

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Ораблок 40 мг/1 мл + 5 мкг/1 мл, раствор для инъекций

Ораблок 40 мг/1 мл + 10 мкг/1 мл, раствор для инъекций

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ**2.1 Общее описание**

Прозрачный бесцветный раствор.

**2.2 Качественный и количественный состав**

Ораблок 40 мг/1 мл + 5 мкг/1 мл, раствор для инъекций

В 1 мл раствора содержится:

активные вещества: артикаина гидрохлорид – 40,00 мг, адреналина тартрат – 9,10 мкг, что эквивалентно 5 мкг адреналина.

Ораблок 40 мг/1 мл + 10 мкг/1 мл, раствор для инъекций

В 1 мл раствора содержится:

активные вещества: артикаина гидрохлорид – 40,00 мг, адреналина тартрат – 18,20 мкг, что эквивалентно 10 мкг адреналина.

Вспомогательные вещества: натрия метабисульфит (см. раздел 4.3 и 4.8).

Полный список вспомогательных веществ см. в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для инъекций.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1 Показания к применению**

Для инфильтрационной и проводниковой анестезии при стоматологических процедурах.

Препарат показан взрослым, подросткам и детям старше 4 лет (или с массой тела 20 кг или более).

4.2 Режим дозирования и способ применения

Препарат предназначен исключительно для профессионального использования врачами и стоматологами.

Режим дозирования

Для всех групп пациентов следует применять наименьшую эффективную для анестезии дозу. Необходимая дозировка должна определяться в индивидуальном порядке.

Для проведения рутинной процедуры стандартная доза для взрослых пациентов составляет 1 картридж, однако содержимого менее одного картриджа может быть достаточно для достижения эффективной анестезии. По усмотрению стоматолога может потребоваться использование более одного картриджа для более сложных процедур, однако без превышения максимальной рекомендуемой дозы.

Для большинства рутинных стоматологических процедур предпочтительно использовать препарат Ораблок 40 мг/1 мл + 5 мкг/1 мл, раствор для инъекций.

Для более сложных процедур, например, процедур, требующих обеспечения выраженного гемостатического эффекта, предпочтительно использовать препарат Ораблок 40 мг/1 мл + 10 мкг/1 мл, раствор для инъекций.

Одновременный прием седативных средств для снижения тревожности пациентов:

Максимальная безопасная доза местного анестетика может быть снижена у пациентов, находящихся под седативным действием других препаратов, из-за аддитивного угнетающего действия на центральную нервную систему (см. раздел 4.5).

Взрослые и подростки (от 12 до 18 лет)

У взрослых и подростков максимальная доза артикаина составляет 7 мг/кг, абсолютная максимальная доза — 500 мг. Максимальная доза артикаина 500 мг рассчитана для здорового взрослого пациента с массой тела более 70 кг.

В следующей таблице приведена максимальная рекомендуемая доза:

Ораблок 40 мг/1 мл + 5 мкг/1 мл, раствор для инъекций

Масса тела пациента (кг)	Максимальная доза артикаина гидрохлорида (мг)	Доза адреналина (мг)	Общий объем (мл) и эквивалентное количество картриджей (1,8 мл)
40	280	0,035	7,0 (3,9 картриджа)
50	350	0,044	8,8 (4,9 картриджа)
60	420	0,053	10,5 (5,8 картриджа)
70 или выше	490	0,061	12,3 (6,8 картриджа)

Ораблок 40 мг/1 мл + 10 мкг/1 мл, раствор для инъекций

Масса тела пациента (кг)	Максимальная доза артикаина гидрохлорида (мг)	Доза адреналина (мг)	Общий объем (мл) и эквивалентное количество картриджей (1,8 мл)
40	280	0,070	7,0 (3,9 картриджа)
50	350	0,088	8,8 (4,9 картриджа)
60	420	0,105	10,5 (5,8 картриджа)
70 или выше	490	0,123	12,3 (6,8 картриджа)

Дети (в возрасте от 4 до 11 лет)

Безопасность препарата Ораблок у детей младше 4 лет не установлена. Данные отсутствуют. Количество вводимого препарата необходимо определять с учетом возраста и массы тела ребенка, а также проводимой стоматологической операции. Средняя эффективная доза составляет 2 мг/кг и 4 мг/кг для простых и сложных процедур, соответственно. Следует применять наименьшую эффективную для анестезии дозу. У детей в возрасте 4 лет (или с массой тела не менее 20 кг) и старше максимальная доза артикаина составляет всего 7 мг/кг, при этом абсолютная максимальная доза артикаина для здорового ребенка с массой тела 55 кг составляет 385 мг.

