

## Инструкция

По медицинскому применению *лекарственного* препарата

### **Ораблок**

**Регистрационный номер:** ЛСР-004839/10

**Торговое название:** Ораблок

**Международное непатентованное или группировочное**

**название:** артикаин+эпинефрин

**Лекарственная форма:** раствор для инъекций

### **Состав:**

1 мл раствора для инъекции содержит 40 мг артикаина гидрохлорида и 0,01 мг эпинефрина гидротартрат (адреналин тартрат). Один картридж с 1,8 мл раствора для инъекции содержит 72 мг гидрохлорида артикаина и 0,018 мг эпинефрина (адреналин) в качестве адреналинового тартрата.

*Вспомогательные вещества:* содержит натрия дисульфита (натрия метабисульфит) (E223) 0,5 мг/мл, натрия хлорида 1 мг, соляная кислота 2% (для регулирования pH), вода для инъекций.

**Описание:** бесцветная прозрачная жидкость.

pH раствора в пределах от 3,0 до 4,5.

Осмолярность: 270 мОсм/кг.

**Фармакотерапевтическая группа:** местноанестезирующее средство + альфа- и бета-адреномиметик.

**Код АТХ: (N01BB58)**

### **Фармакологические свойства**

#### **Фармакодинамика**

Ораблок (артикаин с эпинефрином) – комбинированный препарат для инфильтрационной и проводниковой анестезии в стоматологии. Входящий в его состав артикаин – местный анестетик амидного типаиафеновойгруппы.

Эпинефрин вызывает сужение сосудов, особенно в месте введения, что затрудняет его всасывание и удлиняет эффект. Препарат оказывает местноанестезирующее действие, обладает анальгетическим эффектом. Препарат характеризуется хорошей переносимостью и минимальным сосудосуживающим действием. Действие препарата начинается быстро – через 0,5-3 минуты. Продолжительность анестезии составляет не менее 45 минут для Ораблок 40мг/мл+5 мкг/мл и не менее 75 минут для Ораблок 40 мг/мл+10 мкг/мл. Механизм действия артикаина основан на подавлении проводимости в нервных волокнах, вследствие блокады потенциал-зависимых натриевых каналов в клеточной мембране. Вследствие низкого содержания эпинефрина в препарате его действие на сердечно-сосудистую систему выражено мало: почти не отмечается повышения артериального давления и увеличения частоты сердечных сокращений. В связи, с чем возможно использование Ораблок 40 мг/мл+мкг/мл+5мкг/мл у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями.

#### **Фармакокинетика**

Артикаин при подслизистом введении в полости рта обладает высокой диффузной способностью. Связывание с белками плазмы составляет 95%. Активные вещества в минимальной степени проникают через плацентарный барьер, практически не выделяются с грудным молоком. Период полувыведения артикаина при субмукозном введении составляет 25 минут.

### **Показания к применению**

Лекарственный препарат Ораблок показан для местной анестезии (инфильтрационная и проводниковая анестезия) взрослым, подросткам и детям старше 4 лет в стоматологии:

В концентрации артикаина 40мг/мл и эпинефрина 5 мкг/мл при плановых вмешательствах, таких как неословненное удаление одного или нескольких зубов, обработка кариозных полостей, обтачивание зубов перед протезирование.

В концентрации артикаина 40 мг/мл и эпинефрина 10 мкг/мл при травматических вмешательствах и при необходимости выраженного гемостаза или улучшения визуализации операционного поля:

- стоматологические операции на слизистой и костях, требующие создания условий более выраженной ишемии;
- операция на пульпе зуба (ампутация и экстирпация);
- удаление сломанных зубов (остеотомия) или зуба, пораженного апикальным пародонтитом;
- продолжительные хирургические вмешательства;
- чрескожный остеосинтез;
- эксцизия кист;
- вмешательства на слизистой оболочке десны;
- резекция верхушки корня зуба

