

DIASTONE FLEX

DICLOFENACO

PRIDINOL

Comprimidos Recubiertos - Inyectable (IM)
Venta Bajo Receta
Industria Argentina

Composición:

DIASTONE FLEX Comprimidos Recubiertos

Cada comprimido recubierto contiene:

Diclofenaco sódico	50 mg
Pridinol mesilato	4 mg
Croscarmelosa sódica	8 mg
Dióxido de silicio coloidal	1,6 mg
Alcohol polivinílico/dióxido de titanio/ PEG 3000/talco	4,8 mg
Estearato de magnesio	4 mg
Tartrazina, laca aluminica	30 µg
Azul brillante, laca aluminica	7 µg
Lactosa/povidona/crospovidona c.s.p	164,84 mg

DIASTONE FLEX Inyectable

Cada ampolla con disolvente contiene:

Diclofenaco sódico	75 mg
Propilenglicol	500 mg
Alcohol bencílico	120 mg
Povidona	50 mg
Agua para inyección c.s.p.	3 ml

Cada frasco ampolla con liofilizado contiene:

Pridinol mesilato	2,2 mg
Manitol	40 mg

Acción Terapéutica

Analgésico. Antiinflamatorio, antirreumático, miorrrelajante. Código ATC: M03BX

Indicaciones

Tratamiento de procesos inflamatorios y dolorosos que cursan con contractura muscular, tendinitis, tenosinovitis, bursitis, fibrositis.

Tratamientos de enfermedades reumáticas articulares y extraarticulares, artritis, artrosis, periartritis del hombro, enfermedades de la columna vertebral, espondiloartritis, discopatías, síndromes articulares cervicales y cervicobraquiales.

Tratamientos de procesos traumáticos dolorosos musculo esqueléticos acompañados de contractura muscular, mialgias, lumbalgias, cialgias, torticolis, esguinces, luxaciones, fracturas, distensiones musculares, desgarros.

Acción Farmacológica

Diclofenaco es un antiinflamatorio no esteroideo derivado del ácido fenilacético que actúa inhibiendo la síntesis de prostaglandinas y la agregación plaquetaria.

Pridinol es un relajante muscular no benzodiazepínico.

Actúa en el sistema nervioso central y aunque su mecanismo de acción aún no está totalmente aclarado,

existen evidencias clínicas acerca de su efectividad miorrrelajante.

Farmacocinética

Diclofenaco, por vía oral se absorbe en forma rápida y completa. La concentración plasmática máxima se alcanza en aproximadamente 2 horas.

Por efecto de primer paso hepático sólo se detecta en plasma el 50% del fármaco. La unión a proteínas plasmáticas (albúmina) es del 99% y se acumula en líquido sinovial; eso explica que la duración del efecto terapéutico sea mucho mayor que su vida media plasmática de 1 a 2 horas.

Se metaboliza en el hígado por acción del Citocromo P450, subfamilia CYP2C.

Se elimina después de la glucuronidación y sulfación.

Los metabolitos se excretan con la orina (65%) y por bilis (35%).

Pridinol administrado por vía oral alcanza el pico máximo de concentración plasmática en una hora aproximadamente.

Se distribuye y concentra principalmente en hígado y riñón. El 30% de la dosis se concentra en bilis.

En su biotransformación se conjuga con glucurónido (9%) y como droga no conjugada (9%). Ambas fracciones se eliminan por vía renal.

Posología – Modo de Administración

DIASTONE FLEX – Comprimidos recubiertos

La dosis media habitual es un comprimido recubierto dos veces por día administrado después de la ingesta de alimentos.

DIASTONE FLEX – Inyectable

Como dosis de orientación se aconseja aplicar por vía intramuscular profunda el contenido de la preparación de un frasco-ampolla, dos veces por día.

En forma inyectable no superar los 4 días de aplicación y luego pasar a la vía oral.

Tanto en el caso de comprimidos recubiertos, como en inyectables estas dosis podrán ajustarse de acuerdo al cuadro patológico y al criterio médico.

Dosis máxima: Diclofenaco 200 mg/día.

