

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Orabloc, (40 mg + 0,005 mg)/ml, roztwór do wstrzykiwań

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 ml roztworu do wstrzykiwań zawiera 40 mg artykainy chlorowodoru oraz 0,005 mg adrenaliny (epinefryny) w postaci adrenaliny winianu.

Jeden wkład o pojemności 1,8 ml roztworu do wstrzykiwań zawiera 72 mg artykainy chlorowodoru oraz 0,009 adrenaliny (epinefryny) w postaci adrenaliny winianu.

Substancja pomocnicza o znanym działaniu:

Zawiera 0,5 mg/ml pirosiarczynu sodu (E223).

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Roztwór do wstrzykiwań.

Przejrzysty, bezbarwny roztwór do wstrzykiwań.

pH roztworu waha się od 3,0 do 4,5.

Osmolarność: 270 mOsm/KG

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Orabloc jest wskazany u pacjentów dorosłych, młodzieży i dzieci w wieku od 4 lat, oraz osób starszych w celu miejscowego znieczulenia (znieczulenie nasiętkowe oraz zniesienie napięcia mięśni) w stomatologii.

Rutynowe zabiegi, takie jak nieskomplikowane pojedyncze lub seryjne ekstrakcje zębów, usuwanie kamienia nazębnego i przygotowanie do koronek zębowych.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

W przypadku prostych ekstrakcji zębów górnych bez obecności stanu zapalnego wystarcza zazwyczaj iniekcja od strony przedsionka jamy ustnej 1,8 ml roztworu na ząb. W pojedynczych przypadkach w celu uzyskania całkowitego znieczulenia może być konieczna dodatkowa iniekcja 1–1,8 ml roztworu od strony przedsionka jamy ustnej. Bolesna iniekcja od strony podniebiennej nie jest zwykle konieczna.

W przypadku nacinania lub zszywania tkanek podniebienia wystarczające jest wykonanie iniekcji o objętości ok. 0,1 ml roztworu na wklucie.

W razie konieczności wykonania mnogich ekstrakcji przyległych zębów, w większości przypadków możliwe jest zmniejszenie liczby wymaganych iniekcji od strony przedsionka jamy ustnej.

W przypadku prostych ekstrakcji dolnych przedtrzonowców bez obecności stanu zapalnego, wystarcza zazwyczaj iniekcja 1,8 ml roztworu na ząb. Jeżeli nie uzyskano całkowitego znieczulenia zaleca się wykonanie dodatkowej iniekcji 1–1,8 ml roztworu od strony przedsionka jamy ustnej. Jeśli powyższe procedury nie dają całkowitego znieczulenia, wskazane jest wykonanie iniekcji do otworu żuchwowego.

W wypełnieniach oraz szlifowaniu kikutów zęba – z wyjątkiem dolnych przedtrzonowców – zalecane wstrzyknięcie od strony przedsionka jamy ustnej roztworu Orabloc 0,5-1,8 ml na ząb, dawkowanie zależy od zakresu i czasu trwania zabiegu.

U dorosłych maksymalna dawka artykainy wynosi 7 mg na kilogram masy ciała. W przypadku znieczulenia nasiękowego dawki do 500 mg (co odpowiada 12,5 ml roztworu do wstrzykiwań) były dobrze tolerowane.

Pacjenci w podeszłym wieku oraz z pacjentami z ciężkimi zaburzeniami czynności wątroby i nerek

U pacjentów w podeszłym wieku oraz pacjentów z ciężkimi zaburzeniami czynności wątroby i nerek stężenie artykainy w osoczu może ulec podwyższeniu. U osób tych zaleca się zastosowanie najmniejszej dawki potrzebnej do uzyskania całkowitego znieczulenia.

Dzieci i młodzież

U dzieci i młodzieży zalecane jest stosowanie najmniejszej dawki produktu Orabloc potrzebnej do uzyskania odpowiedniego znieczulenia; objętość iniekcji powinna być indywidualnie dostosowana do wieku i masy ciała dziecka i osoby młodocianej.

Nie należy przekraczać maksymalnej dawki 5 mg artykainy na kilogram masy ciała.

Produktu nie badano u dzieci poniżej pierwszego roku życia.