### **Дозировка и способ применения**

#### **Дозировка**

При неосложненном удалении зубов верхней челюсти при отсутствии воспаления обычно вводят в подслизистую в области переходной складки с вестибулярной стороны 1,8 мл препарата (на каждый зуб). В отдельных случаях может потребоваться дополнительное введение от 1 мл до 1,8 мл препарата для достижения полной анестезии. В большинстве случаев нет необходимости выполнять болезненные инъекции с небной стороны. Для анестезии при небных разрезах и наложении швов с целью создания небного депо необходимо около 0,1 мл препарата на укол. При удалении нескольких рядом расположенных зубов количество инъекций обычно удается ограничить. В случае удаления премоляров нижней челюсти при отсутствии воспаления можно обойтись без мандибулярной анестезии, так как инфильтрационная анестезия, обеспечиваемая инъекцией 1.8 мл на зуб, как правило, достаточна. Если же этим путем не удалось достичь желаемого эффекта, следует выполнить дополнительную инъекцию 1-1,8 мл препарата в подслизистую в область переходной складки нижней челюсти с вестибулярной стороны. Если же в этом случае не удалось достичь полной анестезии, необходимо провести блокаду нижнечелюстного нерва.

Для подготовки полости или препарирования под коронку любого зуба, за исключением нижних моляров, показано введение препарата в дозе от 0.5 мл до 1,8 мл на каждыйзуб по типу инфильтрационной анестезии с вестибулярной стороны. Точное количество зависит от желаемойглубины продолжительности процедуры.

Обычно мандибулярная анестезия показана только в тех случаях, когда вышеуказанные процедуры не приводят к полной анестезии.

При хирургических вмешательствах рекомендуется использовать Ораблок 40 мг/мл+10 мкг/мл и в зависимости от тяжести и длительности вмешательства дозируется индивидуально.

При выполнении одной лечебной процедуры взрослым можно вводить до 7 мг артикаина на 1 кг массы тела.

Продолжительность анестезии, в течении которой можно провести вмешательство, составляет 30-45 минут.



При использовании аспирационной техники дозы до 500 мг (что эквивалентно 12,5 мл) раствора для инъекций) хорошо переносились.

У пациентов пожилого возраста и пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени и почек концентрация артикаина в плазме может повышаться. У этих пациентов следует соблюдать особую осторожность. Применять минимальные дозы, необходимые для достижения достаточной глубины анестезии.

Детям препарат вводится в количествах, которые зависят от их возраста, массы тела и метода анестезии.

Для детей в возрасте от 4 до 12 лет доза вводимого препарата устанавливается не выше 5 мг артикаина на 1 кг массы тела.

Для детей с массой тела от 20 до 30 кг рекомендуемая доза препарата от 0,25 до 1 мл (от 1/6 до 1/2 картриджа). Максимальная разовая доза препарата не должна превышать 1,5 мл. Суточная доза не должна превышать 2,5 мл.

Для детей с массой тела от 30 до 45 кг рекомендуемая доза препарата от 0,5 до 1,7 мл (от 1/3 до 1 картриджа). Максимальная разовая доза препарата не должна превышать 1,7 мл. Суточная доза не должна превышать 5 мл.

Препарат не изучался у детей младше 1 года.

#### Способ применения

Использовать только для стоматологической анестезии.

Перед инъекцией всегда рекомендуется аспирация, во избежание внутрисосудистой инъекции.

Аспирацию следует выполнять в два этапа, т.е. поворот иглы на 90° или даже лучше на 180°.

Большинство системных реакций, в результате случайного внутрисосудистого введения, в большинстве случаев можно избежать с помощью техники инъекции – после аспирации, медленного введения 0,1–0,2 мл и медленного введения остальной части – не ранее, чем через 20–30 секунд. Во избежание риска заражения (например, передачи гепатита) шприцы и иглы, используемые для набора раствора, всегда должны быть свежими и стерильными.

Для однократного использования. Любой неиспользованный раствор следует выбросить.

Лекарственное средство не следует использовать, если оно мутное или обесцвечено.

#### **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к действующим веществам или к любому из вспомогательных веществ.

