Diclogesic Relax®

Diclofenac sódico 50 mg + Prídinol mesilato 4 mg

Comprimidos recubiertos

VENTA BAJO RECETA - INDUSTRIA ARGENTINA

COMPOSICIÓN:
Cada comprimido recubierto contiene: Diclofenac sódico 50 mg, Mesilato de prídinol 4 mg, excipientes c.s.

ACCIÓN TERAPÉUTICA.
Antiinflamatorio. Analgésico. Miorrelajante.

INDICACIONES.
Diclogesic Relax® está indicado en el tratamiento de lumbagos, lumbociatalgias, torticolis, discopatías, periartritis de hombro, cervicobraquialgias, esguinces, contracturas, desgarros.

CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS/PROPIEDADES.
ACCIÓN FARMACOLÓGICA.
El Diclofenac es un antiinflamatorio no esteroideo (AINE) que actúa inhibiendo la síntesis de prostaglandinas: estas desempeñan una acción importante en el mecanismo de la inflamación, dolor y fiebre, la hiperalgesia producida por gérmenes y la agregación plaquetaria. La inhibición de la síntesis de prostaglandinas le otorga actividad antiinflamatoria, y contribuye en su eficacia de aliviar el dolor relacionado con la inflamación. En relación a su efecto analgésico, el Diclofenac no es un narcótico.
El prídinol 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.
En condiciones de ayuno, el Diclofenac se absorbe completamente en el tracto gastrointestinal; sin embargo, y debido al metabolismo hepático de primer paso, sólo un 50 % de la dosis absorbida se encuentra sistémicamente disponible.
La concentración plasmática de Diclofenac posee una vida media de aproximadamente 2 horas. El clearance y el volumen de distribución son de alrededor de 350 mL/min y 550 mL/kg, respectivamente. Más del 99 % del Diclofenac está unido reversiblemente a la albúmina plasmática. Como ocurre con otros antiinflamatorios no esteroides (AINEs), el Diclofenac difunde dentro y fuera del líquido sinovial; la difusión en la articulación ocurre cuando la concentración en el plasma es más elevada que en el líquido sinovial, después de la cual, el proceso se invierte y la concentración en el fluido sinovial es mayor a la del plasma.
El Diclofenac es metabolizado y subsecuentemente excretado por orina y bilis como sus metabolitos conjugados con ácido glucurónico y ácido sulfúrico. Aproximadamente el 65 % de la dosis es excretada por orina y el 35 % por la bilis. Los conjugados del Diclofenac sin metabolizar casi se excretan por orina y por bilis son alrededor de un 5 - 10 % y menos de 5 %, respectivamente. Muy pequeña cantidad de la droga es excretada sin metabolizar y/o conjugar. Los conjugados del metabolito principal son en 20 - 30 % de la dosis excretada en orina y 10 - 20 % de la dosis excretada en la bilis. Los conjugados de los restantes tres metabolitos juntos suman alrededor de un 10 - 20 % de la dosis excretada en orina y pequeñas cantidades excretadas por bilis. La vida media de eliminación para estos metabolitos es más corta que la de la droga. La excreción urinaria de un metabolito adicional (de vida media 80 horas) suma sólo un 1 & % de la dosis oral. El grado de acumulación de los metabolitos del Diclofenac es desconocido. Algunos metabolitos pueden tener actividad.
En estudio de cuatro semanas comparando perfiles de nivel plasmático de Diclofenac en una población de adultos jóvenes (26-46 años) contra adultos mayores (66-81 años) no demostró diferencias entre los grupos de edad.
Un estudio de cinco días, en el que se comparó la cinética del Diclofenac en pacientes con osteoartritis mayores de 65 años comparados con pacientes de esa edad, no demostró ningún cambio significativo entre los dos grupos con respecto a concentración máxima (Cmáx), tiempo máximo (Tmáx), o área bajo la Curva (ABC).
Hasta la fecha, no se han detectado diferencias en la farmacocinética del Diclofenac en los estudios realizados en pacientes con insuficiencia renal (50 mg Diclofenac intravenoso) e hepática (100 mg Diclofenac: solución oral). En pacientes con insuficiencia renal (NÍ), clearance de creatinina 3 - 42 mL/min), los valores de AUC y los valores de eliminación eran comparables a los mismos en individuos sanos. En pacientes con cirrosis confirmada por biopsia o hepatitis activa crónica (transaminasas elevadas variables y ó/ninguna hipertensión portal), los valores farmacocinéticos del Diclofenac y los valores urinarios de la eliminación del fármaco eran comparables a los mismos en individuos sanos.
El Prídinol se absorbe en el tracto gastrointestinal alcanzando una concentración pico-plasmática una hora después de su administración. El 30-40% de la dosis se encuentra en bilis y en otras tejidos, especialmente hígado y riñón. La eliminación urinaria se produce en forma de droga no conjugada en un 9% y en porcentaje similar como su conjugado glucurónido.

