

Venta Bajo Receta

Industria Argentina

Fórmula

Cada ampolla contiene: Diclofenac sódico 75,00 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 destilada apirógena c.s.p. 3,00 ml.

Acción Terapéutica

Analgésico - Antiinflamatorio.

Indicaciones

Inyección intramuscular: tratamiento de las exacerbaciones de reumatismos inflamatorios o degenerativos (artritis reumatoidea, espondilitis anquilopoyética, espondilo artritis, síndromes dolorosos de columna vertebral, artritis gotosa aguda). Tratamiento de exacerbaciones de reumatismo extra-articular. Cólico renal y cólico biliar. Dolor postraumático y postoperatorio.

Infusión intravenosa: prevención y tratamiento del dolor postquirúrgico en pacientes hospitalizados.

Acción Farmacológica

BLOKIU[®] (Diclofenac sódico) es un antiinflamatorio no esteroideo (AINE) derivado del ácido bencenoacético. En estudios farmacológicos el diclofenac ha mostrado tener actividad antiinflamatoria, analgésica y antipirética.

Como con otros AINES su modo de acción no está completamente aclarado; la capacidad para inhibir la síntesis de prostaglandinas participa en su actividad farmacológica.

Farmacocinética

BLOKIU[®] (diclofenac sódico) se absorbe rápidamente luego de su administración intramuscular. No está sujeto al primer paso de metabolización hepático como las formulaciones orales. Más del 99% del diclofenac se une reversiblemente a la albúmina plasmática. Su vida media de eliminación es de 1 a 2 hs. El diclofenac es eliminado por metabolización hepática y subsecuentemente excretado por vía urinaria (65%) y biliar (35%) como metabolitos conjugados con sulfato o ácido glucurónico. El diclofenac penetra al líquido sinovial donde las concentraciones pueden persistir incluso cuando las concentraciones plasmáticas han caído. Diclofenac se ha detectado en la leche materna.

Posología y forma de administración

Adultos: las ampollas de **BLOKIU[®]** (diclofenac sódico) no deberán administrarse durante más de dos días seguidos; en caso necesario se deberá proseguir con BLOKIU comprimidos.

Inyección intramuscular: la dosificación habitual es de una ampolla de 75 mg por vía intraglútea profunda. Solo excepcionalmente pueden administrarse 2 inyecciones diarias con un intervalo entre ambas de varias horas y cambiando de nalga.

También se puede combinar una ampolla de 75 mg con **BLOKIU[®]** comprimidos hasta una dosis máxima de 150 mg al día. *Infusión intravenosa:* **BLOKIU[®]** ampollas no debe administrarse como inyección intravenosa en bolo. Previo a su infusión endovenosa la ampolla de **BLOKIU[®]** debe diluirse con solución salina al 0,9% o glucosada al 5% amortiguadas con bicarbonato de sodio según instrucciones. Para el tratamiento del dolor postoperatorio moderado o intenso, se infundirán 75 mg de manera continua en un período de 30' a 2 hs. En caso de ser necesario se puede repetir el tratamiento al cabo de unas horas,

pero sin superar la dosis máxima de 150 mg en 24 hs. Para la prevención del dolor postoperatorio se infundirá luego de la intervención quirúrgica una dosis de carga de 25 a 50 mg durante un período de 15' a 1 hora, seguido de una infusión continua de 5 mg por hora hasta una dosis máxima de 150 mg. *Instrucciones para su uso:* Según la duración prevista para la infusión, mezclar 100 a 500 ml de solución salina isotónica (solución de cloruro de sodio al 0,9%) o solución gluconada al 5% con una solución inyectable de bicarbonato de sodio (0,5 ml de sol. al 8,4% o 1 ml de sol. al 4,2% o un volumen correspondiente de una solución diferente); añadir a esta solución el contenido de una ampolla de **BLOKIU**M. Si la solución preparada presenta precipitados o cristales, no se utilizará para infusión. Solo debe emplearse una solución clara. Las infusiones intravenosas deben emplearse inmediatamente luego de prepararlas; no deben conservarse las soluciones para infundir.

Niños

No se recomienda el empleo de **BLOKIU**M ampollas en niños.

Incompatibilidades

Como norma general, la solución de **BLOKIU**M para inyectar no debería mezclarse con otras soluciones inyectables.

Las soluciones para infusión de cloruro de sodio al 0,9% o glucosada al 5% que no estén taponadas con bicarbonato sódico corren riesgo de sobresaturación con probable formación de cristales y precipitados.

Contraindicaciones

Hipersensibilidad a la sustancia activa o a los excipientes de **BLOKIU**M ampollas.

Gastritis aguda o úlcera gastroduodenal.

Al igual que otros antiinflamatorios no esteroideos **BLOKIU**M (Diclofenac sódico) está contraindicado en asmáticos que han padecido un ataque de asma, urticaria o rinitis aguda por la administración de ácido acetilsalicílico y otros medicamentos que inhiben la síntesis de prostaglandinas. Tercer trimestre del embarazo.

