

DİFESTOL JEL

DİFESTOL® JEL

Formülü:

30 g Jel;

Lidokain HCl %2

Difenhidramin HCl %1,2

Yardımcı Madde: Koruyucu olarak Potasyum Sorbat içerir.

FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLER:

Farmakodinamik Özellikler:

Lidokain HCl kimyasal yapısı N -dietilaminoasetil-2,6-ksilidin hidroklorür olan lokal anestetik bir maddedir. Minimum etkin konsantrasyonu üzerinden değerlendirildiğinde prokaine göre aşağı yukarı üç kez daha güçlü lokal anestetik etkiye sahiptir.

Lidokainin kalpteki otomatisite ile ilgili önemli bir elektrofizyolojik etkisi spontan diastolik depolarizasyonun hızını yavaşlatmasıdır. Bunun, taban sodyum akımını azaltmasına ve potasyum akımını arttırmasına bağlı olduğu sanılmaktadır. Bu etki sinoatriyal düğüm hücrelerinde belirgin değildir. İstinahat membran potansiyelini ve aksiyon potansiyeli oluşması için gerekli voltaj eşliğini değiştirmez, fakat eksitabilitiyi azaltır. Faz 0'daki hızlı depolarizasyonu etkilemediği bildirilmişse de bu invitro deneylerin düşük K⁺ konsantrasyonu kullanılarak yapıldığı ve K⁺ konsantrasyonu normal düzeyde tutularak yapılan deneylerde terapötik konsantrasyona uygun sınırlarda uygulanan lidokainin aksiyon potansiyelinin fırlama hızını azalttığı görülmüştür.

Aksiyon potansiyeli süresini atriyum miyokardında değiştirmez. Purkinje lifleri ve ventrikül miyokardında çok belirgin bir biçimde kısaltır. Son iki yerde refrakter periyodu daha az derecede kısaltır. Bu etki sonucu, patolojik durumlarda, anılan iki yerde depolarizasyon-repolarizasyon olaylarında gelişen asenkronluğu kısmen düzeltir. EKG'de Q-T mesafesini kısaltır.

Difenhidramin güçlü bir H₁-reseptör antagonistidir. Aşırı duyarlılık reaksiyonlarının semptomatik tedavisinde kullanılır. Vücutta salıverilen histaminin H₁ reseptörlerinin aktivasyonuna bağlı vazodilasyon kapiler permeabilite artışı, hipotansiyon gibi etkilerini antagonize eder. Kapiler permeabilitenin artmasına bağlı ürtiker veya anjiyo ödemi kaldırır. Hafif lokal anestetik etkiye sahiptir. Topikal olarak uygulanabilir.

Farmakokinetik Özellikler:

Lidokain HCl'in lokal anestetik etkisi uygulandıktan 3-5 dakika sonra başlar. 10-15 dakikada maksimuma erişir. Lidokainin %10 - 20'si değişmemiş olarak idrarla atılır, geri kalanı ise karaciğerde metabolize olur. Karaciğerden ilk geçiş sırasında %70 oranında inaktive edilir. Vücutta geniş bir sıvı hacmine dağılır. Etkisi kısa sürer. Etkin plazma konsantrasyonu 2-6 µg/ml'dir. Bu sınır aşılsa önce SSS ile ilgili yan tesirleri ve sonradan kalp ile ilgili yan tesirler ortaya çıkar. Diğer amid türü lokal anestetikler gibi; kandaki kolinesterazlar tarafından parçalanmaz. Sadece karaciğerde hidroliz edilerek parçalanır.

DİFESTOL JEL

Difenhidramin oral yoldan alındığı zaman GI kanaldan iyi absorblanan etanolamin türevidir. Ancak karaciğerde ilk geçiş de eliminasyona uğrarlar. Bu nedenle sistemik biyoyararlanımı düşüktür. 1-4 saatte pik plazma seviyesine ulaşır.

Ağızdan alınan 4 kez 50 mg dozdan sonra tespit edilen doruk plazma seviyesi 110mg/ml'dir. Difenhidramin SSS dahil tüm vücuda hızla dağılır. Plasentaya geçer ve sütte tespit edilir. Plazma proteinlerine bağlanır. Yarılanma ömrü 3-4 saattir. Başlıca idrarla metabolitler yoluyla atılır. Küçük bir kısmı değişmeden atılır. 24 saat içinde vücuttan tamamen atılmıştır.

ENDİKASYONLARI:

Böcek, sinek ve arı sokmalarında ve hafif güneş yanıklarında kullanılır.

KONTRENDİKASYONLARI:

Difenhidramin'e karşı hipersensitivite gelişebilir. Daha önceden Difenhidramine hassasiyet gelişmiş kişilerde ve lokal anestezi maddelere karşı hassasiyeti bilinen kişilerde kontrendikedir.

