

INFORMACIÓN PARA PRESCRIBIR AMPLIA

IPP - A

1. DENOMINACIÓN DISTINTIVA

DOLFLAM

2. DENOMINACIÓN GENÉRICA

DICLOFENACO

3. FORMA FARMACÉUTICA Y FORMULACIÓN

Forma Farmacéutica: Solución Inyectable

Fórmula: Cada ampolleta contiene:

Diclofenaco Sódico.....	75	mg
Vehículo cbp.....	3	ml

4. INDICACIONES TERAPÉUTICAS

El Diclofenaco es el primero de una serie de derivados del ácido fenilacético que se desarrollaron como agentes antiinflamatorios con propiedades analgésicas y antipiréticas. Está indicado en el tratamiento agudo y crónico de: Artritis reumatoide, osteoartritis, espondilitis anquilosante, artrosis, espondiloartrosis y otros padecimientos inflamatorios y/o degenerativos del sistema músculo-esquelético. Síndromes dolorosos de la columna vertebral: traumatismo en latigazo de la columna cervical, dolor de columna baja, síndrome de disco.

Padecimientos traumáticos del sistema osteoarticular: esquiñes, contusiones, luxaciones, fracturas, ataque agudo de gota, padecimientos inflamatorios y dolorosos post-operatorios.

5. FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA

Se absorbe con rapidez y por completo después de la administración intramuscular; obteniéndose concentraciones plasmáticas de 2.5 mcg/ml, concentraciones proporcionales a la dosis aplicada.

El área debajo de la curva es aproximadamente dos veces mayor a la obtenida con una dosis similar administrada por vía oral o rectal, ya que existe un importante efecto de primer paso en el hígado de tal forma que sólo alrededor del 50% del Diclofenaco se encuentra disponible en forma sistémica.

Después de su absorción, se distribuye ampliamente en el organismo y se fija a proteínas plasmáticas en un 99.7%, principalmente a la albúmina en forma reversible. La depuración y el volumen de distribución son aproximadamente 350 ml/min y 550 ml/Kg respectivamente. El líquido sinovial presenta concentraciones adecuadas de Diclofenaco y estas concentraciones permanecen por mayor tiempo en relación al tiempo en que permanecen en plasma.

El Diclofenaco sódico se metaboliza rápidamente en el hígado formando conjugados glucurónicos e hidroxilados. El aclaramiento sistémico total de Diclofenaco en plasma es de 263 ± 56 ml /min y la vida media terminal en plasma es de 2 horas. Los conjugados del principal metabolito 4- hidroxidiclofenaco constituyen del 20 al 30% de la cantidad excretada del mismo por la orina y del 10 al 20% de éste se excreta por la bilis.

Alrededor del 65% de la dosis de Diclofenaco sódico administrada es excretada por la orina y el restante 35% en la bilis.

6. CONTRAINDICACIONES

DOLFLAM (F.F. SOLUCIÓN INYECTABLE) está contraindicado en pacientes hipersensibles al Diclofenaco Sódico. Tampoco debe administrarse a pacientes en los que el Diclofenaco, el ácido acetilsalicílico y otros analgésicos, antiinflamatorios no esteroideos hayan inducido asma, urticaria u otros tipos de reacción alérgica, porque se han reportado reacciones anafilácticas graves, en estas condiciones. Enfermedad ácido péptica, pacientes con antecedentes de sangrado del tubo digestivo, embarazo, lactancia y niños menores de 12 años. Insuficiencia cardíaca, renal o hepática. Hipertensión arterial severa, citopenias.

7. PRECAUCIONES GENERALES

Advertencias: En cualquier momento del tratamiento puede producirse hemorragia gastrointestinal o úlcera/perforación, con o sin síntomas prodrómicos o historial previo. Generalmente, las consecuencias son más graves en los pacientes de edad avanzada. El medicamento se retirará en los casos excepcionales en los que se produzcan hemorragias gastrointestinales.

Como sucede con otros antiinflamatorios no esteroideos pueden producirse, en raras ocasiones, reacciones alérgicas, inclusive anafilácticas/anafilactoides, sin exposición previa al fármaco. La presencia de metabisulfito sódico en las ampollitas puede ocasionar también en casos aislados reacciones de hipersensibilidad.