Ораблок 40 мг/1 мл + 5 мкг/1 мл, раствор для инъекций

Ораблук 40 мг/1 мл + 10 мкг/1 мл, раствор для инъекций

Особые группы пациентов

Из-за отсутствия клинических данных необходимо соблюдать особые меры предосторожности при введении минимальной эффективной дозы, способной вызвать анестезию, пациентам пожилого возраста, а также пациентам с заболеваниями почек (см. разделы 4.4 и 5.2).

Пациенты с нарушением функции печени

Пациенты с дефицитом холинэстеразы в плазме

Способ применения

Местные анестетики следует вводить с осторожностью при наличии воспаления и/или инфекции в месте инъекции. Инъекцию необходимо вводить очень медленно (1 мл/мин).

Меры предосторожности, которые необходимо предпринять перед процедурой или введением лекарственного препарата

Данный лекарственный препарат должен использоваться исключительно врачами или стоматологами, имеющими достаточные знания и опыт в диагностике и лечении системной токсичности, или же под их наблюдением. Перед индукцией местной анестезии с использованием местных анестетиков необходимо убедиться в наличии соответствующего реанимационного оборудования и лекарственных препаратов для обеспечения незамедлительного лечения любых неотложных респираторных и сердечно-сосудистых заболеваний. Состояние сознания пациента необходимо контролировать после каждой инъекции местного анестетика.

При использовании препарата Ораблок для инфильтрационной или локорегионарной анестезии инъекцию всегда следует выполнять медленно и после аспирации.

Инструкции по обращению с лекарственным препаратом перед введением см. в разделе 6.6.

4.3 Противопоказания

Повышенная чувствительность к артикаину (или местным анестетикам амидного типа), адреналину или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.

Пациенты с эпилепсией, с неконтролируемыми приступами на фоне приема препаратов.

4.4 Особые указания и меры предосторожности при применении

Перед применением данного лекарственного препарата важно:

- расспросить пациента о его текущем лечении и клиническом анамнезе;
- поддерживать вербальный контакт с пациентом;
- иметь в наличии реанимационное оборудование (см. раздел 4.9).

Особые меры предосторожности

Данный лекарственный препарат следует применять с особой осторожностью у пациентов со следующими патологиями, при этом в случае серьезных и/или нестабильных патологических состояний рекомендуется рассмотреть возможность отсрочки проведения стоматологического хирургического вмешательства.

Пациенты с сердечно-сосудистыми заболеваниями

Необходимо применять наименьшую эффективную для анестезии дозу, в следующих случаях:

- нарушения формирования и проведения сердечного импульса (например, атриовентрикулярная блокада степени 2 или 3, выраженная брадикардия);
- острая сердечная недостаточность (острая застойная сердечная недостаточность);
- артериальная гипотензия;
- пациенты с пароксизмальной тахикардией или мерцательными аритмиями с учащенным сердечным ритмом;
- пациенты с нестабильной стенокардией или недавним инфарктом миокарда в анамнезе (менее 6 месяцев);
- пациенты, недавно перенесшие коронарное шунтирование (3 месяца);
- пациенты, принимающие бета-блокаторы, не являющиеся кардиоселективными (например, пропранолол) (риск гипертонического криза или тяжелой брадикардии) (см. раздел 4.5);
- пациенты с неконтролируемой артериальной гипертензией;
- сопутствующее лечение трициклическими антидепрессантами, поскольку эти действующие вещества могут усиливать действие адреналина на сердечно-сосудистую систему (см. раздел 4.5).

Данный лекарственный препарат следует с осторожностью применять у пациентов со следующими заболеваниями:

Пациенты с эпилепсией

Из-за возможности возникновения судорог все местные анестетики следует применять с

большой осторожностью.

Пациенты с дефицитом холинэстеразы в плазме

Дефицит холинэстеразы в плазме можно заподозрить, если клинические признаки передозировки возникают при введении стандартной дозы анестетика и при исключении введения инъекции в сосуд. В данном случае нужно быть осторожным при выполнении следующей инъекции и использовать сниженную дозу препарата.