Sposób podawania

Do stosowania wyłącznie w znieczuleniach w stomatologii.

W celu uniknięcia podania produktu do naczynia krwionośnego, przed wstrzyknięciem zaleca się wykonanie aspiracji w dwóch etapach, np. po obrocie igły o 90°, lub jeszcze lepiej o 180°.

W większości przypadków można uniknąć cięższych reakcji ogólnych związanych z przypadkowym wstrzyknięciem do naczynia krwionośnego poprzez zastosowanie odpowiedniej techniki iniekcji: po wykonaniu aspiracji należy powoli wstrzyknąć 0,1 – 0,2 ml roztworu, a pozostałą część – również powoli i nie wcześniej niż po upływie 20 – 30 sekund.

Aby uniknąć ryzyka zakażenia (np. wirusem zapalenia wątroby) strzykawki i igły wykorzystywane do sporządzania roztworu zawsze powinny być nowe i jałowe.

Do jednorazowego użytku. Niewykorzystaną ilość roztworu należy zutylizować.

Nie należy stosować produktu leczniczego, jeśli jest mętny lub ma zmienioną barwę.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancje czynne lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.

Z uwagi na zawartość artykainy, produktu Orabloc nie należy stosować w następujących przypadkach:

- nadwrażliwość na inne środki znieczulające miejscowo z grupy amidów,
- ciężkie zaburzenia czynności węzła zatokowego i przewodzenia (np. blok przedsionkowo-komorowy drugiego i trzeciego stopnia, znaczna bradykardia),
- ostra niewyrównana niewydolność serca (ostra zastoinowa niewydolność serca),
- ciężkie niedociśnienie

- u dzieci poniżej 4 roku życia

Z uwagi na zawartość adrenaliny produktu leczniczego Orabloc nie należy stosować w następujących przypadkach:

- znieczulenie zakończeń nerwowych
- pacjenci z jaskrą z wąskim kątem przesączania
- pacjenci z nadczynnością tarczycy
- pacjenci z napadowym częstoskurczem lub migotaniem przedsionków z szybką akcją serca
- pacjenci po niedawno przeżytym zawale mięśnia sercowego (3 do 6 miesięcy)
- pacjenci po niedawno przeżytym (3 miesiące) zabiegu wszczepienia pomostów aortalno-wieńcowych (by-passów),
- pacjenci, u których jednocześnie stosuje się nieselektywne beta-adrenolityki (np. propranolol) – ryzyko wystąpienia przełomu nadciśnieniowego lub ciężkiej bradykardii,
- pacjenci z guzem chromochłonnym,
- pacjenci z ciężkim nadciśnieniem,
- jednoczesne stosowanie trójpierścieniowych leków przeciwdepresyjnych lub inhibitorów MAO, ponieważ leki te mogą nasilać działania sercowo-naczyniowe adrenaliny. Działanie to może to utrzymywać się do 14 dni od zakończenia leczenia inhibitorami MAO.

Podawanie drogą dożylną jest przeciwwskazane.

Produktu leczniczego Orabloc nie wolno stosować u osób chorych na astmę oskrzelową z nadwrażliwością na siarczyny. U osób tych produkt Orabloc może spowodować ostrą reakcję alergiczną z objawami anafilaksji, takimi, jak skurcz oskrzeli.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

U osób z niedoborem cholinioesterazy produkt Orabloc należy stosować tylko w przypadkach istotnych wskazań, ponieważ jego działanie może ulec wydłużeniu lub być intensywniejsze.

W poniższych przypadkach należy zachować szczególną ostrożność podczas stosowania produktu leczniczego Orabloc:

- zaburzenia krzepnięcia krwi,
- ciężkie zaburzenia czynności nerek lub wątroby,
- jednoczesne stosowanie halogenowych anestetyków wziewnych (patrz punkt 4.5),
- padaczka w wywiadzie (patrz punkt 4.8)
- z chorobami sercowo-naczyniowymi (np. niewydolność serca, choroba niedokrwienna serca, dławica piersiowa, zawał mięśnia sercowego w wywiadzie, zaburzenia rytmu serca, nadciśnienie tętnicze),
- z miażdżycą,
- z zaburzeniami krążenia mózgowego, udarem mózgu w wywiadzie,
- z przewlekłym zapaleniem oskrzeli, rozedmą płuc,
- z cukrzycą,
- z ciężkimi zaburzeniami lękowymi

Nie zaleca się wykonywania iniekcji w miejsca objęte stanem zapalnym (zwiększony wychwyt produktu leczniczego Orabloc oraz jego zmniejszona skuteczność).

