiny – sa majú bezprostredne po zastavení injekcie urobiť tieto opatrenia:

- pacienta umiestniť do horizontálnej polohy alebo do polohy s hlavou mierne nižšie ako telo a udržiavať priechodnosť dýchacích ciest (insuflácia kyslíka);
- zaviesť intravenóznou infúziou (vyvážený elektrolytový roztok);
- intravenózne podať glukokortikoid (napr. 250 – 1000 mg prednizolónu alebo zodpovedajúce množstvo jeho derivátu, napr. metylprednizolónu);
- podať objemovú náhradu (v prípade potreby pridať expander objemu plazmy, ľudský albumín).

Ak hrozí obehový kolaps a bradykardia sa zhoršuje, musí sa okamžite intravenózne podať adrenalín (epinefrín). Po nariadení 1 ml komerčného roztoku adrenalínu (epinefrínu) 1:1 000 na 10 ml (ako náhrada sa môže použiť roztok adrenalínu (epinefrínu) 1:10 000) sa pomaly podáva 0,25 – 1 ml injekčného roztoku (= 0,025 – 0,1 mg adrenalínu (epinefrínu)), pričom sa monitoruje pulz a krvný tlak (pozor: srdcové arytmie). V jednej intravenózne injekcii sa nemá podať viac ako 1 ml (0,1 mg adrenalínu (epinefrínu)). Ak je potrebné podanie ďalšieho množstva adrenalínu, odporúča sa podať ho v infúznom roztoku (rýchlosť infúzie treba upraviť podľa pulzu a krvného tlaku).

Závažná tachykardia a tachyarytmie sa môžu liečiť antiarytmikami, ale nie kardioselektívnymi betablokátormi, napr. propranololom (pozri časť 4.3). V takýchto prípadoch sa musí podávať kyslík a monitorovať krvný obeh.

Zvýšenie krvného tlaku u pacientov s hypertenziou sa musí v prípade potreby liečiť periférnymi vazodilatátormi.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: anestetiká, lokálne; amidy
ATC kód: N01BB58

Orabloc Forte je kyslé lokálne anestetikum amidového typu, ktoré sa používa na terminálnu a zvodovú anestéziu v zubnom lekárstve. Má rýchly nástup účinku (čas nástupu 1–3 min) so silným analgetickým účinkom a dobrou tkanivovou tolerabilitou.

Účinok anestézie trvá približne 45 minút pri Orablocu, 0,005 mg/ml a približne 75 minút pri Orablocu Forte, 0,010 mg/ml.

Predpokladá sa, že mechanizmus účinku artikaínu je založený na inhibícii vedenia vzruchov v nervových vláknach, ktorú spôsobuje blokáda od napätia závislých sodíkových (Na⁺) kanálov v cytoplazmatickej membráne.

Pre extrémne nízku koncentráciu adrenalínu a vysokú intenzitu účinku je Orabloc, 0,005 mg/ml vhodný pre pacientov s kardiovaskulárnymi ochoreniami.

Pediatrická populácia

Klinické štúdie u detí vo veku 3,5 až 16 rokov, do ktorých bolo zaradených do 210 pacientov, ukázali, že pri dávkach do 5 mg/kg 4 % artikaínu + 0,005 mg/ml adrenalínu a pri dávkach do 7 mg/kg 4 % artikaínu + 0,010 mg/ml adrenalínu sa úspešne dosiahla lokálna anestézia, a to pri infiltrácii (mandibulárne) aj zvodovej anestézii (maxilárne). Dĺžka trvania anestézie bola podobná vo všetkých vekových skupinách a závisela od podaného objemu.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Artikaín sa v sére viaže na plazmatické bielkoviny v 95 %. Polčas eliminácie po intraorálnej submukóznej injekcii je $25,3 \pm 3,3$ min. 10 % artikaínu sa metabolizuje v pečeni, prevažne plazmatickými a tkanivovými esterázami. Následne sa artikaín vylučuje renálnou cestou, prevažne ako kyselina artikaínová.

U detí je celková expozícia po vestibulárnej infiltrácii podobná ako u dospelých, avšak maximálna koncentrácia v plazme sa dosahuje rýchlejšie.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

V konvenčných štúdiách farmakologickej bezpečnosti, chronickej toxicity, reprodukčnej toxicity a genotoxicity neodhalili predklinické údaje žiadne osobitné riziko pre ľudí pri podávaní terapeutických dávok. Pri supratherapeutických dávkach má artikaín kardiodepresívne vlastnosti a môže vyvolať vazodilatačné účinky.

Adrenalín (epinefrín) preukazuje sympatomimetické účinky.

V štúdiách embryotoxicity s artikaínom sa nepozoroval žiadny nárast fetálnej úmrtnosti ani malformácií pri denných i.v. dávkach do 20 mg/kg (potkan) a 12,5 mg/kg (králik). Adrenalín (epinefrín) preukázal reprodukčnú toxicitu u zvierat pri dávkach v rozsahu od 0,1 do 5 mg/kg (niekoľkonásobok maximálnej dávky adrenalínu v prípade použitia Orablocu Forte) s výskytom kongenitálnej malformácie a zhoršenou uteroplacentárnou perfúziou.

V štúdiách embryofetotoxicity s artikaínom a adrenalínom (epinefrínom) nebol pozorovaný žiadny nárast malformácií pri denných s.c. dávkach artikaínu do 80 mg/kg (potkan) a 40 mg/kg (králik).

V štúdiu fertility a skorého embryonálneho vývinu u potkanov sa pri dávkach spôsobujúcich parentálnu toxicitu nezaznamenali žiadne nežiaduce účinky na fertilitu samcov alebo samíc.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

chlorid sodný
disiričitan sodný (E 223)
kyselina chlorovodíková 2 % (na úpravu pH)
voda na injekcie

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

2 roky

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajúte pri teplote do 25 °C. Uchovávajúte v pôvodnom obale na ochranu pred svetlom.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Bezfarebné sklenené náplne (typ I) uzavreté bromobutylovou gumenou zátkou na jednej strane a hliníkovým uzáverom a gumeným tesnením na druhej strane.

Náplne sú dostupné v rôznych baleniach:

- Náplne sú balené v blistroch z PVC (10 náplní/blister), blistre sú balené v papierovej škatuľke po 5 x 10 alebo 10 x 10 náplní.
- Každá náplň je vložená do plastového injektora, každý injektor s náplňou je v zaplombovanom blistri, injektory sú balené v papierovej škatuľke spolu s návodom na použitie injektora: 50 alebo 100 kusov v balení na komerčné použitie.

Na trh nemusia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu

Ako pri všetkých náplniach, gumené tesnenie (membrána) musí byť pred použitím vydezinfikované etylalkoholom (70 %) farmaceutickej kvality alebo izopropylalkoholom (90 %) farmaceutickej kvality.

Náplne nesmú byť ponorené do roztokov uvedených vyššie.
Nemiešajte injekčný roztok s ďalšími produktami v jednej striekačke.

Všetok nepoužitý liek alebo odpad vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCI

Pierrel Pharma S.r.l.
Strada Statale Appia 7 BIS 46/48
81043 Capua (CE)
Taliansko

8. REGISTRÁČNÉ ČÍSLO

01/0120/21-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĽŽENIA REGISTRÁCIE

05/2021

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

Februári 2022