POSOLOGÍA, DOSIFICACIÓN Y MODO DE ADMINISTRACIÓN.
La dosis recomendada es de 1 comprimido recubierto cada 12 horas, preferentemente después de las comidas. Dosis máxima: 2 Comprimidos por día

CONTRAINDICACIONES.
Úlcera gastroduodenal. Hipersensibilidad conocida al Diclofenac. Hipersensibilidad conocida al Prídinol. Al igual que otros agentes antiinflamatorios no esteroides, Diclogesic Relax® está contraindicado en pacientes a quienes el ácido acetilsalicílico y otros agentes inhibidores de la prostaglandina sintetasa desencadenan ataques de asma, urticaria o rinitis aguda.
Al igual que otros antiinflamatorios, no se aconseja el uso de Diclogesic Relax® en embarazo hasta tanto estudios completos garantizan la inocuidad sobre tal estado. El Diclofenac se excreta en parte con la leche materna, por lo que no se recomienda su utilización durante la lactancia.
No se recomienda el uso de Diclogesic Relax® en niños menores de 14 años por no determinar su utilidad y dosificación en pediatría.

ADVERTENCIAS.
Efectos Gastrointestinales: Se han reportado casos de úlcera péptica y sangrado gastrointestinal en pacientes que recibieron Diclofenac. Por esta razón, tanto los médicos como los pacientes deben estar alertas ante ulceraciones y sangrados en aquellos pacientes que son tratados en forma crónica con Diclofenac a pesar de ausencia de síntomas gastrointestinales, de observarse eventos que los pacientes se mantengan en la menor dosis posible de Diclofenac, en tanto y en cuanto controle ello otorgan una respuesta terapéutica satisfactoria.
Riesgo de Ulceraciones Gastrointestinales, Sangrado y Perforación durante la terapia con AINEs: Series lesiones gastrointestinales como sangrado, ulceración y perforación pueden ocurrir en cualquier momento, con o sin síntomas, en los pacientes tratados de forma crónica con AINEs. Aunque los problemas en el tracto gastrointestinal superior, como la dispepsia, al principio de la terapia son comunes y pueden ser considerados de menor importancia, el médico debe estar alerta ante ulceraciones y sangrados en los pacientes tratados en forma crónica con AINEs, hasta en aquellos que no hayan presentado síntomas en el tracto gastrointestinal con anterioridad. En pacientes que se observan ulceras gastrointestinales o sangrado durante el curso de la terapia, se debe suspender la droga hasta que se haya descartado la posibilidad de que la ulcera o sangrado se produzcan en el 1% de los pacientes tratados durante 1 año. Los médicos deben informar a los pacientes sobre los signos y síntomas de una lesión seria sobre el tracto gastrointestinal para que puedan detectar aquellos que significan entre los dos grupos con respecto a concentración máxima (Cmáx), tiempo máximo (Tmáx), o área bajo la Curva (ABC).
Hasta la fecha, no se han detectado diferencias en la farmacocinética del Diclofenac en los estudios realizados en pacientes con insuficiencia renal (50 mg Diclofenac intravenoso) e hepática (100 mg Diclofenac: solución oral). En pacientes con insuficiencia renal (NÍ), clearance de creatinina 3 - 42 mL/min), los valores de AUC y los valores de eliminación eran comparables a los mismos en individuos sanos. En pacientes con cirrosis confirmada por biopsia o hepatitis activa crónica (transaminasas elevadas variables y ó/ninguna hipertensión portal), los valores farmacocinéticos del Diclofenac y los valores urinarios de la eliminación del fármaco eran comparables a los mismos en individuos sanos.
El Prídinol se absorbe en el tracto gastrointestinal alcanzando una concentración pico-plasmática una hora después de su administración. El 30-40% de la dosis se encuentra en bilis y en otros