Przed zastosowaniem produktu należy zebrać od pacjenta wywiad dotyczący przebytych chorób i stosowanego leczenia. Należy również utrzymywać z pacjentem kontakt słowny a w przypadku występowania ryzyka uczulenia wykonać próbną iniekcję z zastosowaniem 5 lub 10% przewidzianej dawki.

W celu uniknięcia działań niepożądanych należy:

- wybierać możliwie najmniejszą dawkę,
- przed wstrzyknięciem roztworu zastosować dwuetapową aspirację (w celu uniknięcia przypadkowego podania roztworu do naczynia krwionośnego).

Powinny być dostępne urządzenia i leki niezbędne do kontroli oraz do resuscytacji (tlen, leki przeciwdrgawkowe, jak benzodiazepiny lub barbiturany, środki zwiotczające mięśnie, atropina i wazopresyna lub adrenalina w razie silnych reakcji alergicznych lub anafilaktycznych).

Zaleca się, aby pacjent powstrzymywał się od przyjmowania pokarmów aż do ustąpienia znieczulenia.

Dzieci i młodzież

Opiekunowie małych dzieci powinni być świadomi ryzyka wystąpienia przypadkowych urazów tkanek miękkich na skutek ugryzienia z powodu ich przedłużonego zdrętwienia.

Ten produkt leczniczy zawiera pirosiarczyn sodu (E223), który niekiedy może powodować ciężkie reakcje nadwrażliwości i skurcz oskrzeli.

Ten produkt leczniczy zawiera mniej niż 1 mmol sodu (23 mg) w dawce, to znaczy, lek uznaje się za "wolny od sodu".

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Połączenia różnych środków znieczulających mogą wywierać dodatkowe działanie na układ sercowo-naczyniowy oraz na ośrodkowy układ nerwowy (CNS).

Działanie sympatykomimetyków (takich jak adrenalina) zwiększających ciśnienie tętnicze krwi może ulec wzmocnieniu przy jednoczesnym stosowaniu trójpierścieniowych leków przeciwdepresyjnych lub inhibitorów MAO, w związku z czym ich istnieje przeciwwskazanie do ich stosowania (patrz punkt 4.3).

W celu uzyskania informacji dotyczących jednoczesnego stosowania nieselektywnych beta-adrenolityków patrz punkt 4.3.

Adrenalina może hamować uwalnianie insuliny z trzustki, osłabiając działanie doustnych leków przeciwcukrzycowych.

Niektóre wziewne środki znieczulające (jak halotan) mogą zwiększać wrażliwość mięśnia sercowego na aminy katecholowe i w związku z tym powodować zaburzenia rytmu serca po podaniu produktu leczniczego Orabloc.

Fenotiazyny mogą wpływać na wzrost ciśnienia krwi spowodowany działaniem epinefryny. Dlatego należy unikać ich jednoczesnego stosowania. Jeśli jednoczesne przyjmowanie fenotiazyn jest niezbędne pacjentowi powinni pozostawać pod stałą kontrolą.

Należy pamiętać, że u pacjentów stosujących leczenie przeciwzakrzepowe (np. heparynę lub kwas acetylosalicylowy) występuje zwiększona tendencja do krwawień, a przypadkowe wstrzyknięcie produktu do naczynia krwionośnego może spowodować poważne krwawienie.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Brak doświadczenia dotyczącego stosowania artykainy u kobiet w ciąży, z wyjątkiem kobiet podczas porodu. Badania na zwierzętach nie wskazują, by artykaina miała bezpośredni lub pośredni szkodliwy wpływ na ciążę, rozwój zarodka i płodu, poród oraz rozwój pourodzeniowy. Wykazały one jednak, że adrenalina w dawkach wyższych od maksymalnej zalecanej dawki ma toksyczne działanie na rozrodczość (patrz punkt 5.3)