Preparación del inyectable

Pasar el contenido de la ampolla al frasco-ampolla y agitar suavemente hasta lograr una disolución completa y uniforme.

La preparación deberá usarse dentro de la primera hora de la preparación.

Contraindicaciones

- Hipersensibilidad conocida a diclofenaco, pridinol, o a algunos de los componentes de la fórmula.
- Antecedentes de angioedema, broncoespasmos, urticaria o rinitis alérgica frente a la aspirina u otros antiinflamatorios no esteroideos (AINES).
- Síndrome de pólipos nasales.
- Úlcera gastroduodenal activa.
- Insuficiencia hepática o renal severas.
- Insuficiencia cardíaca grave.
- Niños menores de 15 años.
- Embarazo. Lactancia.
- Adenoma prostático.
- Taquicardia.
- Ileo paralítico.
- Glaucoma de ángulo estrecho.

Advertencias

Efectos gastrointestinales: se ha informado de úlceras pépticas y sangrado gastrointestinal en pacientes en que recibían diclofenaco. Tanto los médicos como los pacientes deberían estar alertas en cuanto a la presentación de estos síntomas, sobre todo durante los tratamientos prolongados, aún en ausencia de trastornos gastrointestinales previos al tratamiento.

Los médicos deberían advertir a los pacientes que tienen historia de trastornos gastrointestinales y otros factores de riesgo que se saben están asociados con úlcera

péptica, como alcoholismo, tabaquismo, etc., de la alta probabilidad de sangrado gástrico.

Los pacientes ancianos o debilitados parecen soportar peor la úlcera o el sangrado. Las dosis altas parecerían producir más cantidad de casos.

Efectos hepáticos: al igual que con otros AINES, se ha informado alteraciones de la función hepática durante el tratamiento con diclofenaco. Estas anomalías pueden agravarse, permanecer sin cambios o ser transitorias a pesar de continuar con la terapia. Muchos pacientes con elevaciones ligeras no debieron interrumpir la medicación, y en muchos casos las elevaciones de las transaminasas no progresaron o desaparecieron.

También se han informado pocos casos de reacciones hepáticas severas, incluyendo ictericia y hepatitis fulminante fatal.

Como la hepatotoxicidad puede presentarse sin síntomas prodrómicos, deberían controlarse periódicamente las transaminasas durante los tratamientos prolongados.

Como con otros AINES, si las anomalías persisten o se agravan, si aparecen síntomas clínicos de enfermedad hepática, o si se producen manifestaciones sistémicas (eosinofilia, eritema, etc) la terapia debe discontinuarse.

Para minimizar la posibilidad de daño hepático, el paciente debe ser advertido de los signos y síntomas que involucran hepatotoxicidad (náuseas, fatiga, letargo, prurito, ictericia, molestias en el cuadrante superior derecho, síntomas “gripales”) a fin de tomar las medidas apropiadas.

El diclofenaco puede inhibir la agregación plaquetaria y prolongar el tiempo de sangría aumentando el riesgo de hemorragias.

En enfermos sometidos a tratamiento anticoagulantes, es conveniente vigilar particularmente la aparición de sintomatología digestiva; en caso de hemorragia gastrointestinal o úlcera péptica, interrumpir el tratamiento.

Debe ser usado con precaución en enfermedades de origen infeccioso o con riesgo de infección aún bien controlado.

Precauciones

Al igual que con otros AINES, se han informado reacciones alérgicas con el uso de diclofenaco. Se han observado manifestaciones específicas de alergia, como hinchazón de los párpados, labios, faringe y laringe, urticaria, asma y broncoespasmo, concomitantemente algunas veces con una disminución de la presión. Raramente se informa reacción anafiláctica.

Por la presencia de pridinol, se recomienda evitar su administración en casos de glaucoma de ángulo estrecho, ileo paralítico, retención urinaria, hipertrofia prostática, taquicardias, miastenia gravis.

Retención de líquido y edema: algunos pacientes desarrollan retención de líquidos y edema; al igual que con otros AINES debería ser utilizado con precaución en pacientes con historia de descompensación cardiaca, hipertensión o cualquier otra condición que predisponga a la retención de líquidos.

