

# DIASTONE DICLOFENACO

Comprimidos recubiertos 50, 75 mg  
Comprimidos recubiertos RETARD  
Venta Bajo Receta  
Industria Argentina

## Comprimidos:

### Diastone 50

#### Comprimidos recubiertos:

Cada comprimido recubierto contiene:  
Diclofenaco sódico . . . . . 50 mg  
Celulosa microcristalina . . . 26,28 mg  
Acido metacrílico  
co-polímero tipo C/  
dióxido de titanio/talco . . . . 19,2 mg  
Crospovidona . . . . . 6,4 mg  
Croscarmelosa sódica . . . . . 4,8 mg  
Almidón glicolato sódico. . . . 4,8 mg  
Estearato de magnesio. . . . . 4 mg  
Laurilsulfato de sodio polvo . . 3,2 mg  
Dióxido de silicio coloidal . . . . 0,8 µg  
Simeticona emulsionada . . . . .96 µg  
Lactosa monohidrato c.s.p. 179,3 mg

### Diastone 75

#### Comprimidos recubiertos

Diclofenaco sódico . . . . . 75 mg  
Celulosa microcristalina . . . . 21,36 mg  
Acido metacrílico  
co-polímero tipo C/  
dióxido de titanio/talco . . . . 20,4 mg  
Crospovidona . . . . . 6,8 mg  
Croscarmelosa sódica . . . . . 5,1 mg  
Almidón glicolato sódico. . . . 5,1 mg  
Estearato de magnesio. . . . . 4,25 mg  
Laurilsulfato de sodio polvo . . 3,4 mg  
Dióxido de silicio coloidal . . . 0,85 mg  
Simeticona emulsionada . . . . 102 mg  
Eritrosina, laca aluminica . . . . 67,9 µg  
Lactosa monohidrato c.s.p. 190,6 mg

### Diastone Retard

#### Comprimidos recubiertos

Cada comprimido recubierto contiene:  
Diclofenaco sódico . . . . . 100,0 mg  
Celulosa microcristalina . . . 189,63 mg  
Talco . . . . . 59,0 mg  
Amonio metacrilato  
co-polímero tipo B . . . . . 25,38 mg  
Polivinilpirrolidona K 30 . . . . 25,0 mg  
Estearato de magnesio. . . . . 14,0 mg  
Alcohol polivinílico/dióxido  
de titanio/PEG 3000/ talco . . . 9,0 mg

## Acción terapéutica:

Antiinflamatorio, analgésico, antirreumático y antipirético.

- En el niño su uso se limita a: reumatismos inflamatorios infantiles.

## Indicaciones:

DIASTONE está indicado en:

### Tratamiento sintomático prolongado de:

- Reumatismos inflamatorios crónicos, principalmente poliartritis reumatoidea, espondilitis anquilosante, etc.
- Ciertas artrosis dolorosas e invalidantes.

### Tratamiento sintomático de corta duración de las crisis agudas de:

- Reumatismos extraarticulares (hombro doloroso, tendinitis, bursitis, epicondilitis, lumbalgias, radiculalgias severas).
- Procesos dolorosos musculares agudos y de partes blandas: torticólis, esguinces, miositis, etc.
- Dismenorrea primaria.
- Tratamiento coadyuvante de las manifestaciones inflamatorias otorrinolaringológicas.

## Acción farmacológica

Es un antiinflamatorio no esteroide derivado del ácido fenilacético que actúa en la síntesis de prostaglandinas y la agregación plaquetaria.

## Farmacocinética:

Se absorbe en forma rápida por vía oral y luego de ingerir 50 mg, las concentraciones plasmáticas alcanzan el valor máximo de 1,5 mg/l al cabo de 2 horas. El diclofenaco penetra en el líquido sinovial y se miden las concentraciones máximas 2 a 4 horas luego del pico plasmático.

La mitad de la dosis se metaboliza en el hígado y se fija 99% a las proteínas séricas (albúmina). Se excreta 60% por orina en forma de metabolitos mientras que el resto se metaboliza por bilis en las heces.