Из-за содержания артикаина Ораблук нельзя применять при:

- повышенной чувствительности к другим местным анестетикам амидного типа,
- тяжелых нарушениях формирования и проводимости сердечного импульса (например, АВ-блокада 2-й или 3-й степени, выраженная брадикардия),
- острой декомпенсированной сердечной недостаточности (острая застойная сердечная недостаточность),
- тяжелой гипотонии,
- дети до 4 лет.

Из-за содержания адреналина (эпинефрин) Ораблук нельзя применять при:

- анестезии терминальных ветвей нервов,
- узкоугольной глаукомы,
- гипертиреозе,
- пароксизмальной тахикардии или аритмиями с учащенным сердцебиением,
- пациенты, недавно перенесшие (от 3 до 6 месяцев) инфаркт миокарда,

- пациенты, недавно перенесшие (3 месяца) операцию аортокоронарного шунтирования,
- пациенты, принимающие некардиоселективные бета-блокаторы (например, пропранолол), (риск гипертонического криза или тяжелой брадикардии),
- больные феохромоцитомой,
- больные с тяжелой гипертонией,
- сопутствующее лечение трициклическими антидепрессантами или ингибиторами MAO, поскольку эти активные вещества могут усиливать сердечно-сосудистые эффекты адреналина (эпинефрина). Это может произойти в течение 14 дней после окончания лечения ингибиторами MAO.

Внутривенное применение противопоказано.

Ораблук нельзя применять лицам, страдающим бронхиальной астмой и повышенной чувствительностью к сульфитам. У таких лиц Ораблук может спровоцировать острые аллергические реакции с анафилактическими симптомами, такими как бронхоспазм.

#### **Особые указания**

Пациентам с дефицитом холинэстеразы Ораблук следует назначать только при наличии убедительных показаний, поскольку его действие, вероятно, будет пролонгированным, а иногда и слишком сильным.

Ораблук следует применять с особой осторожностью в случаях:

- нарушения свертываемости крови,
- тяжелая почечная или печеночная дисфункция,
- сопутствующее лечение галогенированными ингаляционными анестетиками
- эпилепсия в анамнезе

Использование Ораблук 1:200 000 артикаина гидрохлорида 4% с раствором адреналина (эпинефрина) для инъекций по сравнению с Ораблук 1:100 000 артикаина гидрохлорида 4% с раствором адреналина (эпинефрина) для инъекций, следует рассматривать из-за его более низкого содержания адреналина (эпинефрина) 0,005 мг/мл - у больных:

- с сердечно-сосудистыми заболеваниями (например, сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, стенокардия, инфаркт миокарда в анамнезе, сердечная аритмия, гипертония);
- атеросклероз;
- нарушения мозгового кровообращения, инсульты в анамнезе;
- хронический бронхит, эмфизема легких;
- сахарный диабет;
- сильная тревога.

Инъекция в воспаленный (инфицированный) участок не рекомендуется (увеличенное поглощение Ораблук снижает эффективность).

Перед использованием этого продукта необходимо задать пациенту вопросы об анамнезе, сопутствующем лечении и поддерживать устный контакт с пациентом, а также провести инъекционный тест с 5 или 10% дозы в случае риска аллергии. Во избежание возникновения побочных эффектов необходимо учитывать следующее:

- выберите минимально возможную дозу,
  - перед инъекцией аспирация в два этапа (во избежание непреднамеренного внутрисосудистого введения).
- Оборудование и лекарства, необходимые для мониторинга и экстренной реанимации, должны быть доступны (кислород, противосудорожные препараты, такие как бензодиазепины или барбитураты, миорелаксанты, атропин и вазопрессин или



адреналин (адреналин) в случае тяжелых аллергических или анафилактических реакций).

Пациенту рекомендуется воздерживаться от еды до тех пор, пока не пройдет действие анестезии.

Дети

Лица, осуществляющие уход за детьми, должны быть предупреждены о риске случайного повреждения мягких тканей при самокусании, вследствие длительного онемения мягких тканей.