Advertencias

Como sucede con otros AINES en cualquier momento del tratamiento puede producirse una hemorragia gastrointestinal o una perforación ulcerosa, con o sin síntomas o antecedentes previos.

Esto es más probable en sujetos añosos, en los que puede ser más grave. En caso de ocurrir sangrado gastrointestinal, se debe suspender el **BLOKIU**M.

Como sucede con otros AINES, en raras ocasiones **BLOKIU**M puede provocar reacciones alérgicas severas de tipo anafiláctico/anafilactoide.

Eventos trombóticos aparato cardiovascular

Estudios clínicos con varios AINES COX-2 selectivos y no selectivos, de hasta tres años de duración, han demostrado un incremento de eventos trombóticos serios cardiovasculares (CV), incluyendo infarto de miocardio (IM) y accidente cerebrovascular (ACV), que pueden ser fatales. De acuerdo a los datos disponibles, no es claro si el riesgo de estos eventos trombóticos CV es similar para todos los AINES. El incremento relativo de eventos trombóticos CV serios parece ser similar en aquellos pacientes con y sin enfermedad CV conocida o factores de riesgo para enfermedad CV. Sin embargo, los pacientes con enfermedad CV conocida o con factores de riesgo tienen una incidencia absoluta mayor de eventos CV trombóticos serios debido al incremento del nivel basal. Algunos estudios observacionales encuentran que este incremento del riesgo comienza tan temprano como en las primeras semanas de tratamiento. El incremento del riesgo trombótico CV ha sido observado más consistentemente con el empleo de dosis altas.

Para minimizar el riesgo, debe usarse la menor dosis efectiva posible de AINES por el menor tiempo. Tanto médicos como pacientes deben permanecer alertas por el desarrollo de eventos trombóticos durante todo el curso del tratamiento aún en la ausencia de síntomas CV previos.

No hay evidencia consistente que el uso concurrente de la aspirina con AINES mitigue el incremento de eventos trombóticos serios CV. El uso concurrente de aspirina incrementa el riesgo de eventos gastrointestinales (GI) serios.

Dos ensayos clínicos controlados de AINES COX-2 selectivos para el tratamiento del dolor en los primeros diez a catorce días siguientes a una cirugía de by-pass coronario encontraron un incremento del IM y del AVC. Los AINES están contraindicados en el marco de una cirugía de by-pass coronario.

Estudios observacionales en pacientes post IM demostraron que el tratamiento con AINES en el período post IM aumentó el riesgo de re-infarto, muerte relacionada a eventos CV y mortalidad de todo tipo, que se inicia en la primera semana de tratamiento. En la misma COHORTE, la incidencia de muerte en el primer año post IM fue de 20 por 100 personas/año en los pacientes tratados con AINES, comparado a 12 por 100 personas/año en los pacientes no expuestos a AINES.

Evite el uso de diclofenac en aquellos pacientes con IM reciente a menos que los beneficios esperados superen el riesgo de un evento trombótico CV recurrente. Si lo usa, controle a los pacientes por eventuales signos de isquemia cardíaca.

Precauciones

- Debido a la importancia de las prostaglandinas en mantener la función renal en determinadas condiciones, **BLOKIU**M (Diclofenac sódico) debe emplearse con precaución en pacientes con función renal, cardíaca o hepática disminuida, en pacientes que han sido tratados con diuréticos en forma crónica y en pacientes sometidos recientemente a cirugía mayor o que presenten depleción importante del volumen extracelular.
- Debe administrarse bajo estricta vigilancia médica en pacientes con antecedentes de úlcera gastroduodenal, colitis ulcerosa o enfermedad de Crohn. También se tendrá precaución en pacientes con porfiria hepática ya que **BLOKIU**M puede desencadenar un ataque.
- Debe administrarse con precaución en pacientes de edad avanzada y emplear siempre en ellos la menor dosis que demuestre eficacia.
- Durante el tratamiento prolongado deben efectuarse controles periódicos hematológicos, de función renal y hepática.
- Como con otros AINES puede inhibir transitoriamente la agregación plaquetaria. Los pacientes con trastornos de hemostasis que reciben **BLOKIU**M deben ser controlados estrechamente.
- Debe administrarse con precaución en pacientes con asma bronquial, ya que puede exacerbar los síntomas de esta enfermedad.

Embarazo y lactancia

Por ser insuficiente los datos disponibles, no se recomienda la administración de **BLOKIU**M ampollas durante el embarazo y lactancia.

El empleo de AINES diferentes a la aspirina durante el embarazo aumenta el riesgo de aborto espontáneo, particularmente cuando el medicamento se toma cerca del momento de la concepción.

