# *diclofenaco potássico*

**Medicamento genérico Lei nº 9.787, de 1999**

***50mg***

***Comprimidos revestidos***

**USO ORAL**
**USO ADULTO**

## FORMA FARMACÊUTICA E APRESENTAÇÃO

**Comprimidos Revestidos.** Caixa com 20 comprimidos revestidos.

## COMPOSIÇÃO

Cada comprimido revestido contém:
diclofenaco potássico ..... 50 mg
excipientes: amido, celulose, copolímero de dimetilaminoetilmetacrilato, óxido de ferro vermelho, croscarmelose sódica, dióxido de silício coloidal, dióxido de titânio, estearato de magnésio, fosfato de cálcio dibásico, manitol, macrogol, talco, água deionizada, acetona e álcool isopropílico.

## INFORMAÇÕES AO PACIENTE

**Ação esperada do medicamento:** O diclofenaco potássico é utilizado no tratamento da dor e inflamação.

**Cuidados de armazenamento:** Conservar o medicamento em temperatura ambiente (entre 15ºC e 30ºC) e proteger da umidade.

**Prazo de validade:** Desde que sejam observados os cuidados de armazenamento diclofenaco potássico apresenta prazo de validade de 24 meses a partir da data de fabricação. Não utilize o medicamento após o vencimento do prazo de validade.

**Gravidez e lactação:** Informe ao seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término. Informar ao médico se está amamentando.

**Cuidados de administração:** Os comprimidos revestidos devem ser ingeridos com um pouco de líquido, de preferência antes das refeições. Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

**Interrupção do tratamento:** Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

**Reações adversas:** Informe seu médico o aparecimento de reações desagradáveis, como náuseas, diarréia, dor de estômago, dor de cabeça, tontura e vermelhidão da pele ou qualquer outra que porventura possa ocorrer.

**TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.**

**Ingestão concomitante com outras substâncias:** A ingestão de antiinflamatórios com álcool, aumenta o potencial de irritação gástrica. Desta forma, recomenda-se não ingerir álcool durante o tratamento.

**Contra-indicações e precauções:** Informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início ou durante o tratamento. Antes de iniciar o tratamento com diclofenaco potássico, informe ao seu médico se tem problemas de estômago e de intestino, suspeita de úlcera, doença do fígado, de rim ou de coração. O diclofenaco potássico é contra-indicado para pacientes com úlcera gástrica e intestinal, alergia ao diclofenaco e para pacientes que têm crises de asma, urticária e rinite aguda quando tomam ácido acetilsalicílico (ex.: aspirina). Pacientes que apresentarem vertigens durante o uso do medicamento deverão evitar operar máquinas e dirigir veículos. Devem ser feitos exames de sangue durante tratamentos longos.

**Não é indicado para crianças abaixo de 14 anos. Com exceção de casos de artrite juvenil crônica.**

**NÃO TOME REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO. PODE SER PERIGOSO PARA A SAÚDE.**

## INFORMAÇÕES TÉCNICAS

**Farmacodinâmica:**
*Grupo farmacoterapêutico:*
Antiinflamatório não-esteróide (AINE).
*Mecanismo de ação:*
O diclofenaco é um composto não-esteróide com acentuadas propriedades analgésica, antiinflamatória e antipirética.
O diclofenaco possui um rápido início de ação, o que o torna particularmente adequado para o tratamento de estados dolorosos e/ou inflamatórios agudos. A inibição da biossíntese das prostaglandinas, demonstrada experimentalmente, é considerada fundamental no mecanismo de ação do diclofenaco. As prostaglandinas desempenham papel importante na gênese da inflamação, dor e febre.
O diclofenaco *in vitro*, nas concentrações equivalentes àquelas alcançadas no homem, não suprime a biossíntese de proteoglicanos nas cartilagens.
*Efeitos farmacodinâmicos:*
Por meio de ensaios clínicos foi possível demonstrar que o diclofenaco exerce pronunciado efeito analgésico em estados moderados ou severamente dolorosos. Na presença de inflamação devida, por exemplo, a trauma ou após intervenção cirúrgica, o diclofenaco alivia rapidamente tanto a dor espontânea quanto a relacionada ao movimento e diminui o inchaço inflamatório e o edema do ferimento. Estudos clínicos também revelaram que na dismenorréia primária o diclofenaco é capaz de aliviar a dor e reduzir o sangramento.