Препарат содержит натрия метабисульфит (E223), который в редких случаях может вызывать тяжелые реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

Препарат содержит менее 1 ммоль натрия (23 мг) на дозу, то есть практически не содержит натрия.

#### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

Комбинации различных анестетиков вызывают увеличение эффекта на сердечно-сосудистую систему и ЦНС.

Гипертензивный эффект вазоконстрикторов симпатомиметического типа (таких как адреналин) может усиливаться трициклическими антидепрессантами или ингибиторами МАО, поэтому они противопоказаны (см. раздел «Противопоказания»).

Информацию о одновременном применении некардиоселективных бета-блокаторов см. в разделе «Противопоказания».

Адреналин (эпинефрин) может ингибировать высвобождение инсулина поджелудочной железой, тем самым ослабляя эффект пероральных противодиабетических средств.

Некоторые ингаляционные анестетики, такие как галотан, могут повышать чувствительность миокарда к катехоламинам и, следовательно, могут спровоцировать аритмии после применения Ораблоса.

Фенотиазины могут влиять на действие адреналина и повышать артериальное давление.

Поэтому следует избегать сопутствующего лечения. Если необходимо сопутствующее лечение, пациентов следует тщательно наблюдать.

Следует помнить, что у пациентов, получающих антикоагулянтную терапию (например, гепарин или ацетилсалициловую кислоту), непреднамеренная пункция сосуда во время местной анестезии может привести к серьезному кровотечению, и склонность к кровотечениям у таких пациентов обычно увеличивается.

#### **Применение при беременности и в период лактации**

Опыт применения артикаина у беременных женщин, за исключением родов, отсутствует. Исследования на животных не показали, что артикаин оказывает прямое или косвенное вредное воздействие на беременность, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие.

Исследования на животных показали, что адреналин (эпинефрин) токсичен для репродуктивной функции в дозах, превышающих максимальную рекомендуемую дозу.

Адреналин (эпинефрин) и артикаин проникают через плацентарный барьер, хотя артикаин делает это в меньшей степени, чем другие местные анестетики. Сывороточные концентрации артикаина, измеренные у новорожденных, составляли прибл. 30% материнского уровня.

В случае непреднамеренного внутрисосудистого введения матери адреналин (эпинефрин) может снизить перфузию матки. Во время беременности Ораблок следует применять только после тщательного анализа соотношения пользы и риска.

Из-за более низкого содержания адреналина (эпинефрин) использование раствора для инъекций Ораблок 1:200 000 предпочтительнее 1:100 000.

Предпочтение следует отдавать раствору для инъекций.

*Грудное вскармливание*

В результате быстрого падения уровня артикаина в сыворотке крови и быстрого выведения, клинически значимые количества артикаина не обнаруживаются в грудном молоке. Адреналин (эпинефрин) попадает в грудное молоко, но имеет короткий период полураспада.

Обычно нет необходимости приостанавливать грудное вскармливание при кратковременном применении.

*Фертильность*

Исследования на животных с применением артикаина 40 мг/мл + адреналина (эпинефрина) 0,01 мг/мл не выявили влияния на фертильность (см. раздел 5.3). При применении терапевтических доз не ожидается неблагоприятного воздействия на фертильность человека.

#### **Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами**

Местная анестезия препаратом Ораблок, как показали исследования, не приводит к значимым отклонениям от обычной способности к управлению автомобилем и участию в уличном движении.

Однако решение о том, когда пациент после стоматологического вмешательства с использованием препарата Ораблок сможет вернуться к вождению автотранспорта или управлению механизмами, должен принимать стоматолог.

