

Reparil®-Gel N

1. Търговско име на лекарствения продукт

Reparil®-Gel N

2. Качествен и количествен състав

100 g съдържат:

Лекарствени вещества:

Aescin 1 g

Diethylamine salicylate 5 g

3. Лекарствена форма

Гел

4. Клинични данни

4.1. Показания

При контузии, навяхвания, натъртвания и хематоми, тендовагинити.

Болков синдром на гръбначния стълб (дискова херния, болки във врата, лумбаго, ишиалгия).

Повърхностни флебиты, варикозни вени. За третиране на вените след инжекции или инфузии.

4.2. Дозировка и начин на употреба

Намазва се тънък слой от гела върху болния участък от кожата веднъж дневно или многократно.

Не е необходимо да се втрива в кожата, но това може да се прави при желание.

4.3. Противопоказания

Reparil®-Gel N не трябва да се прилага върху разкъсана кожа, мукозни мембрани или кожни участъци, подложени на радиотерапия.

Reparil®-Gel N не трябва да се прилага при свръхчувствителност към някоя от съставките на продукта и свръхчувствителност към салицилати.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Продуктът не трябва да влиза в контакт с очите.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Няма известни

4.6. Бременност и кърмене

Бременност

Продължителна употреба върху обширни участъци от кожата трябва да се избягва по време на бременност.

Кърмене

При кърмене продуктът не трябва да се прилага в областта на гърдите.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Както всички лекарствени продукти Reparil®-Gel N може да прояви нежелани реакции.

За оценка на тези реакции се използва тази таблица за честота:

Много често: повече от 1 на 10 пациенти

Често: по-малко от 1 на 10, но не повече от 1 на 100 пациенти

Не често: по-малко от 1 на 100, но не повече от 1 на 1 000 пациенти

Рядко: по-малко от 1 на 1 000, но не повече от 1 на 10 000 пациенти

Много рядко: по-малко от 1 на 10 000, включително изолирани съобщения

Реакции на кожа и подкожни тъкани:

В много редки случаи могат да се наблюдават алергични кожни реакции.

4.9. Предозиране

Досега няма съобщения за прояви на предозиране или интоксикация.

5. Фармакологични данни

5.1. Фармакодинамични свойства

<p>ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА</p> <p>Кратка характеристика на продукта - Приложение 1</p> <p>Към РУ ...11-1016...1.15.11.2007</p> <p>Одобрено: N=3/22.10.2007</p>



Фармакотерапевтична група: Продукт за външна употреба с противовъзпалително, антиексудативно и обезболяващо действие, съдържащ дериват на салициловата киселина.

АТС код: M02AC

Локалното приложение на есцина предизвиква намаляване на чувствителността и болката при спортни травми като навяхвания и изкълчвания.

В случаите на повишена пропускливост вследствие на възпаление, есцинът потиска ексудацията чрез намаляване на екстравазацията на течности в тъканното пространство и чрез ускорена реабсорбция в съществуващия оток. Механизмът на действие се базира на промяната в пропускливостта на засегнатите капиляри. Освен това, есцинът повишава капилярната устойчивост, инхибира възпалителните процеси и подобрява микроциркулацията.

Диетилaminsалицилат има подчертан аналгетичен ефект. Той прониква свободно през кожата и упражнява аналгетичното си действие в дълбочина на засегнатия участък. Допълнителното му антифлогистично действие засилва противовъзпалителния ефект на есцина и по този начин се бори срещу етиологичните фактори в процеса на заболяването.

В три рандомизирани, плацебо-контролирани двойнослепи изследвания при хора, при които е използван модел на експериментално предизвикан хематом (получен при инжектиране), стана възможно да се демонстрира действието на Reparil®-Gel N чрез параметрите болезненост и абсорбция на хематома. През първите 24 часа от лечението а също и след период от 19 дни беше наблюдавано значително намаляване силата на болката в сравнение с плацебо и със субстанциите есцин и диетиламин салицилат, приложени самостоятелно. От своя страна действието на всяка от двете субстанции е било значително по-добро от това на плацебо. В същия модел спрямо плацебо е било демонстрирано значително предимство на двете активни съставки в сравнение с референтния продукт диклофенак и плацебо. Сравнението между Reparil®-Gel N и диклофенак показва тенденция към превъзходство.

5.2. Фармакокинетични свойства

Бил е приложен ³H-есцин върху кожата на гърба и корема на мишки, плъхове, морски свинчета и прасета, за да се изследва неговата перкутанна абсорбция. Мястото на прилагане е било изолирано чрез превръзка. Концентрацията на общата наличност, непроменливата наличност и наличността на есцинът (след тънкослойна хроматография) е била определена в различни тъкани и органи по различно време след прилагането.

По време на експеримента са били измервани екскрециите чрез жлъчката и урината.

