

	FLOGOLISIN® 75
	DICLOFENAC SODICO 75 mg
	Comprimidos recubiertos
	Venta bajo receta
	Industria Argentina

Composición cuall/cuantitativa:

Cada comprimido recubierto contiene:
Diclofenac sódico: 75,00 mg; HPMC K4: 63,00 mg;
Lactosa: 83,62 mg; Dioxido de silicio coloidal: 1,13 mg; Estearato de magnesio: 2,25 mg; Opadry: 2,50 mg; Propilenglicol: 0,10 mg; Polietilenglicol 6000: 0,05 mg; Oxido de Hierro rojo: 0,50 mg.

Acción terapéutica:

Analgésico. Antiinflamatorio.

Indicaciones:

- Tratamiento de formas inflamatorias y degenerativas de reumatismo: artritis reumatoide, espondilitis anquiló-poyética, artrosis y espondilartritis, síndromes dolorosos de la columna vertebral, reumatismo no articular.
- Dolor postraumático y postoperatorio, inflamación y tumefacción, por ej.: en cirugía dental u ortopédica.
- Afecciones dolorosas y/o inflamatorias en ginecología, por ej.: dismenorrea primaria o anexitis.

Acción farmacológica :

La acción analgésica, antiflogística y antipirética del Diclofenac se basa en la inhibición de la enzima ciclooxigenasa. Esta enzima es la responsable de la formación de prostaglandinas y tromboxanos a partir del ácido araquidónico. Los prostaglandinas tienen un rol fundamental en el origen de la inflamación, el dolor y la fiebre.

Farmacocinética

Absorción: La formulación de **FLOGOLISIN®** asegura la liberación rápida y sostenida del Diclofenac. **Distribución:** El Diclofenac se une un 99,7% a proteínas plasmáticas, especialmente a la albúmina (99,4%). Las concentraciones máximas en líquido sinovial se hallan a las 2-4 horas del pico plasmático. La vida media de eliminación del líquido sinovial es de 3-6 horas. **Metabolización:** la metabolización del Diclofenac es rápida y prácticamente total. Los metabolitos son conocidos. La biotransformación se

efectúa en una pequeña parte por glucuronización, fundamentalmente por hidroxilación simple y múltiple, que lleva a la formación de varios metabolitos fenólicos (Diclofenac 3'-hidroxí, 4'- hidroxí, 5-hidroxí y 3'-hidroxí-4'-metoxi), que luego son conjugados en gran medida con ácido glucurónico. **Eliminación:** La eliminación del Diclofenac del plasma se efectúa con un clearance sistémico de 263±56 ml/min. La vida media es de 1-2 horas.

El 60 % de la materia activa es eliminada por vía renal en forma de metabolitos, menos del 1% de la sustancia activa es eliminada en forma inalterada por vía renal. El resto es eliminado por heces en forma de metabolitos.

La farmacocinética permanece inalterada con la administración repetida.

Si se mantienen los intervalos recomendados en "Posología" no se produce acumulación del Diclofenac o sus metabolitos.

Posología y forma de administración:

La dosis inicial diaria suele ser habitualmente de 75-150 mg (1 ó 2 comprimidos recubiertos de 75 mg). En casos de mediana gravedad, como durante una terapia prolongada, 1 comprimido recubierto de 75 mg es usualmente suficiente.

Si la gravedad de los síntomas es mayor por la noche o por la mañana , se recomienda la administración de **FLOGOLISIN®** por la noche.

Los comprimidos recubiertos deben ser ingeridos enteros junto con un poco de líquido y de ser posible durante las comidas.

Niños: **FLOGOLISIN®** en su forma de comprimidos recubiertos de 75 mg no debe ser utilizado en niños debido a la concentración de sustancia activa que contiene.

Contraindicaciones:

- Hipersensibilidad conocida al Diclofenac o a la colestiramina o a cualquiera de los excipientes
- Úlcera gastroduodenal.
- Pacientes con antecedentes de ataques asmáticos, urticaria o rinitis aguda después de la administración de ácido acetilsalicílico u otros medicamentos que inhiben la actividad de la prostaglandina sintetasa.