Adrenalina i artykaina przechodzą przez barierę łożyskową, choć w przypadku artykainy zachodzi to w mniejszym stopniu niż w przypadku innych środków znieczulających miejscowo. Stężenie artykainy w surowicy krwi noworodków wynosiło ok. 30% stężenia w surowicy krwi matki. W przypadku omyłkowego podania produktu do naczynia krwionośnego u matki, adrenalina może zmniejszyć maciczy

przepływ krwi. Produkt leczniczy Orabloc można stosować w okresie ciąży jedynie po dokładnej analizie stosunku korzyści do ryzyka.

Karmienie piersią

Ze względu na szybki spadek stężenia w surowicy krwi oraz szybką eliminację, w mleku nie występują klinicznie znaczące ilości artykainy. Adrenalina przenika do mleka, ale jej okres półtrwania jest krótki. W przypadku krótkotrwałego stosowania produktu, przerywanie karmienia piersią zwykle nie jest konieczne.

Płodność

Badania na zwierzętach z zastosowaniem artykainy 40 mg/ml + oraz adrenaliny 0,01 mg/ml nie wykazały ich wpływu na płodność (patrz punkt 5.3). Ryzyko wystąpienia zdarzeń niepożądanych dotyczących ludzkiej płodności jest mało prawdopodobne podczas stosowania dawek leczniczych.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Po zastosowaniu produktu leczniczego Orabloc lekarz stomatolog powinien indywidualnie zdecydować, kiedy pacjent jest ponownie w stanie kierować pojazdem lub obsługiwać urządzenia mechaniczne.

Obawa oraz stres związany z zabiegiem mogą wpływać na sprawność pacjenta, jednak odpowiednie testy nie wykazały dostrzegalnego upośledzenia zdolności prowadzenia pojazdów po znieczuleniu z zastosowaniem artykainy.

4.8 Działania niepożądane

Częstość występowania działań niepożądanych określono w następujący sposób:

Bardzo często ($\geq 1/10$)

Często ($\geq 1/100$ to $< 1/10$)

Niezbyt często ($\geq 1/1.000$ to $< 1/100$)

Rzadko ($\geq 1/10.000$ to $< 1/1.000$)

Bardzo rzadko ($< 1/10.000$)

Częstość nieznana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych)

Zaburzenia układu immunologicznego

Częstość nieznana: Alergie lub reakcje nadwrażliwości typu alergicznego. Mogą się one przejawiać w postaci obrzęku i (lub) stanu zapalnego w miejscu wstrzyknięcia lub mogą występować niezależnie od miejsca wstrzyknięcia w postaci zaczerwienienia skóry, świądu, zapalenia spojówek, nieżyty nosa, obrzęku twarzy (obrzęk naczynioruchowy) z obrzękiem górnej i (lub) dolnej wargi i (lub) policzków, obrzęku głośni z uczuciem ściskania w gardle oraz trudnościami w połykaniu, pokrzywki, a także trudności w oddychaniu, które mogą przejść we wstrząs anafilaktyczny.

Zaburzenia układu nerwowego

Często: parestezja, hipoestezja, bóle głowy – prawdopodobnie jako skutek zawartości adrenaliny w produkcie;

Niezbyt często: zawroty głowy

Częstość nieznana:

- Mogą występować reakcje ośrodkowego układu nerwowego związane z dawką (w szczególności w przypadku bardzo wysokich dawek lub przypadkowego wstrzyknięcia do naczynia krwionośnego): pobudzenie, nerwowość zamroczenie przechodzące czasem w utratę przytomności, śpiączka, zaburzenia oddychania prowadzące niekiedy do w zatrzymanie oddechu, drżenia mięśniowe i kurcze mięśniowe, uogólnione drgawki.
- Uszkodzenia nerwów (np. porażenie nerwu twarzowego) oraz zmniejszenie wrażliwości smakowej nie są specyficzne dla artykainy. Wystąpienie takich reakcji jest jednak możliwe podczas zabiegów stomatologicznych, ze względu na przebieg nerwów w obszarze wykonywania wstrzyknięcia lub nieprawidłową technikę wstrzyknięcia.