**Farmacocinética:**
*Absorção:*
O diclofenaco é rápida e completamente absorvido a partir dos comprimidos revestidos. A absorção inicia-se imediatamente após a administração. O pico médio das concentrações plasmáticas de 3,8 mcmol/L são atingidos após 20-60 minutos após a ingestão de um comprimido revestido de 50 mg. A ingestão juntamente com alimentos não tem influência na quantidade de diclofenaco absorvido, embora o início e taxa de absorção possam ser ligeiramente retardadas.
*Distribuição:*
99,7% do diclofenaco liga-se a proteínas séricas, predominantemente à albumina (99,4%).
O volume de distribuição aparente calculado é de 0,12 - 0,17 L/kg.
O diclofenaco penetra no fluido sinovial, onde as concentrações máximas são medidas de 2 - 4 horas após serem atingidos os valores de pico plasmático. A meia-vida aparente para eliminação do fluido sinovial é de 3 - 6 horas. Duas horas após atingidos os valores de pico plasmático, as concentrações da substância ativa já são mais altas no fluido sinovial que no plasma, permanecendo mais altas por até 12 horas.
*Biotransformação:*
A biotransformação do diclofenaco ocorre parcialmente por glicuronidação da molécula intacta, mas principalmente por hidroxilação e metoxilação simples e múltipla, resultando em vários metabólitos fenólicos (3'-hidroxi-, 4'-hidroxi-, 5-hidroxi-, 4',5-hidroxi- e 3'-hidroxi-4'-metoxi-diclofenaco), a maioria dos quais são convertidos aos conjugados glicurônicos. Dois desses metabólitos fenólicos são biologicamente ativos, mas em extensão muito menor que o diclofenaco.
*Eliminação:*
O *clearance* (depuração) sistêmico total do diclofenaco do plasma é de 263 ± 56 mL/min (valor médio ± DP). A meia-vida terminal no plasma é de 1 - 2 horas. Quatro dos metabólitos, incluindo os dois ativos, também têm meia-vida plasmática curta de 1 - 3 horas. Um metabólito, 3'-hidroxi-4'-metoxi-diclofenaco, tem meia-vida plasmática maior. Entretanto, esse metabólito é virtualmente inativo.
Cerca de 60% da dose absorvida é excretada na urina como conjugado glicurônico da molécula intacta e como metabólitos, a maioria dos quais são também convertidos aos conjugados glicurônicos. Menos de 1% é excretado como substância inalterada. O restante da dose é eliminada como metabólitos através da bile nas fezes.
*Características em pacientes:*
Não foram observadas diferenças idade-dependentes relevantes na absorção, metabolismo ou excreção do fármaco.
Em pacientes com insuficiência renal, não se pode inferir, a partir da cinética de dose-única, o acúmulo da substância ativa inalterada, quando se aplica o esquema normal de dose. A um *clearance* de creatina < 10 mL/min, os níveis plasmáticos de *steady-state* (estado de equilíbrio) calculados dos hidroxi metabólitos são cerca de 4 vezes maiores que em indivíduos normais. Entretanto, os metabólitos são ao final excretados através da bile.
Em pacientes com hepatite crônica ou cirrose não-descompensada, a cinética e metabolismo do diclofenaco é a mesma de pacientes sem doença hepática.

**Experiência pré-clínica:**
*Mutagenicidade, carcinogenicidade e toxicidade sobre a reprodução:*
O diclofenaco não influencia a fertilidade das matrizes (ratos) nem o desenvolvimento pré- peri- e pós-natal da prole. Não foram detectados efeitos teratogênicos em camundongos, ratos e coelhos. Não foram demonstrados efeitos mutagênicos em vários experimentos *in vitro* e *in vivo*, e nenhum potencial carcinogênico foi detectado em estudos de longo prazo em ratos e camundongos.

## INDICAÇÕES

Tratamento de curto prazo das seguintes condições agudas:
- estados dolorosos inflamatórios pós-traumáticos como, por exemplo, os causados por entorses;
- dor e inflamação no pós-operatório como, por exemplo, após cirurgias ortopédicas ou odontológicas;
- condições dolorosas e/ou inflamatórias em ginecologia como, por exemplo, dismenorréia primária ou anexite;
- síndromes dolorosas da coluna vertebral;
- reumatismo não-articular na fase aguda;
- como adjuvante no tratamento de processos infecciosos acompanhados de dor e inflamação de ouvido, nariz ou garganta como, por exemplo, nas faringoamigdalites e otites, respeitando os princípios terapêuticos gerais de que a doença básica deve ser adequadamente tratada. Febre, isoladamente, não é uma indicação.