UYARILAR / ÖNLEMLER:

Fotoallerjik reaksiyona yol açabileceğinden açık deri alanlarına uygulanmamalıdır. Aşırı ya da kısa aralıklarla doz alımında yüksek plazma konsantrasyonu ve sonuçta ciddi yan etkiler ortaya çıkabilir, ancak topikal uygulamada yüksek doza ulaşmak zordur. Ancak çok geniş yüzeylere, çok sık uygulamaktan kaçınılmalıdır.

Cildin hasar gördüğü bölgelerde uygulama sırasında mikrop üremesine karşı dikkatli olunmalıdır. Çocuklarda özellikle suçiçeği vakalarında geniş alanlara oral difenhidramin ile kombine kullanılmamalıdır.

Özellikle geniş deri yüzeylerine ve bilhassa da oklüzyon altında uygulandıklarında kalp ritm bozuklukları, nefes alma zorluğu, koma ve hatta ölüme yol açabilmektedir.

Gebelikte ve Laktasyonda Kullanım (Kategori B): Zorunluluk olmadıkça gebelikte kullanılmamalıdır.

ARAÇ VE MAKİNE KULLANMAYA ETKİSİ:

Difenhidramin HCl'in meydana getirdiği bir etki bildirilmemekle birlikte, Lidokain HCl'in az miktarda bulunmasına rağmen, uygulandığı bölgede lokal bir uyuşma meydana getirdiğinden, araç ve makine kullanırken dikkatli olunması tavsiye edilir.

YAN ETKİLER / ADVERS ETKİLER:

Kontakt duyarlanmaya ve fotoallerjik reaksiyonlara yol açabilir. Antihistaminiklerde yan etkiler genellikle plazma konsantrasyonu ile orantılı olarak artar. Topikal kullanımda ve önerilen dozlarda sistemik yan etki oldukça azdır. Ancak kullanım sıklığına ve yüzeyin genişliğine bağlı olarak, uyku hali, uyuşukluk, bilinçte zayıflama, taşikardi aritmi, antimuskarinik etkiler, solunum güçlüğü, midriyazis, halusinasyonlar gibi sistemik belirtiler ortaya çıkabilir.

Lokal anesteziyelerde görülen yan etkiler genellikle aşırı dozaj sebebi ile ortaya çıkar. Lidokainin tavsiyesi edilen dozlarda yan tesiri oldukça azdır. Paraamino benzoik asit ve onun türevlerine (Prokain, tetrakain, benzokain vb.) alerjik hassasiyet gösteren hastalar lidokaine hassasiyet göstermezler, çok nadir olarak

DİFESTOL JEL

baş dönmesi, bulanık görme, titreme, ihtilaç ve uykusuzluk hali görülebilir. Kardiovasküler reaksiyonlar bradikardi, miyokardial depresyon ve hipotansiyon şeklinde karakterize edilebilir.

Özellikle çocuklarda geniş deri alanlarına uygulandığında santral sinir sistemi toksisitesine yol açabilir.

Zehirlenme halinde: Nefes yolunu açık bulundurmak gerekir. Konvülsiyonlara karşı antikonvülsif ajanlar kullanılabilir. Deri testi yapılarak gizli duyarlılık ortaya çıkabilir.

BEKLENMEYEN BİR ETKİ GÖRÜLDÜĞÜNDE DOKTORUNUZA BAŞVURUNUZ.

KULLANIM ŞEKLİ VE DOZU:

Doktor tarafından başka şekilde tavsiye edilmediği takdirde Difestol jel günde birkaç defa (2-3 defa) uygulanır.

Difestol jelin göz ve göz çevresi, açık yaralara temasından kaçınınız.

SAKLAMA KOŞULLARI:

Çocukların göremeyeceği, erişemeyeceği yerlerde ve ambalajında saklayınız. 25°C'nin altındaki oda sıcaklığında saklayınız.

TİCARİ TAKDİM ŞEKLİ:

%2 Lidokain HCl

%1,2 Difenhidramin HCl içeren

30 g.lık sprey başlıklı şişede.

RUHSAT NUMARASI: 27.11.2006 - 209/76

RUHSAT SAHİBİ:

Münir Şahin İlaç Sanayi Ve Ticaret A.Ş.

Yunus Mah. Sanayi Cad. No:22 Kartal / İstanbul

İMAL YERİ:

Münir Şahin İlaç Sanayi Ve Ticaret A.Ş.

Yunus Mah. Sanayi Cad. No:22 Kartal / İstanbul

Reçete ile satılır.

Prospektüs Onay Tarihi: 21.06.2010