Zaburzenia oka

Częstość nieznana: przejściowe zaburzenia widzenia (zamazane widzenie, utrata widzenia, podwójne widzenie) występujące podczas lub wkrótce po iniekcji środka znieczulającego miejscowo w obszarze głowy.

Zaburzenia serca

Niezbyt często: częstoskurcz

Częstość nieznana: zaburzenia rytmu serca, wzrost ciśnienia tętniczego krwi, hipotensja, bradykardia, niewydolność serca oraz wstrząs (mogący zagrażać życiu).

Zaburzenia dróg oddechowych, klatki piersiowej oraz śródpiersia

Częstość nieznana: zaburzenia oddychania (przyspieszony oddech, spowolnienie oddechu), które mogą prowadzić do bezdechu.

Zaburzenia układu pokarmowego

Często: nudności, wymioty.

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Częstość nieznana: przypadkowe wstrzyknięcie do naczynia krwionośnego mogące prowadzić do powstania obszarów niedokrwienia w miejscu wstrzyknięcia, czasem przechodzących w martwicę tkanki (patrz również punkt 4.2).

Ze względu na zawartość pirościarczynu sodu produkt może wywoływać reakcje nadwrażliwości, szczególnie u pacjentów z astmą oskrzelową. Reakcje te mogą mieć postać wymiotów, biegunki, świstów, ostrych napadów astmy, zaburzeń przytomności lub wstrząsu.

Dzieci i młodzież:

W opublikowanych badaniach profil bezpieczeństwa dzieci w wieku od 4 do 18 lat był zbliżony do tego u dorosłych. Jednak, z powodu przedłużonego znieczulenia tkanek miękkich obserwowano w tej grupie częstsze występowanie przypadkowych urazów tkanek miękkich (do 16% dzieci) zwłaszcza w wieku od 3 do 7 lat. W badaniu retrospektywnym obejmującym 211 dzieci w wieku od 1 roku do 4 lat, u których leczenie stomatologiczne prowadzono z zastosowaniem 4,2 ml 4% artykainy z 0,005 mg/ml lub 0,01 mg/ml adrenaliny, nie odnotowano działań niepożądanych.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181 C, 02-222 Warszawa

Tel.: +48 22 49 21 301, Faks: + 48 22 49 21 309

Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

a) objawy przedawkowania

Pobudzenie OUN: niepokój, lęk, splątanie, pogłębienie oddechu, częstoskurcz, wzrost ciśnienia tętniczego krwi wraz z zaczerwienieniem skóry twarzy, nudnościami, wymiotami, drżeniem, skurczami, toniczno-klonicznymi napadami drgawek.

Depresja OUN: zawroty głowy, upośledzenie słuchu, utrata zdolności mówienia, utrata przytomności, atonia mięśniowa, porażenie naczynioruchowe (osłabienie, bledność), duszność, zgon z powodu porażenia układu nerwowego.

Depresja układu sercowo-naczyniowego: bradykardia, zaburzenia rytmu serca, migotanie komór, spadek ciśnienia tętniczego krwi, sinica, zatrzymanie akcji serca.

b) Środki zaradcze oraz antidotum

W przypadku pojawienia się pierwszych oznak działań niepożądanych lub objawów zatrucia, np. zawrotów głowy, niepokoju ruchowego lub stuporu, należy przerwać wykonywanie iniekcji i ułożyć pacjenta w pozycji poziomej. Należy zabezpieczyć drożność dróg oddechowych pacjenta oraz monitorować tętno oraz ciśnienie tętnicze krwi.

Zaleca się, nawet, jeśli objawy zatrucia nie wydają się ciężkie, założenie pacjentowi cewnika dożylnego, by w razie konieczności możliwe było wykonanie natychmiastowej iniekcji dożylnej.

W przypadku występowania zaburzeń oddychania, w zależności od ich nasilenia, zaleca się podawanie tlenu, a jeśli to konieczne – wykonanie sztucznego oddychania, oraz w razie konieczności intubacji dotchawiczej i sztucznej wentylacji.

W razie wystąpienia kurczów mięśni lub uogólnionych drgawek należy zastosować dożylną iniekcję krótko działającego leku przeciwdrgawkowego (np. chlorek suksametonium, diazepam). Zalecane jest również zastosowanie wspomagającego oddechu (podawanie tlenu).