Пациенты с заболеванием почек

Следует применять наименьшую эффективную для анестезии дозу.

Пациенты с тяжелым заболеванием печени

Данный лекарственный препарат следует применять с осторожностью при наличии заболеваний печени, несмотря на то, что 90 % артикаина инактивируется неспецифическими плазменными эстеразами в тканях и крови.

У пациентов с тяжелой псевдопаралитической миастенией, которые получают ингибиторы ацетилхолинэстеразы, следует использовать наименьшую эффективную дозу, способную вызвать анестезию.

Пациенты с порфирией

У пациентов с острой порфирией, препарат Ораблор следует применять исключительно в том случае, если отсутствует более безопасная альтернатива. Необходимо соблюдать соответствующие меры предосторожности для всех пациентов с порфирией, поскольку данный лекарственный препарат может спровоцировать прогрессирование заболевания.

Пациенты, получающие сопутствующее лечение галогенированными ингаляционными анестетиками

Следует применять наименьшую эффективную для анестезии дозу (см. раздел 4.5).

Пациенты, получающие лечение антитромбоцитарными средствами/антикоагулянтами

Препарат Ораблор следует назначать с осторожностью пациентам, получающим антитромбоцитарные средства/антикоагулянты или страдающим нарушениями свертываемости крови, из-за повышенного риска кровотечений. Самый высокий риск кровотечения связан с проводимой процедурой, а не с лекарственным препаратом.

Пожилые пациенты

У пожилых пациентов могут наблюдаться повышенные уровни препарата в плазме, особенно после многократного применения. Если необходимо повторное введение препарата, следует тщательно контролировать состояние пациента в отношении признаков относительной передозировки (см. раздел 4.9). Поэтому следует применять наименьшую эффективную для анестезии дозу.

Целесообразно оценить возможность применения препарата Ораблор 40 мг/1 мл + 5 мкг/1 мл, раствор для инъекций, вместо препарата Ораблор 40 мг/1 мл + 10 мкг/1 мл, раствор для инъекций, принимая во внимание более низкое содержание в нем адреналина, равное 5 мкг/мл, в следующих случаях:

- Пациенты с сердечно-сосудистыми заболеваниями (например, сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, инфаркт миокарда в анамнезе, сердечная аритмия, артериальная гипертензия).
- Пациенты с нарушениями мозгового кровообращения, перенесшие инсульты. Рекомендуются отложить стоматологическое лечение с использованием артикаина/адреналина на 6 месяцев после инсульта из-за повышенного риска возникновения повторных инсультов.
- Пациенты с неконтролируемым диабетом. Данный лекарственный препарат следует использовать с осторожностью из-за гипогликемического эффекта адреналина.
- Пациенты с тиреотоксикозом. Данный лекарственный препарат следует использовать с осторожностью из-за наличия адреналина.
- Пациенты с феохромоцитомой.
- Пациенты с предрасположенностью к острой закрытоугольной глаукоме.

– Следует применять наименьшую эффективную для анестезии дозу.

Данный лекарственный препарат следует использовать безопасно и эффективно при соответствующих условиях:

Адреналин уменьшает кровоток в деснах, что может вызвать местный некроз тканей.

Сообщалось об очень редких случаях длительного или необратимого повреждения нервов и потери вкусовых ощущений после блокады нижнечелюстного нерва.

Эффективность местного анестетика может быть снижена, если данный лекарственный препарат введен в воспаленную или инфицированную область.

Дозу также следует уменьшить при гипоксии, гиперкалиемии и метаболическом ацидозе.

Рекомендуется посоветовать пациенту воздержаться от приема пищи, в том числе от употребления жевательной резинки, до момента восстановления нормальной чувствительности, поскольку существует риск травматизации губ, слизистой оболочки щек, языка из-за прикусывания, особенно у детей.

Данный лекарственный препарат содержит натрия метабисульфит. В редких случаях сульфит может вызывать реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

Данный лекарственный препарат содержит менее 1 ммоль натрия (23 мг) в одном картридже; это означает, что препарат практически «не содержит натрия».

Если существует риск возникновения аллергической реакции, следует выбрать другой лекарственный препарат для анестезии (см. раздел 4.3).