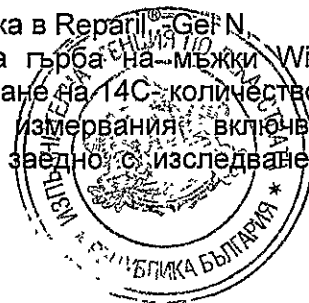
Степента на абсорбция (определена чрез екскрецията в продължение на 1-2 дни) е била ниска при всичките животински видове; тя е изчислена като <2% от приложената доза. Относително високи концентрации на есцин, обаче, са били открити под мястото на приложение, и даже в по-дълбоко лежащите мускулни тъкани.

Двайсет и четири часа след перкутанно приложение концентрацията на непроменливата наличност, измерена при прасета в подкожната и мускулна тъкан под областта на прилагане, е била почти 50 пъти по-висока от тази в кръвта. Нивата на пикова наличност в кожата и подкожието са били достигнати 6 часа след прилагането.

В процеса на изследването наличността в кожата и подкожието намалява, което се дължи на нарасналата дифузия. В мускулните тъкани, обаче, тя се повишава. Тънкослойната хроматография показва, че около 50% от наличността е идентична с тази на есцина. Резултатите ясно демонстрират, че есцинът се абсорбира от кожата и също така прониква в по-долу лежащите слоеве. Поради това желаните високи концентрации на есцин преобладават локално на мястото на приложение в подлежащите мускулни тъкани, без системно въздействие, което да има някакво значение.

Въз основа на тези фармакокинетични особености са приема, че есцинът е много подходящ за кожно приложение.

За да се определи кожната абсорбция на аналгетичната съставка в Reparil®-Gel N, 14C-диетилaminsалицилат е бил приложен върху кожата на гърба на мишки Wistar плъхове. Степента на абсорбция е била оценявана чрез измерване на 14C-количеството, екскретирани в жлъчката и урината. По-нататъшните измервания включвали концентрациите в плазмата и в различни органи и тъкани, заедно с изследване на



метаболизма на 14C-диетилпаминсалицилат. Средното абсорбирано количество – измервано чрез екскретираното количество до 48 часа – било 14%. Високи нива на радиоактивност са отбелязани в третираната кожна област, докато 14C-количеството в органи и тъкани, измерено по различно време след приложението, е било малко.

Било е проведено клинично-фармакологично изследване за определяне на абсорбцията на есцин след външно прилагане. Опитът е проведен като отворено проучване. Изследваната група се е състояла от 20 пациенти с проктологични състояния, изискващи операция. Бил е приложен 2%-ов есцин под формата на крем върху засегнатите повърхности за 7 дни преди операцията. Определянето на концентрацията на есцин в тъканните проби, отстранени от оперативното поле, е показали в кожата и подкожието концентрации на есцин, които значително се различават от 0 ($p < 0.001$). Освен това са били забелязани значителни разлики в концентрациите в индивидуалните тъканни проби между кожата и подкожието и мастната тъкан.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Изследванията върху локалната и системна поносимост са проведени при плъхове, зайци и прасета.

Repair[®]-Gel N е бил прилаган в дози от 200 и 500 мг върху остриганата кожа на гърба на плъхове и зайци в продължение на 4 седмици. Макроскопски и хистологични изследвания не показваха никакви специфични кожни лезии. Промени като слаба акантоза на епидермиса или хронична възпалителна клетъчна инфилтрация в субепидермалния кориум са били наблюдавани също в контролната група след прилагане на гелната основа. Както е било доказано от практиката, всички находки са били напълно обратими. За да се изследва локалната поносимост върху лигавиците, еднократна доза от 100 мг Repair[®]-Gel N е била въведена в конюнктивалния сак на очите на зайци. Получили са се леки до тежки възпалителни изменения на конюнктивата, които обаче напълно отзвучали след 7 дена. Изплакването на окото до 2 минути след апликацията води до пълна ремисия на възпалението.

В дългосрочно изследване гелът е бил прилаган в дневни дози от 300, 1500, или 4000 мг/кг телесно тегло върху кожата на гърба на прасета в продължение на 3 месеца. Макроскопски преглед е показал еритема при животните от групата на високи дози. Хистологично изследване не показва никакви специфични реакции за разлика от неспецифичните реакции като супуративен пустуларен дерматит, епидермална хиперплазия и хиперкератоза. Системни ефекти, дължащи се на субстанцията не са били наблюдавани.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества

Polyacrylic acid, macrogol-6-glycerol caprylocaprate, disodium edetate, trometamol, isopropyl alcohol, purified water, aromatics.

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни

6.3. Срок на годност

5 години

6.4. Специални условия на съхранение

Няма

6.5. Данни за опаковката

Алуминиеви туби от 40 и 100 г

6.6. Препоръки при употреба

Няма специални изисквания

7. Име и адрес на притежателя на разрешението и производителя:

MADAUS GmbH, 51101 Cologne (Köln), Germany

8. Регистрационен номер

9700249

9. Дата на разрешаване за употреба на лекарствения продукт

22.04.1997 г. (подновено на 06.11.2002)

10. Дата на актуализация на текста

Април 2007 г.