#### **Побочное действие**

Для классификации частоты нежелательных эффектов используются следующие категории:

Очень часто ( $\geq 1/10$ )

Часто (от  $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ )

Нечасто (от  $\geq 1/1000$  до  $< 1/100$ )

Редко (от  $\geq 1/10\ 000$  до  $< 1/1\ 000$ )

Очень редко ( $< 1/10\ 000$ )

Неизвестно (невозможно оценить на основе имеющихся данных)

*Нарушения со стороны иммунной системы:*

*Частота неизвестна:* аллергические или алергоподобные реакции гиперчувствительности. Они могут проявляться в виде отечной припухлости и/или воспаления в месте инъекции, а проявления, возникающие независимо от места инъекции, могут включать покраснение кожи, зуд, конъюнктивит, ринит, отек лица (ангионевротический отек) с отеком верхней и/или нижней губы и/или щек, отек голосовой щели с комком в глотке и затруднением глотания, крапивница и затруднение дыхания, которые могут прогрессировать до анафилактического шока.

*Нарушения со стороны центральной нервной системы:*

*Часто:* парестезия, гипестезия; головные боли, предположительно из-за адреналинового компонента.

*Нечасто:* головокружение.

*Неизвестно:* В зависимости от дозы (особенно при чрезмерно высоких дозах или после непреднамеренного внутрисосудистого введения) могут возникать реакции со стороны ЦНС: возбуждение, нервозность, ступор, иногда прогрессирующий до потери сознания, кома, респираторные нарушения, иногда прогрессирующие до остановки дыхания, мышечный тремор.

мышечные подергивания, иногда переходящие в генерализованные судороги.



- Поражения нервов (например, парез лицевого нерва) и снижение вкусовой чувствительности в орофациальной области не являются побочными эффектами, специфичными для артикаина. Однако такие реакции теоретически возможны при любом стоматологическом вмешательстве из-за анатомических условий в зоне инъекции или неправильной техники инъекции.

*Нарушение со стороны органа зрения:*

*Неизвестно:* временные нарушения зрения (помутнение зрения, переходящая слепота, диплопия), возникающие во время или вскоре после введения местных анестетиков в область головы.

*Нарушение со стороны сердечно-сосудистой системы:*

*Нечасто:* тахикардия.

*Частота неизвестна:* сердечные аритмии, повышение артериального давления, артериальная гипотензия, брадикардия, сердечная недостаточность и шок (возможно опасный для жизни).

*Нарушения со стороны органов дыхания, грудной клетки и средостения.*

*Неизвестно:* дыхательная дисфункция (тахипноэ, брадипноэ), которая может привести к апноэ.

*Желудочно-кишечные расстройства*

*Часто:* тошнота, рвота.

*Общие расстройства и состояния в месте введения.*

*Неизвестно:* непреднамеренное внутрисосудистое введение может привести к развитию ишемических зон в месте инъекции, иногда прогрессирующих до некроза тканей.

Из-за содержания метабисульфита натрия продукт может вызывать реакции гиперчувствительности, особенно у пациентов с бронхиальной астмой. Такие реакции могут проявляться рвотой, диареей, свистящим дыханием, острыми приступами астмы, нарушением сознания или шоком.

*Дети:*

В опубликованных исследованиях профиль безопасности у детей и подростков от 4 до 18 лет был одинаковым по сравнению с взрослыми. Однако случайное повреждение мягких тканей наблюдалось чаще (до 16% детей), особенно у детей 3–7 лет, вследствие длительной мягкотканной анестезии. В ретроспективном исследовании у 211 детей в возрасте от 1 до 4 лет лечение зубов проводилось с использованием до 4,2 мл 4% артикаина + 0,005 мг/мл или 0,01 мг/мл адреналина (эпинефрина), побочных эффектов не отмечено.

### **Передозировка**

*а) Симптомы передозировки*

*Стимуляция ЦНС:* беспокойство, тревога, спутанность сознания, гиперпноэ, тахикардия, повышение артериального давления с покраснением лица, тошнота, рвота, тремор, подергивания, тонико-клонические судороги.

*Угнетение ЦНС:* головокружение, нарушение слуха, потеря способности говорить, потеря сознания, мышечная атония, вазомоторный паралич (слабость, бледность), одышка, смерть в результате паралича дыхания.

*Сердечно-сосудистая депрессия:* брадикардия, аритмия, фибрилляция желудочков, падение артериального давления, цианоз, остановка сердца.

