

Piel: rash, prurito, urticaria, angioedema, síndrome de Stevens-Johnson.
Organos de los sentidos: tinnitus, visión borrosa, escotomas, trastornos del gusto.
Cardiovascular: hipertensión, insuficiencia cardíaca congestiva.
Efectos hematológicos: anemia, leucopenia, trombocitopenia.
Efectos renales: oliguria, nefritis intersticial, necrosis papilar, insuficiencia renal aguda.
Sistema respiratorio: epistaxis, asma, edema laríngeo.
Con el pridinol se han reportado los siguientes efectos colaterales:
Cardiovascular: hipertensión.
Sistema Nervioso: mareos y caídas, hipotonía muscular, miastenia, trastornos de la acomodación visual, alucinaciones, acatisia.
Piel: urticaria y prurito.

Sobredosificación

Los síntomas de sobredosis aguda incluyen cefalea, agitación psicomotriz, espasmos musculares, convulsiones, dolor epigástrico, náuseas, vómitos, hematemesis, diarrea, úlcera gastroduodenal, trastornos de la función hepática y oliguria.

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

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666/2247

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

Optativamente otros Centros de Intoxicaciones.

Tratamiento orientativo inicial de la sobredosificación: en caso de sobredosis se recomienda la realización inmediata de vaciado gástrico a través de lavados o inducción del vómito.

Puede ser beneficioso provocar diuresis forzada debido a que las drogas se excretan en orina. No se ha establecido la eficacia de la diálisis o hemoperfusión en la eliminación del producto. El uso de carbón activado puede ayudar a reducir la absorción de las drogas.

Presentación

BLOKIUUM FLEX - Comprimidos recubiertos: Envases con 15 y 30 comprimidos recubiertos.

BLOKIUUM FLEX - Inyectable IM: Envases con 3 y 6 ampollas con disolvente y 3 y 6 frascos-ampolla con liofilizado.

Fecha de última revisión: julio de 2007

Forma de conservación

- Conservar en lugar fresco y seco, preferentemente entre 15 y 30°C.

- Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Luis M. Radici - Farmacéutico.
MEDICAMENTO AUTORIZADO POR EL MINISTERIO DE SALUD.
Certificado N° 47.789

Laboratorios CASASCO S.A.I.C.

Boyacá 237 - Buenos Aires

Inyectable: La elaboración de las ampollas se realizará en: Av. Villegas 1510 - San Justo - Bs. As
La elaboración del liofilizado se realiza en: Av. Villegas 1510 - San Justo - Bs. As

E-0061-04 / D1071 / Act.04/2009

 CASASCO

4

BLOKIUUM® FLEX



DICLOFENAC SODICO PRIDINOL MESILATO

COMPRIMIDOS RECUBIERTOS
INYECTABLE I.M.

Industria Argentina
Venta Bajo Receta

Fórmulas

Comprimidos recubiertos

Cada comprimido recubierto contiene:

Diclofenac sódico 50,00 mg

Pridinol mesilato 4,00 mg

Excipientes: lactosa monohidrato 95,00 mg; celulosa microcristalina 34,00 mg; croscarmelosa sódica 9,00 mg; estearato de magnesio 1,80 mg; dióxido de silicio coloidal 2,00 mg; hidroxipropilmetilcelulosa E15 7,33 mg; óxido de hierro amarillo 95,20 µg; óxido de hierro rojo 18,10 µg; bióxido de titanio 0,57 mg; polietilenglicol 6000 1,33 mg; talco 4,77 mg.

Inyectable

Cada ampolla con disolvente contiene:

Diclofenac sódico 75,0 mg

Excipientes: manitol 18,00 mg; propilenglicol 800,00 mg; alcohol bencílico 120,00 mg, metabisulfito de sodio 9,00 mg, hidróxido de sodio c.s.p. pH 8,6; agua para inyección c.s.p. 3,00 ml.

Cada frasco ampolla con liofilizado contiene:

Pridinol mesilato 2,20 mg

Excipientes: manitol 67,80 mg.

Acción Terapéutica: analgésico. Antiinflamatorio. Miorrelajante.

Indicaciones: BLOKIUUM FLEX está indicado en procesos inflamatorios dolorosos acompañados por contractura muscular. Procesos reumáticos articulares y extra-articulares. Mialgias. Lumbalgias. Ciatalgias. Tortícolis. Traumatismos. Esguinces.

Acción Farmacológica: el diclofenac es una droga antiinflamatoria no esteroidea que actúa a través de la inhibición de la síntesis de prostaglandinas.