Todos los antiinflamatorios no esteroides, inclusive diclofenac y el ácido acetilsalicílico (aspirina), están contraindicados a partir del inicio del sexto mes de embarazo (más allá de las 24 semanas de amenorrea), independientemente de la duración del tratamiento y de la vía de administración (oral, inyectable, cutánea), ya que pueden ser tóxicos para el feto. En el 5^{to} mes de embarazo los AINES deben utilizarse sólo cuando sea necesario, a la dosis efectiva más baja y durante el menor tiempo posible.

Efectos adversos

Los efectos adversos de **BLOKIU**M son similares a los de otros AINES. Se caracterizan de acuerdo a su frecuencia de aparición: frecuentes > 10%, ocasionales > 1% y < 10%, raros < 1% y casos aislados.

Tracto gastrointestinal

Ocasionales: dolor epigástrico, otras molestias gastrointestinales como náuseas, vómitos, diarrea, distensión abdominal, etc. *Raros:* hemorragia digestiva, úlcera gástrica o intestinal con o sin hemorragia o perforación.

Sistema Nervioso Central

Ocasionales: cefaleas, mareo o vértigo. *Raros:* somnolencia.

Hígado

Ocasionales: aumento de transaminasas. *Raros:* hepatitis con o sin ictericia.

Piel

Ocasionales: eritemas y erupciones cutáneas. *Raros:* urticaria.

Casos aislados de síndrome de Steven Johnson, eritema multiforme, epidermólisis tóxica.

Riñón

Raros: edema, casos aislados de insuficiencia renal aguda y alteraciones en la orina (hematuria, proteinuria).

Sangre

Casos aislados de leucopenia, anemia hemolítica, agranulocitosis.

Aparato cardiovascular

Casos aislados de hipertensión arterial, insuficiencia cardiaca congestiva, palpitaciones.

Sentidos especiales

Ocasionales: tinnitus.

Efectos sobre la capacidad de conducir o manejar máquinas

Los pacientes que experimenten vértigo u otros trastornos del sistema nervioso central luego de la administración de **BLOKIU** no deberán conducir vehículos ni manejar maquinarias.

Interacciones medicamentosas

La administración simultánea de **BLOKIU** (Diclofenac sódico) con otros antiinflamatorios sistémicos no esteroideos puede favorecer la aparición de efectos adversos.

Los estudios clínicos no han demostrado que **BLOKIU** (Diclofenac sódico) influya sobre la acción de los anticoagulantes. A pesar de ello y por precaución, se recomienda controlar el efecto anticoagulante al administrar simultáneamente diclofenac con anticoagulantes.

Los ensayos clínicos han demostrado que **BLOKIU** (Diclofenac sódico) puede administrarse junto con antidiabéticos orales sin que influya sobre su efecto clínico.

BLOKIU (Diclofenac sódico) como otros antiinflamatorios no esteroideos puede inhibir el efecto de los diuréticos. También es posible que incremente la acción retentora de potasio de los diuréticos ahorradores de potasio, por lo que deben controlarse los valores séricos de este catión.

Debe tenerse precaución cuando se administre **BLOKIU** (Diclofenac sódico) 24 horas antes o después de un tratamiento con Metotrexato ya que puede elevar su nivel plasmático y aumentar su toxicidad.

La administración simultánea de **BLOKIU** (Diclofenac sódico) con sales de litio o digoxina puede elevar sus niveles plasmáticos, sin que se hayan producido signos de sobredosificación.

Sobredosificación

No se conoce el cuadro clínico típico asociado con la sobredosificación de diclofenac sódico. Las medidas terapéuticas a tomar en caso de sobredosis son las siguientes: tratamiento de apoyo y sintomático contra las complicaciones como hipotensión, insuficiencia renal, convulsiones, irritación gastrointestinal o depresión respiratoria.

Los tratamientos específicos como diuresis forzada, diálisis o hemoperfusión son probablemente poco útiles para eliminar AINE a causa de su elevada tasa de fijación a las proteínas del plasma y un metabolismo extensivo.

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 / 0800-444-8694.

Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777 / 0800-333-0160.
Centro de Asistencia Toxicológica La Plata: (0221) 451-5555.

Presentación

Injectable: envases con 3 ampollas.

Fecha de última revisión: Junio de 2018.

Esta especialidad medicinal está libre de gluten.



Forma de conservación

- Conservar en su envase original, en lugar fresco y seco preferentemente entre 15°C y 30°C.
- Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Alejandro D. Santarelli – Farmacéutico.

ESPECIALIDAD MEDICINAL AUTORIZADA POR EL MINISTERIO DE SALUD DE LA NACION.

Certificado N° 36.717

Laboratorios CASASCO S.A.I.C.

Av. Boyacá 237 - Ciudad Autónoma de Buenos Aires, Argentina.

Elaborado en: Estados Unidos N° 5105, Área de promoción El Triángulo, Partido de Malvinas Argentinas, Buenos Aires, Argentina.

 **CASASCO**