*б) Экстренные меры и противодействия*

При первых признаках развития побочных эффектов или интоксикации, (головокружение, двигательное беспокойство или нарушение сознания) необходимо срочно прекратить инъекцию и придать пациенту горизонтальное положение. Дыхательные пути пациента следует поддерживать свободными, контролировать пульс и артериальное давление.

Рекомендуется, в том числе при невыраженных симптомах интоксикации, вводить внутривенно катетер для немедленных внутривенных инъекций при необходимости.

В зависимости от степени нарушения дыхания следует дать кислород, провести искусственное дыхание и, при необходимости, эндотрахеальную интубацию с контролируемой вентиляцией легких. Применение аналептических препаратов центрального действия противопоказано.

Мышечные подергивания или генерализованные судороги можно снять внутривенным введением спазмолитика короткого действия (например, суксаметония хлорида, диазепам).

Также рекомендуется искусственное дыхание (кислород).

Падение артериального давления, тахикардию или брадикардию можно скорректировать, поместив пациента в горизонтальное положение или слегка опустив голову.

При тяжелых нарушениях кровообращения и шоке, независимо от причины, после прекращения инъекции следует немедленно принять следующие меры неотложной помощи:

- уложить пациента в горизонтальное положение или положение «головой вниз» и обеспечить проходимость дыхательных путей пациента (ингаляция кислорода),
- организовать внутривенную инфузию (раствор сбалансированного электролита),
- внутривенное введение глюкокортикоида (например, 250–1000 мг преднизолона или эквивалентного количества его производного, например метилпреднизолона),
- объемозамещение (дополнительно, при необходимости, плазмозаменителем, человеческим альбумином).

В случае угрожающего сосудистого коллапса и нарастающей брадикардии, следует немедленно ввести внутривенно адреналин (эпинефрин). После разведения 1 мл раствора адреналина (эпинефрина) 1:1000 до 10 мл (вместо него можно использовать раствор адреналина (эпинефрина) 1:10000), 0,25–1 мл раствора (= 0,025–0,1 мг адреналина (эпинефрина)) вводят медленно с контролем пульса и артериального давления (с осторожностью: при нарушениях сердечного ритма). Не превышайте дозу 1 мл (0,1 мг адреналина(эпинефрина)) на одну внутривенную инъекцию. Если необходимы дополнительные дозы адреналина, рекомендуется вводить их вместе с инфузионным раствором (скорость капель регулируется в зависимости от частоты пульса и артериального давления).

Тяжелые формы тахикардии и тахикардии могут быть устранены применением антиаритмических препаратов, однако не следует использовать неоселективных бета-блокаторы, например пропранолол. В таких случаях необходимо подавать кислород и контролировать кровообращение.

При повышении артериального давления у больных с гипертонической болезнью следует, при необходимости, применять периферические вазодилататоры.

### **Форма выпуска**

Раствор для инъекций 40 мг/мл + 10 мкг/мл.

По 1,8 мл помещают в картридж из прозрачного бесцветного стекла гидролитического класса I, с одной стороны укупоренный плунжером из бромбутиловой резины, с противоположной стороны укупоренный бромбутиловой пробкой и обжатым алюминиевым колпачком. На каждый картридж наклеивают этикетку. По 10 картриджей помещают в блистер (поддон) из пластика и полиэтилена. По 10 блистеров (поддонов) вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.



**Условия хранения**

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25С.

Не замораживать!

Хранить в недоступном для детей месте.

**Срок годности**

2 года. Не использовать по истечении срока годности.

**Условия по отпуску из аптек**

По рецепту.

**Предприятие-изготовитель;**

ПЕРРЕЛЬ С.п.А., Италия

**Адрес места производства:**

С.С.Аппиа, 7 бис, 46/48 - 81043

Капуа (СЕ). Италия

**Организация принимающая претензии потребителей:**

ООО "ЭСЗЕТ Фарма"

0015, Армения, Ереван,

ул.Маштоца 16а/2

тел.: 011 53 45 56