## CONTRA-INDICAÇÕES

Úlcera gástrica ou intestinal. Hipersensibilidade conhecida à substância ativa ou a qualquer outro componente da formulação.
Como outros agentes antiinflamatórios não-esteróides, o diclofenaco potássico também é contra-indicado em pacientes nos quais crises de asma, urticária ou rinite aguda são causadas pelo ácido acetilsalicílico ou por outros fármacos com atividade inibidora da prostaglandina-sintetase.
**Não é indicado para crianças abaixo de 14 anos. Com exceção de casos de artrite juvenil crônica.**

## PRECAUÇÕES

Supervisão médica rigorosa é imprescindível em pacientes com sintomas indicativos de distúrbios gastrointestinais ou histórico sugestivo de ulceração gástrica ou intestinal, em pacientes com cólica ulcerativa ou doença de Crohn e em pacientes com insuficiência hepática grave.
Do mesmo modo que com outros antiinflamatórios não-esteróides (AINEs), pode ocorrer elevação dos níveis de uma ou mais enzimas hepáticas com o uso de diclofenaco potássico. Durante tratamentos prolongados é recomendável a monitorização da função hepática como medida de precaução.
Na ocorrência de sinais ou sintomas indicativos do desenvolvimento de doença hepática, ou de outras manifestações (por exemplo, eosinofilia, erupções), ou se os testes anormais para a função hepática persistirem ou piorarem, o tratamento com diclofenaco potássico deverá ser descontinuado. Poderá ocorrer hepatite com ou sem sintomas prodrômicos.
Deve-se ter cautela ao administrar diclofenaco potássico a pacientes portadores de porfiria hepática, uma vez que o fármaco pode desencadear uma crise.
Devido à importância das prostaglandinas para manutenção do fluxo sangüíneo renal, deve ser dedicada atenção especial aos pacientes com deficiência da função cardíaca ou renal, pacientes idosos, pacientes sob tratamento com diuréticos e àqueles com depleção do volume extracelular de qualquer origem, por exemplo, nas condições de pré ou pós-operatório no caso de cirurgias de grande porte. Nestes casos, ao utilizar diclofenaco potássico, é recomendável a monitorização da função

renal como medida preventiva. A descontinuação do tratamento é seguida pela recuperação do estado de pré-tratamento.
O tratamento das afecções, para as quais diclofenaco potássico está indicado, dura usualmente poucos dias. Porém, se ao contrário das recomendações para seu uso, diclofenaco potássico for administrado por períodos prolongados, é aconselhável, como ocorre com outros antiinflamatórios não-esteróides, monitorizar o hemograma.
Assim como outros AINEs, o diclofenaco potássico pode inibir temporariamente a agregação plaquetária. Pacientes com distúrbios hemostáticos devem ser cuidadosamente monitorizados.
Recomenda-se cuidado em idosos sob cuidados médicos básicos. É recomendado, em especial, a pacientes idosos debilitados ou naqueles com baixo peso corpóreo a utilização da posologia eficaz mais baixa.
*Efeitos sobre a habilidade de dirigir veículos e/ou operar máquinas:*
Pacientes com sintomas de tontura ou outros distúrbios do sistema nervoso central, incluindo distúrbios da visão, não devem dirigir veículos ou operar máquinas.
*Gravidez e lactação:*
O diclofenaco potássico somente deve ser administrado durante a gravidez quando houver indicação formal e somente utilizando-se a menor posologia eficaz. Como outros inibidores da prostaglandina-sintetase, essa orientação aplica-se particularmente, aos três últimos meses de gestação (pela possibilidade de ocorrer inércia uterina e/ou fechamento prematuro do canal arterial).
Após doses orais de 50 mg, administradas a cada 8 horas, a substância ativa passa para o leite materno, todavia, em quantidades tão pequenas, que não se espera efeitos indesejáveis no lactente.