Como otros antiinflamatorios no esteroideos, el Diclofenaco 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 gastrointestinales o con historial que sugiere 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 antiinflamatorios no esteroideos, pueden aumentar los valores de una o más enzimas hepáticas. Por precaución, se monitoreará la función hepática durante el tratamiento prolongado con Diclofenaco. 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 (p. ej. eosinofilia, eritema, etc.), deberá interrumpirse la medicación con Diclofenaco. Puede ser que la hepatitis sobrevenga sin síntomas prodrómicos. Se tendrá precaución al administrar Diclofenaco en pacientes con porfiria hepática, ya que este medicamento puede desencadenar un ataque.

Debido a la importancia que revisten las prostaglandinas en el mantenimiento de la irrigación renal, se tendrá particular precaución en los sujetos con deterioro de la función cardíaca o renal, en las personas de edad avanzada, en los que son tratados con diuréticos, así como en los pacientes con una depleción sustancial del volumen extracelular por cualquier causa, p. ej. en la fase preoperatoria y postoperatoria de intervenciones quirúrgicas mayores. Por ello, se recomienda monitorear la función renal como medida de precaución cuando se administra Diclofenaco. A la interrupción del tratamiento suele seguir la recuperación. Al igual que con otros antiinflamatorios no esteroideos, se recomienda la realización de un monitoreo hematológico en el tratamiento prolongado con Diclofenaco. Como otros antiinflamatorios no esteroideos, el Diclofenaco puede inhibir temporalmente la agregación plaquetaria. Los pacientes con trastornos de la hemostasis deberían ser monitoreados cuidadosamente. Se recomienda especial precaución en el empleo parenteral de Diclofenaco en pacientes con asma bronquial, ya que los síntomas pueden ser exacerbados. Por razones médicas de índole básica, se exige cautela en los enfermos de edad avanzada. Se recomienda en particular emplear la menor dosis eficaz en los pacientes ancianos débiles o en los que tengan poco peso corporal.

Efectos sobre la capacidad de conducir o manejar máquinas: Los pacientes que experimenten mareos u otros trastornos nerviosos centrales, inclusive trastornos de la visión, no deberán conducir vehículos ni manejar maquinaria.

Incompatibilidades farmacéuticas: Como norma general, el Diclofenaco F.F. Solución inyectable no deberá mezclarse con otras soluciones inyectables. Las soluciones para infusión de cloruro de sodio al 0.9% o glucosada al 5% sin bicarbonato sódico como aditivo tienen el riesgo de supersaturación, provocando posiblemente la formación de cristales o precipitados. No se deben emplear otras soluciones para infusión que las recomendadas.

8. RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA

No existen estudios controlados sobre el uso del Diclofenaco en la mujer embarazada. Por tal motivo, aunque los estudios de reproducción en animales, no han detectado alteraciones fetales, **DOLFLAM** no debe usarse en la mujer embarazada. El Diclofenaco se ha encontrado en la leche materna durante la lactancia, por ello, no se recomienda su uso durante esta etapa.

9. REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS

Se utilizan las siguientes frecuencias estimadas: Frecuentes > 10%, ocasionales > 1-10%, raros > 0.001-1%, en casos aislados < 0.001%.

Tracto gastrointestinal: Ocasionales: dolor epigástrico, otros trastornos gastrointestinales como náuseas, vómitos, diarrea, calambres abdominales, dispepsia, flatulencia y anorexia. Raras veces: hemorragias gastrointestinales (hematemesis, melena, diarrea sanguinolenta) úlcera gástrica o intestinal con o sin hemorragia o perforación. En casos aislados: estomatitis aftosa, glositis, lesiones esofágicas, estenosis intestinales por formación de “diafragmas”, trastornos intestinales bajos como colitis hemorrágica inespecífica y exacerbación de la colitis ulcerosa, estreñimiento y pancreatitis.