Spadek ciśnienia tętniczego krwi, częstoskurcz lub bradykardię można opanować poprzez ułożenie pacjenta w pozycji poziomej, z głową nieco poniżej tułowia.

W przypadku wystąpienia ciężkich zaburzeń krążenia oraz wstrząsu – bez względu na ich przyczynę – należy po przerwaniu iniekcji wykonać następujące czynności:

- ułożyć pacjenta w pozycji poziomej lub z głową nieco poniżej tułowia oraz utrzymywać drożność dróg oddechowych (podanie tlenu),
- wykonać wlew dożylny (izotoniczny roztwór elektrolitów),
- podać drogą dożylną glukokortykosteroid (np. 250-1000 mg prednizolonu lub odpowiednią ilość jego pochodnej, np. metylprednizolonu),
- przetaczać płyny (dodatkowo, jeśli zachodzi taka konieczność, płyn zwiększający objętość osocza, ludzkie albuminy).

W przypadku zagrażającej zapaści oraz nasilającej się bradykardii należy natychmiast podać dożylnie adrenalinę (epinefrynę). Po rozcieńczeniu 1 ml roztworu adrenaliny 1:1 000 do objętości 10 ml (zamiast tego można użyć gotowego roztworu adrenaliny 1:10 000), wstrzykuje się powoli 0,25 - 1 ml otrzymanego roztworu (= 0,025 – 0,1 mg adrenaliny) monitorując tętno oraz ciśnienie tętnicze krwi (ostrzeżenie: występowanie zaburzeń rytmu serca). Nie należy przekraczać objętości 1 ml (0,1 mg adrenaliny) na iniekcję. W przypadku konieczności zastosowania większej ilości adrenaliny, należy podawać ją razem z roztworem do infuzji i dostosować szybkość podawania do częstości tętna oraz wartości ciśnienia tętniczego krwi.

Jeżeli wystąpi znaczna tachykardia lub tachyarytmia można stosować leki antyarytmiczne, z wyjątkiem nieselektywnych beta-adrenolityków, np. propranololu (patrz punkt 4.3). W takich przypadkach należy podać tlen i monitorować parametry krążenia.

Wzrost ciśnienia tętniczego krwi u osób z nadciśnieniem można w razie konieczności kontrolować podając leki rozszerzające obwodowe naczynia krwionośne.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: środki znieczulające miejscowo, amidy.
Kod ATC: N01BB58

Produkt leczniczy Orabloc jest środkiem znieczulającym miejscowo z grupy amidów, stosowanym do znieczuleń w stomatologii. Jest środkiem szybko działającym (początek działania po 1-3 minutach) i silnie znieczulającym, oraz dobrze tolerowanym.

Czas trwania skutecznego znieczulenia wynosi ok. 45 minut dla produktu Orabloc 0,005 mg/ml i ok. 75 min dla produktu Orabloc 0,01 mg/ml.

Mechanizm działania artykainy polega prawdopodobnie na hamowaniu przewodnictwa we włóknach nerwowych poprzez blokadę zależnych od napięcia kanałów Na⁺ w błonie komórkowej.

Ze względu na bardzo niewielkie stężenie adrenaliny oraz silne działanie produkt leczniczy Orabloc 0,005 mg/ml nadaje się do stosowania u pacjentów z chorobami serca i naczyń.

Dzieci i młodzież

Badania kliniczne obejmujące populację do 210 dzieci w wieku od 3,5 roku do 16 lat wykazały, że 4% artykaina + 0,005 mg/ml adrenaliny w dawkach do 5 mg/kg masy ciała, a także 4% artykaina + 0,010 mg/ml adrenaliny w dawkach do 7 mg/kg masy ciała zapewnia skuteczne znieczulenie miejscowe, jeśli jest podawana nasiętkowo (żuchwowo) lub poprzez blok nerwu (szczękowo). Czas trwania znieczulenia był zbliżony we wszystkich grupach wiekowych i zależał od podanej ilości.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Artykaina wiąże się z białkami osocza w około 95%. Okres półtrwania po podśluzówkowej iniekcji w jamie ustnej wynosi $25,3 \pm 3,3$ min. Artykaina jest w 10% metabolizowana w wątrobie, głównie przez esterazy osoczowe i tkankowe, oraz wydalana z moczem, głównie w postaci kwasu artykainowego.