## ADVERTÊNCIAS

Sangramento ou ulcerações/perfurações gastrointestinais podem ocorrer a qualquer momento durante o tratamento, com ou sem sintomas de advertência ou história prévia. Estas, em geral, apresentam conseqüências mais sérias em pacientes idosos. Nesses raros casos, o medicamento deve ser descontinuado.
Assim como com outros antiinflamatórios não-esteróides (AINEs), reações alérgicas, incluindo reações anafiláticas/anafilactóides, poderão também ocorrer, em casos raros, sem a exposição prévia ao fármaco.
O diclofenaco potássico, assim como outros AINEs, pode mascarar os sinais e sintomas de infecção devido a suas propriedades farmacodinâmicas.
**A segurança e eficácia do diclofenaco - independente da formulação farmacêutica - não foi ainda estabelecida em crianças. Assim sendo, com exceção de caso de artrite juvenil crônica, o uso do diclofenaco não é recomendado em crianças de idade inferior a 14 anos.**

## INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

• *Lítio, digoxina:* o diclofenaco pode elevar as concentrações plasmáticas de lítio e digoxina.
• *Diuréticos:* assim como outros antiinflamatórios não-esteróides (AINEs), o diclofenaco pode inibir a atividade de diuréticos. O tratamento concomitante com diuréticos poupadores de potássio pode estar associado à elevação dos níveis séricos de potássio, os quais devem portanto ser monitorizados.
• *AINEs:* a administração concomitante de AINEs sistêmicos pode aumentar a freqüência de reações adversas.
• *Anticoagulantes:* embora as investigações clínicas não pareçam indicar que o diclofenaco apresente uma influência sobre o efeito dos anticoagulantes, existem relatos de uma elevação no risco de hemorragias com o uso combinado de diclofenaco e terapia anticoagulante. Nestes casos, conseqüentemente, é recomendável uma monitorização dos pacientes.
• *Antidiabéticos:* estudos clínicos demonstraram que o diclofenaco pode ser administrado juntamente com hipoglicemiantes orais sem influenciar seus efeitos clínicos. Entretanto, existem relatos isolados de efeitos hipo e hiperglicemiantes na presença de diclofenaco, determinando a necessidade de ajuste posológico dos agentes hipoglicemiantes.
• *Metotrexato:* deve-se tomar cuidado quando AINEs forem administrados menos de 24 horas antes ou após tratamento com metotrexato, uma vez que a concentração sérica deste fármaco pode se elevar aumentando assim a sua toxicidade.
• *Ciclosporina:* os efeitos dos AINEs sobre as prostaglandinas renais pode aumentar a nefrotoxicidade da ciclosporina.
• *Antibacterianos quinolônicos:* têm ocorrido relatos isolados de convulsões que podem estar associadas ao uso concomitante de quinolonas e AINEs.

## REAÇÕES ADVERSAS

As seguintes estimativas de freqüência foram aplicadas: freqüente > 10%, ocasional > 1% - 10%, rara > 0,001% - 1%, casos isolados < 0,001%.
• *Trato gastrointestinal*
Ocasional: epigastralgia, distúrbios gastrointestinais tais como náusea, vômito, diarréia, cólicas abdominais, dispepsia, flatulência, anorexia, irritação local. Raros: sangramento gastrointestinal (hematêmese, melena, diarréia sangüinolenta), úlcera gástrica ou intestinal com ou sem sangramento ou perfuração. Casos isolados: estomatite aftosa, glossite, lesões esofágicas, estenose intestinal diafragmática, distúrbios do baixo colo tais como colite hemorrágica não-específica e exacerbação de colite ulcerativa ou doença de Crohn; constipação, pancreatite.
• *Sistema nervoso central*
Ocasional: cefaléia, tontura ou vertigem. Casos raros: sonolência. Casos isolados: distúrbios da sensibilidade, incluindo parestesia, distúrbios da memória, insônia, irritabilidade, convulsões, depressão, ansiedade, pesadelos, tremores, reações psicóticas, meningite asséptica.
• *Órgãos Sensoriais*
Casos isolados: distúrbios da visão (visão borrada, diplopia), deficiência auditiva, tinitus, distúrbios do paladar.
• *Pele*
Ocasionalmente: *rash* ou erupções cutâneas. Casos raros: urticária. Casos isolados: eritroderma (dermatite esfoliativa), perda de cabelo, reação de fotossensibilidade, púrpura, incluindo púrpura alérgica, erupção bolhosa, eczema, eritema multiforme, síndrome de Stevens-Johnson, síndrome de Lyell (epidermólise tóxica aguda).
• *Sistema urogenital*
Raro: edema. Casos isolados: insuficiência renal aguda, distúrbios urinários tais como hematúria, proteinúria, nefrite intersticial, síndrome nefrótica, necrose papilar.
• *Fígado*
Ocasionalmente: elevação dos níveis séricos das enzimas aminotransferases. Casos raros: hepatite, com ou sem icterícia. Casos isolados: hepatite fulminante.
• *Sangue*
Casos isolados: trombocitopenia, leucopenia, anemia (hemolítica e aplástica), agranulocitose.
• *Hipersensibilidade*
Casos raros: reações de hipersensibilidade tais como asma, reações sistêmicas anafiláticas/anafilactóides, incluindo hipotensão. Casos isolados: vasculite, pneumonite.
• *Sistema Cardiovascular*
Casos isolados: palpitação, dores no peito, hipertensão, insuficiência cardíaca congestiva.