El pridinol es un relajante muscular de acción central efectivo sobre el espasmo muscular. El mecanismo de acción no se encuentra completamente dilucidado aunque su actividad depresora sobre el sistema nervioso central puede contribuir a su efecto miorrelajante.

Farmacocinética: el diclofenac se absorbe bien a partir del tracto gastrointestinal, sin embargo, debido a efecto de primer paso metabólico, sólo el 50% de la dosis absorbida se encuentra disponible en forma sistémica. Los niveles plasmáticos pico se alcanzan a las dos horas con un rango de 1 a 4 horas. El área bajo la curva es proporcional a la dosis en el rango de 25 a 150 mg. Los niveles plasmáticos pico para una dosis de 50 mg es de 1,5 µg/ml aproximadamente. Luego de la administración oral repetida del producto en dos tomas diarias no se produce acumulación de diclofenac en el plasma. Cuando se administra junto con los alimentos la absorción se retarda en 1 a 4,5 horas y los niveles plasmáticos pico se reducen en un 40%. Sin embargo, el grado de absorción de diclofenac no se afecta significativamente. Más del 99% del

1

diclofenac se une reversiblemente a la albúmina plasmática. Al igual que otros DAINE el diclofenac difunde hacia el espacio articular cuando los niveles plasmáticos son mayores a los niveles en el líquido sinovial. El diclofenac se elimina en un 65% a través de excreción urinaria y en un 35% biliar principalmente en forma de metabolitos conjugados (glucurónido y sulfato). La vida media plasmática es de 1 a 2 horas. El diclofenac también se detecta en la leche materna. El pridinol se absorbe en el tracto gastrointestinal alcanzado una concentración pico-plasmática una hora después de su administración. El 30-40% de la dosis se concentra en bilis y en otros tejidos, especialmente hígado y riñón. La eliminación urinaria se produce en forma de droga no conjugada en un 9% y un porcentaje similar como su conjugado glucurónido.

Posología - Modo de Administración

BLOKIUUM FLEX - Comprimidos recubiertos: un comprimido dos veces por día, preferentemente después de las comidas. Podrá ajustarse de acuerdo a criterio médico.

BLOKIUUM FLEX Inyectable: un frasco ampolla intramuscular dos veces por día. Introducir el contenido de la ampolla en el frasco ampolla y agitar suavemente.

Utilizar antes de la hora de su preparación.

Contraindicaciones: antecedentes de alergia a alguno de los componentes del producto. Úlcera gastrointestinal activa. Insuficiencia hepática y/o renal severa. Pacientes con antecedentes de asma, rinitis o urticaria desencadenados por ácido acetilsalicílico u otras drogas antiinflamatorias no esteroideas. Embarazo y lactancia.

Advertencias

Efectos gastrointestinales: puede presentarse toxicidad gastrointestinal grave como sangrado, ulceración, y perforación con o sin síntomas de alarma en cualquier momento de la terapia. El médico debe informar al paciente sobre signos y síntomas de toxicidad grave y que conducta tomar en estos casos.

Efectos hepáticos: pueden presentarse alteraciones de los tests de función hepática durante el tratamiento con diclofenac. Estas alteraciones pueden progresar, permanecer estables, o ser transitorias con el tratamiento continuo. Se recomienda para el seguimiento el monitoreo periódico de la TGP.

Excepcionalmente se han descrito reacciones hepáticas severas, incluyendo necrosis hepática, ictericia, y hepatitis fulminante.

Reacciones anafilactoides: los pacientes con antecedentes de hipersensibilidad a la aspirina pueden experimentar rinitis o episodios de broncoespasmo potencialmente fatales luego de la toma de la medicación.

Insuficiencia renal: el tratamiento con diclofenac puede precipitar insuficiencia renal aguda en pacientes con enfermedad renal previa.

Embarazo: en el último trimestre del embarazo, al igual que otros DAINE, el diclofenac puede producir cierre prematuro del conducto arterioso.

Precauciones

Retención hidrosalina y edemas: debe usarse con precaución en pacientes con antecedentes de insuficiencia cardíaca, hipertensión, u otras condiciones que favorezcan la retención hídrica.

Efectos hematológicos: se ha visto en algunos casos la presencia de anemia, probablemente debida a retención hídrica, pérdidas gastrointestinales, o a efectos sobre la eritropoyesis. Se recomienda en los pacientes con tratamiento prolongado con diclofenac la medición del hematócrito y la hemoglobina en forma periódica.