Sistema nervioso central: En ocasiones: cefalea, mareo o vértigo. Raramente: somnolencia. En casos aislados: trastornos de la sensibilidad, inclusive parestesias, trastornos de la memoria, desorientación, insomnio, irritabilidad, convulsiones, depresión, ansiedad, pesadillas, temblor, reacciones psicóticas y meningitis aséptica.

Sentidos especiales: En casos aislados: trastornos de la visión (visión borrosa, diplopía), pérdida de la audición, tinnitus, alteraciones del gusto.

Piel: En ocasiones: eritemas o erupciones cutáneas. Raras veces: urticaria. En casos aislados: erupciones bulosas, eccemas, eritema multiforme, síndrome de Stevens-Johnson, síndrome de Lyell (epidermólisis tóxica aguda), eritrodermia (dermatitis exfoliativa), caída del cabello, reacción de fotosensibilidad; púrpura, inclusive púrpura alérgica.

Riñones: Raramente: edema. En casos aislados: insuficiencia renal aguda, alteraciones urinarias como hematuria, proteinuria, nefritis intersticial, síndrome nefrótico y necrosis papilar.

Hígado: En ocasiones: aumento de los valores séricos de aminotransferasas. Raramente: hepatitis con o sin ictericia. En casos aislados: hepatitis fulminante.

Hipersensibilidad: Raramente: reacciones de hipersensibilidad como asma, reacciones sistémicas anafilácticas/anafilactoides inclusive hipotensión. En casos aislados: vasculitis, neumonitis.

Sistema cardiovascular: En casos aislados: palpitación, dolor torácico, hipertensión e insuficiencia cardíaca congestiva.

Otros sistemas orgánicos: Ocasionalmente: reacciones en el punto de la inyección intramuscular como dolor local y endurecimiento. En casos aislados: abscesos locales y necrosis en el punto de la inyección intramuscular.

10. INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTRO GÉNERO

La toma simultánea de Diclofenaco y preparados a base de litio o digoxina puede elevar el nivel plasmático de los mismos. Es posible que diversos antiinflamatorios no esteroideos inhiban el efecto de los diuréticos. Puede ser que el tratamiento concomitante con diuréticos que ahorran potasio esté relacionado con una hiperpotasemia, lo cual obliga a vigilar los niveles séricos del potasio. La administración al mismo tiempo de diversos antiinflamatorios sistémicos no esteroideos puede favorecer la aparición de efectos colaterales. Aunque los estudios clínicos parecen indicar que el Diclofenaco no influye sobre el efecto de los anticoagulantes, hay algunos informes de que el peligro de hemorragia es mayor durante el empleo combinado de Diclofenaco y anticoagulantes. Por consiguiente, se recomienda vigilar estrechamente a tales pacientes.

Los estudios clínicos han mostrado que el Diclofenaco puede administrarse junto con antidiabéticos orales sin que influya sobre su efecto clínico. No obstante, hay informes aislados de que se producen efectos tanto hipoglucémicos como hiperglucémicos en presencia de Diclofenaco que exigen modificar la dosificación del hipoglucemiante.

Se debe tener precaución cuando se empleen los antiinflamatorios no esteroideos menos de 24 horas antes o después de un tratamiento con metotrexato, ya que pueden elevar la concentración sanguínea del metotrexato y aumentar la toxicidad del mismo.

Los efectos de los AINEs sobre las prostaglandinas pueden aumentar la nefrotoxicidad de la ciclosporina.

Existen informes aislados de convulsiones debidas posiblemente al empleo concomitante de quinolonas y antiinflamatorios no esteroideos.

11. ALTERACIONES EN LOS RESULTADOS DE PRUEBAS DE LABORATORIO

En un 15% de los enfermos se produce aumento de la actividad plasmática de las transaminasas hepáticas. Aunque suelen ser moderados estos valores pueden aumentar más de tres veces en un pequeño porcentaje de pacientes, con frecuencia aquellos que son tratados por osteoartritis. Por lo general, el aumento de las transaminasas se presenta durante las primeras ocho semanas de TX. Deberá suspenderse la droga si persisten los valores anormales o si se desarrollaran otros signos y síntomas.

Se han observado casos aislados de trombocitopenia, leucopenia, anemia hemolítica, anemia aplásica y agranulocitosis.