Меры предосторожности при использовании

Риски, связанные со случайной инъекцией в сосуд

Случайная инъекция в сосуд может вызвать внезапное повышение уровней адреналина и артикаина в большом круге кровообращения. Это может быть связано с развитием серьезных нежелательных реакций, таких как судороги, за которыми следует угнетение сердечно-легочной и центральной нервной системы, и кома, прогрессирующая до остановки дыхания и кровообращения.

Таким образом, для предотвращения попадания иглы в кровеносный сосуд во время инъекции следует проводить аспирацию шприцом перед введением местного анестетика. Тем не менее, отсутствие крови в шприце не гарантирует, что удалось избежать введения препарата в сосуд.

Риски, связанные с интраневральной инъекцией

Случайная интраневральная инъекция может привести к движению лекарственного препарата по нерву.

Для предотвращения интраневральной инъекции и повреждения нерва, связанного с блокадой нерва, иглу следует слегка оттянуть назад, если во время введения инъекции пациент ощущает боль, напоминающую «удар электрическим током», или если инъекция очень болезненна.

При повреждении нерва в результате введения иглы неврологический эффект может усугубляться потенциальной химической нейротоксичностью артикаина и присутствием адреналина, поскольку адреналин способен уменьшить периневральное кровоснабжение и препятствовать местному вымыванию артикаина.

4.5 Взаимодействия с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Взаимодействия с артикаином

Взаимодействия, требующие соблюдения мер предосторожности при использовании

Другие местные анестетики

Токсичность местных анестетиков является аддитивной.

Суммарная доза всех вводимых местных анестетиков не должна превышать максимальную рекомендуемую дозу используемых лекарственных препаратов.

Седативные препараты (препараты, оказывающие угнетающее действие на центральную нервную систему, например, бензодиазепины, опиаты). При использовании седативных препаратов для уменьшения тревожности пациента следует использовать сниженные дозы анестетиков, поскольку местные анестетики, как и седативные препараты, являются препаратами, оказывающими угнетающее действие на центральную нервную систему, которые при совместном применении могут иметь аддитивный эффект (см. раздел 4.2).

Взаимодействия с адреналином

Взаимодействия, требующие соблюдения мер предосторожности при использовании

Летучие галогенированные анестетики (например, галотан)

Необходимо применять сниженные дозы лекарственного препарата из-за сенсibilизации сердца к аритмогенному действию катехоламинов: существует риск развития тяжелой желудочковой аритмии.

Перед применением местных анестетиков во время общей анестезии рекомендуется проконсультироваться с анестезиологом.

Постганглионарные адреноблокаторы (например, гуанадрел, гуанетидин и алкалоиды раувольфии)

Необходимо применять с осторожностью сниженные дозы лекарственного препарата под строгим медицинским контролем ввиду возможного усиления реакции на адренергические вазоконстрикторы: существует риск развития артериальной гипертензии и других реакций со стороны сердечно-сосудистой системы.

Неселективные бета-адреноблокаторы (например, пропранолол, надолол)

Необходимо использовать сниженные дозы лекарственного препарата из-за возможного повышения артериального давления и увеличения риска развития брадикардии.

Трициклические антидепрессанты (ТЦА) (например, амитриптилин, дезипрамин, имипрамин, нортриптилин, мапротилин и протриптилин)

Необходимо снизить дозу и скорость введения данного лекарственного препарата из-за повышения риска развития тяжелой артериальной гипертензии.

Ингибиторы катехол-О-метилтрансферазы (КОМТ) (например, энтакапон, толкапон)

Могут возникнуть аритмии, учащенное сердцебиение и изменения артериального давления. Пациентам, получающим лечение ингибиторами КОМТ, необходимо вводить уменьшенное количество адреналина для анестезии в стоматологии.

Ингибиторы МАО (как селективные МАО-А (например, моклобемид), так и неселективные (например, фенелзин, транилципромин, линезолид)

Если нельзя избежать одновременного применения этих средств, необходимо уменьшить дозу и скорость введения данного лекарственного препарата и применять препарат под строгим медицинским наблюдением из-за возможного усиления эффектов адреналина с последующим риском развития гипертонического криза.

Лекарственные препараты, вызывающие аритмии (например, антиаритмические препараты, такие как дигиталис, хинидин)

Необходимо уменьшить вводимую дозу данного лекарственного препарата из-за повышенного риска развития аритмии при одновременном введении пациентам адреналина и сердечных гликозидов. Перед введением лекарственного препарата рекомендуется с осторожностью выполнить аспирацию.