Efectos renales: en pacientes tratados con AINEs se han descrito casos aislados de necrosis papilar y nefritis intersticial. Una segunda forma de toxicidad renal, generalmente asociada a AINEs, se observa en pacientes con condiciones que produzcan reducción del volumen sanguíneo o del flujo renal donde las prostaglandinas tienen un rol primordial en el mantenimiento de la perfusión renal. En estos pacientes la administración de estas drogas puede producir falla renal aguda. La suspensión del tratamiento, en estos casos, produce la recuperación generalmente completa de la función renal a niveles pretratamiento.

2

Dado que los metabolitos del diclofenac son eliminados principalmente a través del riñón, los pacientes con insuficiencia renal deben ser vigilados en forma más estrecha que aquellos con función renal normal.

Porfiria: el uso de este producto debe evitarse en pacientes con porfiria hepática.

Meningitis aséptica: los DAINEs en general pueden desencadenar, en raras ocasiones, meningitis aséptica con fiebre y coma especialmente en pacientes con antecedentes de lupus eritematoso y otras enfermedades de tejido conectivo.

Asma previo: el diclofenac no debe administrarse a pacientes con antecedentes de broncoespasmo desencadenado por aspirina. Debe tenerse en cuenta que hasta un 10% de los asmáticos pueden presentar asma sensible a la aspirina.

Otras precauciones: se han reportado visión borrosa, disminución de la agudeza visual, alteración de la visión cromática y aparición de escotomas. Ante estos síntomas debe suspenderse el tratamiento y el paciente debe someterse a un examen oftalmológico.

Interacciones medicamentosas

- Aspirina: la administración simultánea de aspirina junto al diclofenac produce desplazamiento de éste último de sus sitios de unión produciéndose bajas concentraciones plasmáticas y descenso de los niveles plasmáticos pico.

- Anticoagulantes: si bien los estudios no han demostrado interacción entre diclofenac y anticoagulantes orales del tipo de la warfarina, su administración concomitante debe realizarse con precaución debido a las interacciones descritas para otras drogas antiinflamatorias no esteroideas. La terapia con diclofenac altera la función plaquetaria y el papel de las prostaglandinas en la hemostasia, por lo cual la administración simultánea de estas droga y aspirina requiere un cuidadoso seguimiento del paciente.

- Digoxina, metrotexate, ciclosporina: el tratamiento con diclofenac puede incrementar las concentraciones plasmáticas de digoxina y metrotexate y aumentar la nefrotoxicidad de la ciclosporina.

- Lítio: en pacientes medicados con diclofenac y lítio las concentraciones plasmáticas de este último pueden elevarse. En estos casos debe vigilarse, entonces, el desarrollo de toxicidad por lítio.

- Hipoglucemiantes orales: se han reportado cambios en el efecto de la insulina o de los hipoglucemiantes orales en presencia de tratamiento simultáneo con diclofenac. Se han detectado efectos hipoglucemiantes e hiperglucemiantes.

- Diuréticos: el diclofenac puede disminuir la actividad de los diuréticos. La administración concomitante de diclofenac y diuréticos ahorradores de potasio pueden elevar los niveles plasmáticos de este último ión.

- Interacciones entre las drogas y pruebas de laboratorio: el diclofenac aumenta el tiempo de agregación plaquetaria pero no afecta el tiempo de sangrado, el tiempo de trombina, el fibrinógeno plasmático ni los niveles de factor V, VII y XII. Se han observado cambios estadísticamente significativos del tiempo de protrombina y del tiempo parcial de tromboplastina en voluntarios sanos. Estos cambios probablemente no tengan significancia clínica.

Carcinogénesis, mutagénesis y trastornos de la fertilidad: en diversos estudios animales no se han descrito este tipo de efectos.

Embarazo y Lactancia: BLOKIUUM FLEX no debe ser administrado durante el embarazo, especialmente en el último trimestre, debido al riesgo de cierre prematuro del conducto arterioso. Tampoco debe administrarse durante la lactancia ante el riesgo potencial de efectos adversos en el lactante.

Uso en pediatría: la seguridad y eficacia del producto no ha sido establecida.

Reacciones Adversas

Con el diclofenac se han descrito los siguientes efectos adversos:

Gastrointestinales: diarrea, náuseas, constipación, meteorismo, anomalidades en los tests de función hepática, úlcera péptica con o sin sangrado y/o perforación, gastritis erosiva. Necrosis hepática, ictericia, síndrome hepatorenal.

Sistema nervioso: somnolencia, depresión, ansiedad, irritabilidad, meningitis aséptica, convulsiones.

3