Al igual que con otros antiinflamatorios no esteroideos, se aconseja efectuar hemogramas durante el tratamiento prolongado con Diclofenaco.

12. PRECAUCIONES EN RELACIÓN CON EFECTOS DE CARCINOGENESIS, MUTAGENESIS, TERATOGENESIS Y SOBRE LA FERTILIDAD

Los estudios de carcinogénesis conducidos en ratas, empleando dosis de 2 mg/kg/día no revelaron incrementos significativos en la frecuencia de tumores. Diclofenaco Sódico no mostró potencial mutagénico en diversos estudios, incluyendo la prueba de Ames. La administración de dosis de 4 mg/kg/día no afectó la fertilidad. Los estudios de reproducción en ratones, empleando dosis de hasta 20 mg/kg/día y en ratas, a dosis de 10 mg/kg/día, no revelaron evidencia alguna de teratogénesis.

13. DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN

Vía de administración: Intramuscular e Intravenosa por infusión (I.V.).

Adultos: Las ampollas de **DOLFLAM*** se aplicarán durante dos días nada más, en caso necesario, se proseguirá con grageas de DOLFLAM RETARD.

Aplicación intramuscular: Para evitar un daño al nervio o tejido en el sitio de la aplicación, se deben seguir cuidadosamente las siguientes instrucciones para la aplicación de la inyección intramuscular. La dosificación es generalmente de una ampollita diaria de 75 mg por vía intraglútea profunda en el cuadrante superior externo.

Excepcionalmente, en los casos graves pueden administrarse dos inyecciones diarias de 75 mg con un intervalo de varias horas (cambiando de lado). En los ataques de migraña, la experiencia clínica se limita al empleo inicial de una ampollita de 75 mg administrada lo antes posible.

Niños: DOLFLAM* F.F. Solución inyectable, no se recomienda en niños.

14. MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL

El tratamiento de la intoxicación aguda con antiinflamatorios no esteroideos consiste principalmente en medidas de apoyo y sintomáticas. No se conoce un cuadro clínico típico tras la sobredosificación con el Diclofenaco.

Las medidas terapéuticas a tomar en caso de sobredosis son las siguientes: Se aplicarán medidas de apoyo y sintomáticas contra las complicaciones como hipotensión, insuficiencia renal, convulsiones, irritación gastrointestinal y depresión respiratoria.

Los tratamientos específicos, como diuresis forzada, diálisis o hemoperfusión, son probablemente poco útiles para eliminar los antiinflamatorios no esteroideos a causa de su elevada tasa de fijación proteica y su metabolismo extenso.

15. PRESENTACIONES

Caja con 2 ampollitas de 75 mg/3 ml para Venta al Público y Exportación.

Caja con 4 ampollitas de 75 mg/3 ml para Venta al Público y Exportación.

Caja con 2 ampollitas de 75 mg/3 ml y 2 jeringas estériles desechables para Venta al Público y Exportación.

PRESENTACION G.I.

Caja con 2 ampollitas de 75 mg/3 ml para Venta al Público y Exportación.

Caja con 4 ampollitas de 75 mg/3 ml para Venta al Público y Exportación.

Caja con 2 ampollitas de 75 mg/3 ml y 2 jeringas estériles desechables para Venta al Público y Exportación.

16. RECOMENDACIONES SOBRE ALMACENAMIENTO

Consérvese a temperatura ambiente a no más de 30°C.

Protéjase de la luz.

17. LEYENDAS DE PROTECCIÓN

Literatura exclusiva para médicos.

Su venta requiere receta médica.

No se deje al alcance de los niños.

No se use en el embarazo, lactancia, ni en niños menores de 12 años.

No se administre si la solución no es transparente, si contiene partículas en suspensión o sedimentos.

Si no se administra todo el producto deséchese el sobrante.

18. NOMBRE Y DOMICILIO DEL LABORATORIO

FARMACÉUTICOS RAYERE, S.A.

Emiliano Zapata No. 72

México, D. F. 03300

19. NÚMERO DEL REGISTRO DEL MEDICAMENTO E IPP

Reg. No. 089M94 SSA IV

Clave IPP: EEAR-06330060100151/RM2006