**Posología: Modo de administración:**

Los comprimidos deben ingerirse enteros y no deben masticarse.

**Osteoartritis:** 100-150 mg/día divididos en dos tomas.

**Artritis reumatoidea:** 100-200 mg/día en dosis divididas.

**Espondilitis anquilosante:** 125 mg/día.

**Dismenorrea:** 100 mg/día en dosis divididas.

**DIASTONE Retard:** 1 comprimido por día. No es conveniente utilizar 2 comprimidos de liberación prolongada por día.

**Contraindicaciones:**

- Hipersensibilidad conocida a diclofenaco 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 esteroides (AINES).
- Síndrome de pólipos nasales.
- Úlcera gastroduodenal activa.
- Insuficiencia hepática o renal severas.
- Insuficiencia cardíaca grave.
- Niños menores de 15 años.
- Embarazo. Lactancia.

**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 acerca de los signos y síntomas de toxicidad gastrointestinal seria y las medidas que deberían tomar si esto ocurre.

No ha sido posible todavía identificar al grupo de pacientes que no presente este riesgo. Excepto para los que tienen historia de trastornos gastrointestinales y otros factores de riesgo que se saben están asociados con úlcera péptica, como alcoholismo, tabaquismo, etc., los pacientes ancianos o debilitados parecen soportar peor la úlcera o el sangrado, y se informaron más casos en este grupo. 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 pa-

cientes 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.

**Diastone 75 mg comprimidos recubiertos:** *"Este medicamento contiene eritrosina como colorante".*

**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 informó reacción anafiláctica.

**Retención de líquido y edema:** algunos de los pacientes, desarrollaron retención de líquidos y edema; al igual que los otros AINES debería ser utilizado con precaución en pacientes con historia de descompensación cardíaca, 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 en 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 pretreatmento.

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 manifestar 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.

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 esteroideos antiartrémicos 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.

En pequeño número de pacientes, la administración de azatioprina, 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 benzilpenicilina, la ampicilina, la oxacilina, la clortetraciclina, la doxiciclina, la cefalotina, la eritromicina, y el sulfametoxazol no tuvieron influencia sobre la unión a proteínas plasmáticas, in vitro.

### **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.

### **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 ductus arterioso) y renal, pu-

diendo 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 el inyectable.

#### **Efectos adversos**

*Ocasionalmente:* se observan dolor epigástrico, náuseas, vómitos, diarrea; cefaleas, mareos, vértigo; rash cutáneo.

*Raramente:* hemorragias ocultas o no, úlcera péptica; somnolencia, trastornos de la visión, insuficiencia renal; alteraciones urinarias, síndrome nefrótico; reacciones anafilácticas. Broncoespasmo; elevación de transaminasas, ictericia.

*Excepcionalmente:* colitis hemorrágica inespecífica, exacerbación de colitis ulcerosa; anemia hemolítica, leucopenia, trombocitopena, agranulocitosis, anemia aplásica, hepatitis.

#### **Sobredosificación:**

Los síntomas de sobredosis incluyen: náuseas, vómitos, diarrea, dolor abdominal, mareos, inquietud, cefaleas, agitación matriz, convulsiones, oliguria.

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 Gutierrez:***

***(011) 4962-6666/2247***

***Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777”***

***Conservar en lugar seco preferentemente por debajo de 30°C***

#### **Presentaciones**

**DIASTONE 50 mg:**

Envases con 15, 30 y 750 comprimidos recubiertos.

**DIASTONE 75 mg:**

Envases con 15 y 30 comprimidos recubiertos.

**DIASTONE Retard 100 mg:**

Envases con 15 comprimidos recubiertos.

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

Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud. Certificado N° 46.163

**Director Técnico:** Gabriel Saez. Farmacéutico.

**Elaboración:** Hipólito Yrigoyen 3769/71, CABA.

**Fecha de última revisión:** 15/11/1999