Лекарственные препараты, стимулирующие родовую деятельность, на основе спорыньи (например, метисергид, эрготамин, эргоновин)

Данный лекарственный препарат следует применять под строгим медицинским наблюдением из-за аддитивного или синергического повышения артериального давления и/или ишемической реакции.

Симпатомиметические вазопрессоры (например, в первую очередь, кокаин, но также и амфетамины, фенилэфрин, псевдоэфедрин, оксиметазолин)

Существует риск развития адренергической токсичности.

Если в течение 24 часов использовался симпатомиметический вазопрессор, плановое стоматологическое лечение следует отложить.

Фенотиазины (и другие нейролептики)

С осторожностью применять у пациентов, получающих лечение фенотиазинами, ввиду риска развития артериальной гипотензии из-за возможного ингибирования эффекта адреналина.

4.6 Фертильность, беременность, лактация

Беременность

Исследования на животных с артикаином в дозе 40 мг/мл и адреналином в дозе 10 мкг/мл и только с артикаином не выявили нежелательных реакций в отношении беременности, развития эмбриона/плода, родов или постнатального развития (см. раздел 5.3).

Исследования на животных показали, что адреналин токсичен в отношении репродуктивной функции при введении в дозах, превышающих максимально рекомендуемую дозу (см. раздел 5.3).

Отсутствует опыт применения артикаина у беременных женщин, за исключением родов.

Адреналин и артикаин проникают через плацентарный барьер, при этом артикаин проникает через него в меньшей степени, чем другие местные анестетики. Концентрации артикаина в сыворотке крови у новорожденных составляли примерно 30 % от концентраций у матерей. При случайном введении в сосуд матери адреналин может снизить перфузию матки.

Во время беременности препарат Ораблук следует применять исключительно после тщательного анализа соотношения риск/польза.

Предпочтительно использовать препарат Ораблук 40 мг/1 мл + 5 мкг/1 мл, раствор для инъекций, вместо препарата Ораблук 40 мг/1 мл + 10 мкг/1 мл, раствор для инъекций, учитывая более низкое содержание в нем адреналина.

Лактация

Вследствие быстрого снижения уровня артикаина в сыворотке крови и его быстрого выведения в грудное молоко не выявляются клинически значимые количества артикаина.

Адреналин проникает в грудное молоко, но имеет короткий период полувыведения.

Как правило, нет необходимости приостанавливать грудное вскармливание при кратковременном применении препарата, рекомендуется начинать грудное вскармливание по истечении 5 часов после анестезии.

Фертильность

Исследования на животных, проводимые с применением артикаина 40 мг/мл + адреналина 10 мкг/мл, не выявили влияния на репродуктивную функцию (см. раздел 5.3). При применении терапевтических доз не ожидается нежелательного воздействия на репродуктивную функцию человека

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Комбинация артикаина гидрохлорида и адреналина тартрата в растворе для инъекций может оказывать незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. После введения препарата Ораблук может возникнуть головокружение (включая системное головокружение, нарушения со стороны органов зрения и утомляемость) (см. раздел 4.8). Поэтому по окончании стоматологической процедуры пациентам не следует покидать стоматологический кабинет до тех пор, пока они полностью не восстановятся (как правило, в течение 30 минут).

4.8 Нежелательные реакции

а) Резюме профиля безопасности



Нежелательные реакции после введения артикаина/адреналина аналогичны реакциям, наблюдаемым при применении других местных анестетиков/вазоконстрикторов амидного типа. Эти нежелательные реакции, как правило, являются зависимыми от введенной дозы. Они также могут быть результатом гиперчувствительности, индивидуальной непереносимости или сниженной переносимости со стороны пациента. Наиболее частыми нежелательными реакциями являются нарушения со стороны нервной системы, реакции в месте введения инъекции, гиперчувствительность, нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы. Серьезные нежелательные реакции, как правило, носят системный характер.