## POSOLOGIA

A dose inicial diária recomendada é de 100 a 150 mg. Em casos mais leves, bem como para pacientes acima de 14 anos de idade, 75 a 100 mg/dia são em geral suficientes. A dose diária prescrita deve ser fracionada em duas a três tomadas.
No tratamento da dismenorréia primária, a dose diária, que deve ser individualmente adaptada, é geralmente de 50 a 150 mg. Inicialmente devem ser administradas doses de 50 a 100 mg e, se necessário, estas doses devem ser elevadas no decorrer de vários ciclos menstruais até o máximo de 200 mg/dia. O tratamento deve iniciar-se aos primeiros sintomas e, dependendo da sintomatologia, continuar por alguns dias.
Os comprimidos revestidos devem ser ingeridos inteiros e com um pouco de líquido, de preferência antes das refeições.

## SUPERDOSE

O tratamento de intoxicações agudas com agentes antiinflamatórios não-esteróides (AINEs), consiste essencialmente em medidas sintomáticas e de suporte. Não há quadro clínico típico associado a superdose com diclofenaco.
As seguintes medidas terapêuticas podem ser tomadas em casos de superdose: tratamento sintomático e de suporte deve ser administrado em caso de complicações tais como hipotensão, insuficiência renal, convulsões, irritação gastrointestinal e depressão respiratória.
Medidas específicas tais como diurese forçada, diálise ou hemoperfusão provavelmente não ajudam na eliminação de AINEs devido a seu alto índice de ligação a proteínas e metabolismo extenso.

## USO EM IDOSOS

Não está bem estabelecido se pacientes idosos possuem um risco aumentado de uma séria toxicidade gastrointestinal durante o uso de antiinflamatórios não-esteróides (AINEs). Entretanto, a ulceração e/ou hemorragia induzida pelo uso de AINEs pode possivelmente causar conseqüências mais sérias em pacientes geriátricos do que em adultos jovens. Além disso, pacientes idosos possuem uma maior predisposição ao comprometimento da função renal, o que pode aumentar o risco de toxicidade renal e hepática durante o uso de AINEs, podendo requerer uma redução da dosagem para evitar o acúmulo do medicamento no organismo. Alguns médicos recomendam a pacientes geriátricos, especialmente com idade igual ou superior a 70 anos, a administração de metade da dose inicial recomendada para adultos. Os pacientes idosos devem receber um cuidadoso monitoramento durante o tratamento com AINEs para prevenir a ocorrência de efeitos indesejáveis.

**VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA**

MS - 1.1213.0282

Farmacêutico Responsável: Alberto Jorge Garcia Guimarães - CRF-SP nº 12.449

Nº de lote, data de fabricação e prazo de validade: vide cartucho.

Fabricado por: Medley S.A. Indústria Farmacêutica.
R. Macedo Costa, nº 55 - Campinas - SP
CNPJ nº 50.929.710/0001-79 - Indústria Brasileira

BiosintÉtica
*Cuidados pela vida*

BIOSINTÉTICA FARMACÊUTICA LTDA.
Av. das Nações Unidas, 22.428 - São Paulo - SP
CNPJ nº 53.162.095/0001-06 - Indústria Brasileira
**Biosintética Assistance: 0800-0151036**
**www.biosintetica.com.br**

BU0233