Advertencias:

El Diclofenac sólo puede ser administrado después

de una cuidadosa evaluación del costo beneficio en porfirias inducibles.

En cualquier momento del tratamiento puede producirse hemorragia gastrointestinal o úlcera /perforación, con o sin síntomas prodrómicos o historial previo. Generalmente las consecuencias son mas graves en los pacientes de edad avanzada. En estos casos debe suspenderse inmediatamente el tratamiento.

Al igual que con otros AINEs, pueden producirse, en raras ocasiones, reacciones alérgicas, incluso anafilácticas/anafilactoides, aún sin exposición previa al fármaco.

Como con otros AINEs, el Diclofenac puede enmascarar los signos y síntomas de infección debido a sus propiedades farmacodinámicas.

Precauciones:

Es imprescindible una estrecha vigilancia médica en pacientes con síntomas indicativos de trastornos gastro-intestinales o con antecedentes que sugieren la presencia de úlcera gástrica o intestinal, pacientes con colitis ulcerosa o enfermedad de Crohn, así como en pacientes con disminución de la función hepática.

Como ocurre con otros AINEs, pueden aumentar los valores de una o más enzimas hepáticas. A título preventivo, se controlará la función hepática durante el tratamiento prolongado con **FLOGOLISIN®**. Si las pruebas de la función hepática siguen dando resultados anormales o empeoran, si aparecen signos o síntomas clínicos típicos del inicio de una enfermedad hepática o si se manifiestan otros fenómenos (Por ej.: eosinofilia o eritema) deberá interrumpirse el tratamiento con Diclofenac. La hepatitis puede sobrevenir sin síntomas prodrómicos.

Se tendrá precaución cuando se administre a pacientes con porfiria hepática debido a que el Diclofenac puede desencadenar un ataque.

Debido a la importancia de las prostaglandinas en el mantenimiento de la irrigación renal se deberá tener una especial precaución en pacientes con funcionalidad renal o cardíaca reducida, en las personas de edad avanzada, en los que son tratados con diuréticos, y en pacientes con depleción substancial del volumen extracelular. Se recomienda controlar la

funcionalidad renal cuando se administra Diclofenac a este tipo de pacientes.

Generalmente se recupera la funcionalidad renal después de la suspensión del tratamiento. Se recomienda realizar controles hematológicos durante los tratamientos prolongados con Diclofenac. Debido a que el Diclofenac puede inhibir temporariamente la funcionalidad plaquetaria los pacientes con trastornos de la hemostasis deben ser controlados.

Interacciones medicamentosas:

- Lito y Digoxina: El Diclofenac puede aumentar sus concentraciones plasmáticas.
- Diuréticos: El Diclofenac puede reducir la actividad de los diuréticos. Cuando se administra concomitantemente el Diclofenac con diuréticos ahorradores de potasio, pueden elevarse los niveles séricos del potasio.
- AINEs: la administración concomitante de AINEs sistémicos puede incrementar la incidencia de efectos secundarios.
- Anticoagulantes: Aunque los estudios clínicos parecen indicar que el Diclofenac no influye sobre la acción de los anticoagulantes, existen informes aislados de un mayor riesgo de hemorragia en pacientes tratados concomitantemente con anticoagulantes y Diclofenac, por lo tanto se recomienda un preciso control de estos pacientes.
- Antidiabéticos: Si bien los estudios clínicos indican que el Diclofenac puede administrarse concomitantemente con antidiabéticos orales sin que influya sobre su efecto clínico, se han registrado reportes de efectos tanto hipo como hiperglucémicos durante el tratamiento con Diclofenac que requieren de la modificación de la dosis del hipoglucemiante.

• Metotrexato: Se recomienda no administrar AINEs en las 24 horas previas a la administración de Metotrexato, debido a que pueden aumentar los niveles y por lo tanto la toxicidad del mismo.

• Ciclosporina: El Diclofenac puede aumentar la nefrotoxicidad de la ciclosporina debido a su efecto sobre las prostaglandinas renales.