Efectos renales: durante la administración crónica en animales, los AINES en general han sido asociados con necrosis papilar renal y otras patologías renales.

Otra forma de toxicidad renal asociada generalmente a los AINES se observa en pacientes con condiciones que conllevan una disminución del flujo sanguíneo renal o del volumen sanguíneo. En estos pacientes se produce una disminución de la síntesis de prostaglandinas, secundariamente, una reducción del flujo renal que puede precipitar un fallo renal. Los pacientes con función renal disminuida, fallo hepático, a los que se administra diuréticos y los ancianos componen el grupo de mayor riesgo. Generalmente el proceso se revierte con la suspensión de la droga, recuperándose el estado pretratamiento.

Puesto que los metabolitos del diclofenaco se eliminan por vía renal, los pacientes con función renal disminuida deberían ser controlados cuidadosamente.

Se debe tener precaución en pacientes con porfiria hepática ya que el diclofenaco puede inducir un ataque agudo.

En pacientes portadoras de dispositivos intrauterinos, se ha descrito la posibilidad de disminución de la eficacia contraceptiva.

Los pacientes que presentan mareos u otras alteraciones del sistema nervioso central no deben conducir vehículos ni operar maquinarias.

También se debe administrar con cuidado en pacientes con hipersensibilidad a otros antiinflamatorios no esteroides.

Se debe usar con precaución en los pacientes que deben restringir el consumo de sodio.

Interacciones medicamentosas

La administración simultánea de diclofenaco con algunos de los siguientes medicamentos requiere de una vigilancia médica más estrecha del estado clínico y biológico del paciente.

- Diclofenaco puede aumentar los efectos de los anticoagulantes orales y de la heparina. Cuando la asociación es indispensable, controlar el tiempo de protrombina.
- Diclofenaco puede aumentar el efecto de las sulfamidas hipoglucemiantes y en ocasiones cambios en el efecto de la insulina.
- La toma simultánea de diclofenaco y litio o digoxina puede aumentar los niveles plasmáticos de estas drogas, aunque no se describen signos clínicos de sobredosificación.

- Diclofenaco puede disminuir la actividad de los diuréticos y reforzar la acción de los que ahorran potasio, lo cual obliga a determinar los valores de potasio en sangre.
- La administración conjunta de corticoides, otros antiinflamatorios no esteroides anti reumáticos pueden favorecer la aparición de efectos indeseables gastrointestinales.
- Metotrexato: aumento de la toxicidad hematológica del metotrexato cuando se asocia con ciertos AINES.
- Ciclosporina: puede aumentar la nefrotoxicidad de la misma al asociarse con diclofenaco.
- Antihipertensivos (beta bloqueantes, inhibidores de la enzima de conversión, diuréticos) reducción del efecto hipotensor.
- Interferon alfa: riesgo de inhibición de su acción.
- Aspirina, no se recomienda el uso concomitante, ya que desplaza al diclofenaco de sus sitios de unión, por lo que se producen menores concentraciones en plasma, menores picos plasmáticos y valores AUC. Además altera la función plaquetaria y el desempeño de las prostaglandinas en la hemostasia.

En un pequeño número de pacientes, la administración de azatioprima, oro, cloroquina, d-penicilamina, prednisolona, doxiciclina y digoxina no alteraron los niveles pico ni el AUC.

In vitro el diclofenaco, no interfiere, o lo hace muy poco con la unión del ácido salicílico a las proteínas (20% de disminución) tolbutamina, prednisolona (10% de disminución) o warfarina.

La bencilpenicilina, ampicilina, oxacilina, clortetraciclina, doxiciclina, cefalotina, eritromicina, y sulfametoxazol no tuvieron influencia sobre la unión a proteínas plasmáticas, in vitro.

Los antidepresivos tricíclicos, la quinidina y la amantadina pueden potenciar el efecto atropínico del pridinol.

Alteraciones en las pruebas de laboratorio:

Con el tratamiento a largo plazo puede prolongarse el tiempo de sangría. Puede disminuir la concentración sérica de ácido úrico y aumentar los valores de transaminasas hepáticas.