б) Перечень нежелательных реакций

Для классификации частоты нежелательных реакций используются следующие категории:

Очень часто ($\geq 1/10$);

Часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$);

Нечасто ($\geq 1/1\,000$, $< 1/100$);

Редко ($\geq 1/10\,000$, $< 1/1\,000$);

Очень редко ($< 1/10\,000$);

Частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно)

Классификация Системно-органный класс согласно MedDRA	Частота	Нежелательные реакции
Инфекции и инвазии	Часто	Гингивит
Нарушения со стороны иммунной системы	Редко	Аллергические реакции ¹ : анафилактические/анафилактоидные реакции
Психические нарушения	Редко	Нервозность/тревожность ⁴
	Неизвестно	Эйфория
Нарушения со стороны нервной системы	Часто	Невропатия: Невралгия (нейропатическая боль) Гипестезия/онемение (оральная и периоральная) ⁴ Гиперстезия Дистезия (оральная и периоральная) включая Дисгевзия (например, металлический привкус во рту, искажение вкусовых ощущений) Агевзия Аллодиния Термогиперестезия Головная боль
	Нечасто	Чувство жжения
	Редко	Нарушения со стороны лицевого нерва ² (блокада, парез и паралич) Синдром Горнера (блефароптоз, энофтальм, миоз). Сонливость Нистагм
	Очень редко	Парестезия ³ (стойкая гипестезия и

		потеря вкусовых ощущений) после блокады нижнечелюстного или альвеолярного нервов
Нарушения со стороны органа зрения	Редко	Диплопия (паралич глазодвигательных мышц) ⁴ Нарушение зрения (временная слепота) ⁴ Птоз Миоз Энофтальм
Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта	Редко	Гиперакузия Звон в ушах ⁴
Нарушения со стороны сердца	Часто	Брадикардия Тахикардия
	Редко	Учащенное сердцебиение
	Неизвестно	Нарушения сердечной проводимости (атриовентрикулярная блокада)
Нарушения со стороны сосудов	Часто	Артериальная гипотензия (с возможной сосудистой недостаточностью)
	Нечасто	Артериальная гипертензия
	Редко	Приливы
	Неизвестно	Местная/региональная гиперемия Расширение кровеносных сосудов Сужение кровеносных сосудов
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения	Редко	Бронхоспазм/астма Одышка ²
	Неизвестно	Дисфония (охриплость голоса) ¹ 
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	Часто	Отек языка, губ, десен
	Нечасто	Стоматит, глоссит, тошнота, рвота, диарея
	Редко	Задержка выпадения зубов Фиссуры / изъязвление десен/слизистой оболочки полости рта
	Неизвестно	Дисфагия  Отек щек Глоссалгия
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	Нечасто	Сыпь Зуд
	Редко	Ангioneвротический отек (отек лица / языка / губ / горла / гортани / периорбитальной зоны)  Крапивница
	Неизвестно	Эритема, гипергидроз
Нарушения со стороны	Нечасто	Боль в шее

мышечной, скелетной и соединительной ткани	Редко	Непроизвольное сокращение мышц ⁴
	Неизвестно	Ухудшение симптомов со стороны нервно-мышечной системы при синдроме Кернса-Сейра (судорожное сжатие челюстей)
Общие нарушения и реакции в месте введения	Нечасто	Боль в месте инъекции
	Редко	Отшелушивание/некроз в месте инъекции Усталость, астения (слабость) / озноб
	Не известно	Местный отек Ощущение жара Ощущение холода

с) Описание специфических нежелательных реакций

¹Аллергические реакции не следует путать со случаями обморока (учащенное сердцебиение из-за введения адреналина).

²Описана двухнедельная задержка начала развития паралича лицевого нерва после введения артикаина в комбинации с адреналином; состояние оставалось неизменным спустя 6 месяцев.

³Эти невропатии могут проявляться различными симптомами атипичных ощущений. Парестезию можно определить как обычно безболезненные атипичные спонтанные ощущения (например, жжения, щипания, покалывания или зуда), которые сохраняются после ожидаемой продолжительности анестезии. Большинство случаев парестезии, зафиксированных после стоматологического лечения, носят временный характер и проходят в течение нескольких дней, недель или месяцев.

Стойкая парестезия, в большинстве случаев возникающая в результате повреждения нижнечелюстных нервов, характеризуется медленным или неполным восстановлением или отсутствием восстановления.

⁴Некоторые нежелательные явления, такие как возбуждение, тревожность/нервозность, тремор, нарушения речи, могут быть предупредительными признаками угнетения ЦНС. При наличии перечисленных признаков пациенту следует порекомендовать сделать глубокие вдохи и выдохи, при этом его следует держать под наблюдением (см. раздел 4.9).