• Quinolonas antibacterianas: Existen reportes aislados de convulsiones debidas posiblemente a la administración concomitante de quinolonas y AINEs.

Pacientes geriátricos: Se recomienda emplear la menor dosis efectiva en pacientes geriátricos, especialmente si están débiles o tienen bajo peso corporal.

Pacientes pediátricos: La seguridad y eficacia no ha sido establecida en niños.

Carcinogénesis, mutagénesis, fertilidad:

• Carcinogénesis: En estudios de 2 años de duración realizados en ratones machos que recibieron dosis de Diclofenac de 0,3 mg por kg de peso por día y en ratones hembras que recibieron 1 mg/kg de peso por día, no se observó potencial oncogénico

• Tumorigénesis: En estudios realizados en ratas que recibieron dosis de Diclofenac de 2,0 mg por kg de peso por día (aproximadamente la dosis recomendada en humanos) no se observó tumorigenicidad. Aunque se observó un leve incremento en la incidencia del fibroadenoma mamario en ratas hembras que recibieron 0,5 mg/kg de peso por día, dicho incremento no fue significativo.

• Mutagénesis: No se observó actividad mutagénica en test in vitro usando células de mamíferos o bacterias (con o sin activación microsomal) o en test in vivo, incluyendo estudios de dominante letal y cromosoma epitelial germinal en ratón y anomalía nuclear y estudios de aberración cromosómica en hamsters chinos.

• Fertilidad: No se observó daño en la fertilidad en estudios de reproducción realizados en ratas que recibieron dosis de 4 mg/kg de peso.

Embarazo:

Categoría B. No se han realizado estudios bien controlados en mujeres embarazadas. El Diclofenac atraviesa la placenta en ratones y ratas. Estudios en ratas que recibieron dosis de 2 ó 4 mg/kg/día han demostrado que el Diclofenac es embriotóxico (causando peso bajo al nacer, una ligera disminución en la velocidad de crecimiento y menor sobrevida, especialmente con altas dosis). También en estudios en conejos que recibieron 5 ó 10 mg/kg/día, el Diclofenac causó un incremento en los índices de resorción,

disminución del peso fetal, anomalías esqueléticas y embriotoxicidad con las dosis elevadas. Sin embargo no se observó teratogenicidad en estudios de reproducción en conejos que recibieron 10 mg/ kg/día, en ratones que recibieron 20 mg/kg/día o en ratas que recibieron 10 mg/kg/día. Debido a que los estudios en animales no siempre son predictivos de la respuesta en humanos, esta droga será usada durante el embarazo solo en casos donde el médico determine que el beneficio supera al riesgo para el feto.

Lactancia:

El Diclofenac se distribuye en la leche materna. En un estudio de larga duración donde se administró 150 mg por día, se alcanzaron concentraciones de 100 nanogramos por gramo de leche. Un lactante de 4 a 5 kg que consume 1 litro de esta leche por día recibiría aproximadamente 0,03 mg de Diclofenac /kg/día.

Efectos adversos:

Efectos adversos que requieren de atención médica:

• Efectos cardiovasculares: Angina pectoris o exacerbación de la angina pectoris (1-3%); Hemorragias, además de las gastrointestinales: hemoptisis y sangrado de nariz (< 1%).

• Arritmias cardíacas (1-3%); Dolor de pecho (<1%); Falla cardíaca congestiva o exacerbación de la misma (<1%); Hipertensión (<1%).

• Efectos sobre el sistema nervioso central: Confusión; Convulsiones (<1%); Amnesia (<1%); Meningitis aséptica (<1%); Migraña; Cambios mentales o de humor (1 %) incluyendo: desorientación, sentimientos de despersonalización, depresión y reacciones psicóticas. Neuropatía periférica (<1%); Síncope (<1%).

• Efectos dermatológicos: Dermatitis alérgica (<1%); Dermatitis exfoliativa (<1%); Eritema Multiforme (<1%); Síndrome de Stevens-Johnson (<1%).