U dzieci ekspozycja po nasiętkowym znieczuleniu w przedślonkowej części jamy ustnej jest podobna jak u dorosłych, lecz maksymalne stężenie w surowicy jest osiągnięte szybciej.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Dane niekliniczne wynikające z konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa, badań toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności, potencjalnego działania rakotwórczego oraz toksycznego wpływu na rozród i rozwój potomstwa nie ujawniają żadnego szczególnego zagrożenia dla człowieka. Artykaina w dawkach większych niż terapeutyczne ma właściwości kardiodepresyjne i może rozszerzać naczynia krwionośne.

Adrenalina wykazuje działanie sympatykomimetyczne.

W badaniach dotyczących embriotoksyczności artykainy nie odnotowano zwiększenia śmiertelności płodów ani częstości występowania wad rozwojowych przy dożylnym stosowaniu dawek do 20 mg/kg (szczur) i 12,5 mg/kg (królik). Adrenalina w dawkach 0,1 do 5 mg/kg (wielokrotność dawki maksymalnej osiągalnej podczas stosowania produktu leczniczego złożonego z artykainy oraz adrenaliny) wykazała w badaniach na zwierzętach toksyczny wpływ na reprodukcję, w postaci wrodzonych wad rozwojowych oraz upośledzenia przepływu maciczno-łożyskowego.

W badaniach embriotoksyczności artykainy i adrenaliny nie odnotowano zwiększenia częstości występowania wad wrodzonych przy podskórnym stosowaniu artykainy w dawkach do 80 mg/kg (szczur) i 40 mg/kg (królik).

W badaniach nad płodnością i wczesnym rozwojem embrionalnym u szczurów nie odnotowano niepożądanego wpływu na płodność samców i samic podczas stosowania dawek wywołujących objawy toksyczne u rodziców.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Sodu chlorek
Sodu pirosiarczyn (E223)
Kwas solny 2% (do korekty pH)
Woda do wstrzykiwań

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

2 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 25 °C. Przechowywać w oryginalnym opakowaniu w celu ochrony przed światłem.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Wkład z bezbarwnego szkła typu I, zamknięty z obu stron korkiem z gumy bromobutyłowej (z których jeden pełni funkcję tłoka) oraz aluminiowym uszczelnieniem.

Wkład dostępny w różnych opakowaniach:

- Wkłady pakowane w blistry z PVC (10 wkładów/blister). Blistry pakowane są w tekturowe pudełka zawierające 5 x 10 lub 10 x 10 wkładów.
- Pojedynczy wkład umieszczony w plastikowym wstrzykiwaczu. Każdy wstrzykiwacz umieszczony jest w zgrzewanym blistrze. Wstrzykiwacz z wkładem pakowany w blistrze (1 wstrzykiwacz z wkładem/blister). Blistry pakowane są w tekturowe pudełka zawierające 50x1 lub 100x1 wstrzykiwaczy z wkładami, wraz z instrukcją użycia wstrzykiwacza.

Nie wszystkie rodzaje opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bezpośrednio przed użyciem uszczelkę gumową należy zdezynfekować za pomocą alkoholu etylowego do dezynfekcji (70%) lub alkoholem izopropylowym do dezynfekcji (90%).

Nie należy zanurzać fiolek w w/w roztworach.

Nie należy mieszać roztworu do wstrzykiwań z innymi produktami w tej samej strzykawce.

Wszelkie nieużyte ilości roztworu oraz odpady należy zutylizować zgodnie z lokalnymi przepisami.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

PIERREL PHARMA S.R.L. Strada Statale Appia 46/48, 81043 Capua (CE), Włochy
tel: +39 0823 626 111
fax: +39 0823 626 228
e-mail: PIERREL.PHARMA@LEGALMAIL.IT

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

21667

**9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU
I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA**

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 15.01.2014

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 15.01.2019

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI
PRODUKTU LECZNICZEGO**

17.02.2022