д) Пациенты детского возраста

Профиль безопасности у детей и подростков в возрасте от 4 до 18 лет был схожим по сравнению со взрослыми. Тем не менее, чаще наблюдаются случайные повреждения тканей, особенно у детей в возрасте от 3 до 7 лет, вследствие длительной анестезии мягких тканей.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения "польза - риск" лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

Республика Беларусь

УП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении» Министерства здравоохранения Республики Беларусь

Адрес: 220037, г. Минск, Товарищеский пер., 2а

Телефон отдела фармаконадзора: +375 (17) 242-00-29; факс: +375 (17) 242-00-29

Эл. почта: rcpl@rceth.by, rceth@rceth.by



4.9 Передозировка

Виды передозировки

Термин «передозировка местным анестетиком» в широком смысле зачастую используется для описания:

- абсолютной передозировки;
- относительной передозировки, например:
 - случайная инъекция в кровеносный сосуд или
 - чрезмерно быстрое попадание в системный кровоток
 - задержка метаболизма и выведения лекарственного препарата.

При относительной передозировке симптомы у пациентов, как правило, возникают в течение первых нескольких минут, тогда как при абсолютной передозировке признаки токсичности появляются спустя некоторое время после введения инъекции, в зависимости от места введения.

Симптомы

При передозировке (абсолютной или относительной), поскольку состояние возбуждения ЦНС может быть временным или вообще отсутствовать, первые проявления могут быть представлены сонливостью, приводящей к потере сознания и остановке дыхания.

Симптомы, вызываемые артикаином

Симптомы являются зависимыми от дозы и имеют прогрессирующую тяжесть на фоне неврологических проявлений (предобморочное состояние, обморок, головная боль, беспокойство, возбуждение, спутанность сознания, дезориентация, головокружение (оглушение), тремор, помутнение сознания, выраженное угнетение ЦНС, потеря сознания, кома, судороги (в том числе тонико-клонические судороги), речевые нарушения (например, дизартрия, логорея), головокружение, нарушения равновесия (дисбалансы)), проявлений со стороны органов зрения (мигриаз, нечеткость зрения, проблемы фокусировки), сопровождающихся сосудистой токсичностью (бледность (локальная, регионарная, общая)), респираторной токсичностью (апноэ (остановка дыхания), брадипноэ, полипноэ, зевота, дыхательная недостаточность) и, наконец, кардиотоксичностью (остановка сердца, угнетение сократительной функции миокарда).

Ацидоз усиливает токсические эффекты местных анестетиков.

Симптомы, вызываемые адренилином

Симптомы являются зависимыми от дозы и имеют прогрессирующую тяжесть на фоне неврологических проявлений (беспокойство, возбуждение, предобморочное состояние, обморок), сопровождающихся сосудистой токсичностью (бледность (локальная, регионарная, общая)), респираторной токсичностью (апноэ (остановка дыхания), брадипноэ, полипноэ, дыхательная недостаточность) и, наконец, кардиотоксичностью (остановка сердца, угнетение сократительной функции миокарда).

Лечение передозировки

Перед введением местной анестезии с использованием местных анестетиков необходимо убедиться в наличии реанимационного оборудования и лекарственных препаратов для обеспечения незамедлительного лечения любых неотложных респираторных и сердечно-сосудистых заболеваний.

Тяжесть симптомов при передозировке должна заставить врача/стоматолога следовать протоколам, включающим необходимость незамедлительно наложить маску на верхние дыхательные пути и обеспечить искусственную вентиляцию легких. Состояние сознания пациента необходимо контролировать после каждой инъекции местного анестетика. При появлении признаков острой системной токсичности инъекционное введение местного анестетика следует немедленно прекратить. При необходимости следует перевести пациента в положение лежа.

Симптомы со стороны ЦНС (судороги, угнетение ЦНС) следует лечить незамедлительно с

помощью вспомогательной искусственной вентиляции лёгких/наложение маски на верхние дыхательные пути и введения противосудорожных препаратов.

Оптимальная оксигенация, вентиляция легких и вспомогательное кровообращение в сочетании с лечением ацидоза могут предотвратить остановку сердца.

При угнетении сердечно-сосудистой системы (артериальная гипотензия, брадикардия) целесообразно рассмотреть возможность проведения соответствующего лечения путем внутривенного введения вазопрессорных препаратов и/или инотропных препаратов. У детей вводимая доза должна соответствовать их возрасту и массе тела.