• Efectos sobre el sistema digestivo: Distensión abdominal (1-3%); Colitis, enterocolitis o exacerbación de las mismas (<1%); Hemorragia o sangrado gastrointestinal (<1%); Perforación gastrointestinal y/o ulceración gastrointestinal,

incluyendo ulceración esofágica, gástrica o péptica, ulceraciones gastro-intestinales múltiples y perforación de lesiones sigmoideas preexistentes (Por ej.: divertículo o carcinoma) (1-3%).

• Efectos genito-uritarios: Sangrado vaginal inesperado y/o sangrado menstrual inusualmente abundante (<1%); Hematuria (<1%); Cistitis (<1%); Uretritis; Micción imperiosa (<1%); Proteinuria (<1%).

• Efectos hematológicos: Agranulocitosis (<1%); Anemia (<1%); Anemia aplásica (<1%); Equimosis (<1%); Anemia hemolítica (<1%); Leucopenia (<1%); Trombocitopenia con o sin púrpura (<1%).

• Efectos hepáticos: Hepatitis o ictericia tóxica (<1%).

• Reacciones de hipersensibilidad: Reacciones anafilácticas o anafilactoides (<1%); Angioedema (<1%); Reacciones alérgicas broncoespásticas (<1%); Edema laríngeo (<1%).

• Efectos oculares: Ambliopía (<1%). Visión doble o borrosa (<1%); Escotomas (<1%).

• Efectos orales y periorales: Estomatitis y aftas (<1%). Edema de labios y lengua (<1%).

• Efectos óticos: Disminución o cambios en la audición.

• Pancreatitis (<1%).

• Efectos renales: Retención de líquidos y edema (1-3 %); Nefritis intersticial (<1%); Síndrome nefrótico (<1%); Oliguria / anuria (<1%); Daño o falla renal (<1%). Cortadad de aliento o respiración dificultosa (<1%).

Efectos adversos que requieren de atención médica solo si continúan o son molestos:

• Efectos cardiovasculares: Palpitaciones (<1%); Rubor (<1%); Hiperhidrosis (<1%).

• Sistema nervioso central: Vértigo (1-3%), Somnolencia (<1%); Cefaleas (3-9%); Nerviosismo o irritabilidad (<1%); Temblores (<1%); Insomnio (<1%); Cansancio inusual (<1%).

• Efectos dermatológicos: Fotosensibilidad o reacción fotoalérgica dermatológica (<1%).

• Efectos gastrointestinales: Calambres, dolor o molestias abdominales (3-9%); Cambios en el gusto (<1%); Distensión o flatulencias (1-3%); Constipación (3-9%); Disminución o pérdida del

apetito (<1%); Diarrea (3-9%); Indigestión (3-9%); Náuseas (3-9%); Vómitos (< 1%).

• Malestar general (< 1%).

• Irritación, sequedad o dolor de boca (< 1%).

• Pérdida de peso: (< 1%).

Sobredosificación:

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los centros de toxicología:

Hospital de Niños R. Gutiérrez: (011) 4962-6866 / 2247
Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648 / 4658-7777

El tratamiento es esencialmente sintomático y de soporte. Luego de una cuidadosa evaluación clínica del paciente, de la valoración del tiempo transcurrido desde la ingesta y de la cantidad ingerida, el profesional decidirá la realización o no del tratamiento general de rescate: Vómito provocado o lavado gástrico. Carbón activado. Purgante salino. La hemodiálisis no elimina efectivamente al Diclofenac de la sangre.

Presentaciones:

Envases conteniendo 30 y 100 comprimidos recubiertos.

Conservación:

Mantener lejos del calor y la luz solar directa. Conservar a una temperatura entre 15 y 30 °C, en lugar seco.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

Especialidad Medicinal Autorizada por el
Ministerio de Salud. Certificado N° 44.832



Dr. LAZAR y Cía. S.A.Q. e I.
Av. Vélez Sarsfield 5853/5855
B1606EPI Munro, Pcia. de Buenos Aires
Directora Técnica: Daniela A. Casas,
Farmacéutica y Bioquímica.

Revisión del prospecto: 6/3/2003

367855
P119