Carcinogénesis, mutagénesis, daños en la fertilidad:

No se ha descrito hasta el momento evidencia de carcinogénesis, mutagénesis o daño en la fertilidad con el uso de diclofenaco ni pridinol.

Embarazo. Efecto teratogénico:

En la especie humana, no se ha señalado ninguna malformación particular. Sin embargo, se requieren estudios

epidemiológicos complementarios para confirmar o invalidar este concepto.

Se recomienda no administrar diclofenaco durante los tres primeros meses de embarazo debido al posible riesgo teratogénico.

Durante el curso del tercer trimestre, todos los inhibidores de la síntesis de prostaglandinas pueden exponer al feto a una toxicidad cardiopulmonar (hipertensión pulmonar con cierre prematuro del ducto arterioso) y renal, pudiendo exponer en el final del embarazo a la madre y al bebé a un alargamiento de los tiempos de hemorragia.

En consecuencia, la toma de AINES está absolutamente contraindicada durante el embarazo.

Trabajo de parto y alumbramiento:

Se presenta una mayor incidencia de distocia y parto retrasado en ratas.

Amamantamiento:

El diclofenaco pasa a través de la leche materna en una cantidad muy pequeña. Por consiguiente no se recomienda administrar diclofenaco durante la lactancia.

Pediatría:

No ha sido estudiado sistemáticamente, por lo tanto se desaconseja su uso especialmente del inyectable.

Efectos adversos

Se observan: dolor epigástrico, úlcera péptica, náuseas, vómitos, diarrea, constipación, sequedad de boca; cefaleas, mareos, vértigo, hipotonía muscular; rash cutáneo, prurito, urticaria.

Raramente: hemorragias ocultas o no, úlcera péptica; somnolencia, visión borrosa, escotomas, insuficiencia renal; retención urinaria, disuria, síndrome nefrótico; reacciones anafilácticas. Broncoespasmo; taquicardia, cícloplegia, ictericia, hipotensión ortostática.

Excepcionalmente: colitis hemorrágica inespecífica, exacerbación de colitis ulcerosa; excitación psicomotriz, anemia hemolítica, leucopenia, trombocitopenia, agranulocitosis, anemia aplásica, hepatitis, miastenia.

Sobredosificación:

Los síntomas de sobredosis incluyen: náuseas, vómitos, diarrea, dolor abdominal, mareos, inquietud, cefaleas,

agitación matriz, convulsiones, oliguria, agitación psicomotriz, distonias musculares, trastornos de la función hepática.

En caso de intoxicación aguda se debe realizar lavado gástrico, administrar carbón activado y antiácidos e instituir medidas sintomáticas de sostén para las complicaciones (diálisis en caso de insuficiencia renal, diazepam en caso de convulsiones).

“Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Hospital de Pediatría Dr. Ricardo Gutiérrez:

(011) 4962 - 6666/2247

Hospital A. Posadas:

(011) 4654 - 6648 / 4658 - 7777”

“Todo medicamento debe permanecer alejado del alcance de los niños”.

Formas de Conservación:

Conservar en lugar seco, proteger de la luz. Temperatura ambiente de 15°C a 30°C.

Presentaciones

DIASTONE FLEX Comprimidos recubiertos: Envases con 10, 20, 30, 40 y 60 comprimidos recubiertos
DIASTONE FLEX Inyectable: Envases con 1, 3, 6 y 12 ampollas con disolvente e igual número de frascos-ampollas con liofilizado.

Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud. Certificado N° 51.807

Director Técnico: Saez, Gabriel. Farmacéutico.

Elaboración: Hipólito Yrigoyen 3769/71, CABA y/o Juan Agustín García 5420, CABA y/o Uruguay 355, 363/365, Villa Martelli, Pcia. de Buenos Aires

Fecha de última revisión: 1° de Noviembre de 2004.

MICROSULES ARGENTINA S.A. DE S.C.I.A.A.

Ruta Panamericana Km 36,5 (B16191EA) Garín, Pdo. de Escobar, Pcia. de Buenos Aires. Tel: 03327-452629
www.microsules.com.ar