В случае остановки сердца необходимо незамедлительно начать сердечно-легочную реанимацию.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: Препараты для местной анестезии. Амиды. Код по классификации АТХ – N01BB58.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты:

Артикаин, местный анестетик амидного типа, обратимо блокирует нервную проводимость по известному механизму, обычно наблюдаемому при использовании других местных анестетиков амидного типа. Этот механизм заключается в уменьшении или предотвращении сильного временного повышения проницаемости возбудимых мембран для натрия (Na^+), обычно вызываемой небольшой деполяризацией мембраны. Это вызывает анестезирующее действие. По мере усиления анестезирующего действия в нерве постепенно увеличивается порог электрической возбудимости, снижается скорость увеличения потенциала действия и замедляется проведение импульсов.

Расчетная константа диссоциации (pKa) артикаина составляет 7,8.

Адреналин, как вазоконстриктор, действует непосредственно на α -адрено- и β -адренорецепторы с преобладанием воздействия на β -адренорецепторы. Адреналин увеличивает продолжительность действия артикаина и снижает риск чрезмерного попадания артикаина в системный кровоток.

Клиническая эффективность и безопасность: Препарат Ораблук имеет начало действия через 1,5-1,8 мин после введения при инфильтрационной анестезии и 1,4-3,6 мин при локорегионарной анестезии.

Продолжительность анестезирующего действия артикаина 40 мг/мл с адреналином 1:100 000 варьируется от 60 до 75 минут при пульпарной анестезии и от 180 до 360 минут при анестезии мягких тканей.

Продолжительность анестезирующего действия артикаина 40 мг/мл с адреналином 1:200 000 варьируется от 45 до 60 минут при пульпарной анестезии и от 120 до 300 минут при анестезии мягких тканей.

Не наблюдалось никаких различий в фармакодинамических свойствах между взрослыми пациентами и пациентами детского возраста.

5.2 Фармакокинетические свойства

Артикаин

Абсорбция: В трех опубликованных клинических исследованиях, описывающих фармакокинетический профиль комбинации артикаина гидрохлорида 40 мг/мл с адреналином 10 или 5 мкг/мл, значения T_{max} составляли от 10 до 12 минут, а значения C_{max} – от 400 до 2100 нг/мл. В клинических исследованиях, проведенных с участием пациентов детского возраста, значение C_{max} составляло 1382 нг/мл, а значение T_{max} – 7,78 минут после инфильтрации в дозе 2 мг/кг массы тела.

6.1 Перечень вспомогательных веществ

Натрия хлорид
Натрия метабисульфит
Вода для инъекций.

6.2 Несовместимость

Не применимо.

6.3 Срок годности

2 года.

6.4 Особые меры предосторожности при хранении

При температуре не выше 25°C.

6.5 Характер и содержание первичной упаковки

По 1,8 мл в картриджи из стекла типа I, укупоренные алюминиевым колпачком и пробкой из бромбутилового каучука, а также поршнем из бромбутилового каучука.

По 10 картриджей упаковывают в прозрачные контурные пластиковые упаковки, 5 контурных упаковок вместе с листком-вкладышем помещают в пачки из картона.

6.6 Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата или работы с ним

Во избежание риска инфицирования (например, передачи гепатита) шприцы и иглы, используемые для аспирации раствора, всегда должны быть новыми и стерильными.

Данный лекарственный препарат не следует использовать, если раствор мутный или изменил цвет.

Картриджи предназначены для однократного применения. В случае частичного использования картриджа остаточный раствор необходимо утилизировать.

Применять незамедлительно после вскрытия картриджа.

Неиспользованные лекарственные препараты и отходы, полученные от таких лекарственных препаратов, необходимо утилизировать в соответствии с действующим местным законодательством.

6.7 Условия отпуска из аптек

Отпускается по рецепту.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

«Перрель С.п.А.» (Pierrel S.p.A.)

Страда Статале Аппиа 7 Бис, 46/48 - 81043 Капуа (СЕ), Италия

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

ООО «ВМК-Мед»

220062, Республика Беларусь, г. Минск, ул. Ратомская 7-1г,

+375 17 316 54 03

vmk.sale@gmail.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

№11312/24

9892 - 2024

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ

29.04.2024

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

ММ/ТТГГ

