

Idolgina

Dexketoprofeno 25 mg



Baliaarda

Expendio bajo receta

Industria Argentina

Comprimidos recubiertos ranurados

FORMULA:

Cada comprimido recubierto ranurado contiene:

Dexketoprofeno (como trometamol) 25 mg.

Excipientes: celulosa microcristalina, almidón de maíz, almidón glicolato de sodio, hidroxipropilmetilcelulosa 5, talco, hidroxipropilmetilcelulosa 15, dióxido de titanio, polietilenglicol 6000, propilenglicol, povidona, c.s.p. 1 comprimido.

ACCION TERAPEUTICA:

Analgésico. Antiinflamatorio no esteroideo.

(Código ATC: M01AE17).

INDICACIONES:

Tratamiento sintomático del dolor de intensidad leve a moderada de diferentes etiologías (dismenorrea, odontalgia, intervenciones quirúrgicas, traumatismos, dolor musculoesquelético, y dolor asociado a procesos inflamatorios).

CARACTERISTICAS FARMACOLOGICAS /

PROPIEDADES:

ACCION FARMACOLOGICA

El dexketoprofeno trometamol es la sal de trometamina del ácido S-(+)-2-(3-benzilfenil) propiónico, un fármaco analgésico, antiinflamatorio y antipirético perteneciente a la familia de los antiinflamatorios no esteroideos.

Mecanismo de acción:

El mecanismo de acción de los antiinflamatorios no esteroideos se relaciona con la disminución de la síntesis de prostaglandinas mediante la inhibición de la vía de la ciclooxigenasa. Específicamente, se inhibe la transformación del ácido araquidónico en endoperóxidos cíclicos, las PGG₂ y PGH₂, que dan lugar a las prostaglandinas PGE₁, PGE₂, PGF_{2α} y PGD₂, y también a la prostaciclina PGI₂ y tromboxanos (TxA₂ y TxB₂). Además, la inhibición de la síntesis de las prostaglandinas podría tener efecto sobre otros mediadores de la inflamación como las kininas, ejerciendo una acción indirecta que se sumaría a su acción directa.

Se ha demostrado que el dexketoprofeno es un inhibidor de las actividades COX-1 y COX-2.

Estudios clínicos realizados sobre diversos modelos de dolor, comprobaron la actividad analgésica efectiva del dexketoprofeno. El inicio del efecto analgésico se obtuvo a los 30 minutos post-administración y persistió por 4 a 6 horas.

FARMACOCINETICA:

Absorción: luego de la administración oral de dexketoprofeno, la C_{max} se alcanza a los 30 minutos (rango entre 15 a 60 min) de la toma. En estudios farmacocinéticos realizados a dosis múltiple, se observó que el ABC de dexketoprofeno tras la última administración no difiere de la obtenida a dosis única, indicando por lo tanto que no se produce acumulación del fármaco.

Distribución: la vida media de distribución del dexketoprofeno es de 0,35 horas. Al igual que otros fármacos con elevada unión a proteínas plasmáticas (99%), su volumen de distribución tiene un valor medio inferior a 0,25 l/Kg.

Eliminación: la principal vía de eliminación para el dexketoprofeno es la glucuronación conjugada seguida de excreción renal. Tras la administración de dexketoprofeno, en orina sólo se obtiene el enantiómero S-(+), demostrando que no se produce conversión al enantiómero R(-). La vida media de eliminación del dexketoprofeno es de 1,65 horas.

Efecto de los alimentos: cuando se administra dexketoprofeno conjuntamente con alimentos, el ABC no se modifica, sin embargo la C_{max} se reduce y su velocidad de absorción se retrasa (incremento de t_{max}).

POSOLOGIA Y MODO DE ADMINISTRACION:

De acuerdo a la naturaleza y severidad del dolor, la dosis recomendada es generalmente de 25 mg cada 8 horas o de 12,5 mg cada 4 – 6 horas. La dosis total diaria no debe sobrepasar los 75 mg.

Se puede minimizar la aparición de reacciones adversas utilizando la dosis mínima efectiva durante el menor tiempo posible.

El producto no está destinado para su uso a largo plazo y el tratamiento debe limitarse al período sintomático.

Anianos: en pacientes anianos se recomienda iniciar el tratamiento con la dosis más baja, 50 mg/día. La dosis se puede incrementar hasta llegar a la recomendada para la población general, una vez comprobada la adecuada tolerabilidad del producto.

Insuficiencia hepática: en pacientes con insuficiencia hepática leve a moderada, el tratamiento se debe iniciar con dosis reducidas (dosis diaria total de 50 mg) y debe ser monitoreado cuidadosamente. El producto no se debe utilizar en pacientes con insuficiencia hepática severa (Véase CONTRAINDICACIONES).

Insuficiencia renal: en pacientes con insuficiencia renal leve (clearance de creatinina 50-80 ml/min) la dosis inicial se debe reducir a una dosis total diaria de 50 mg. El producto no se debe utilizar en pacientes con insuficiencia renal moderada o severa (clearance de creatinina < 50 ml/min).

Población pediátrica: la seguridad y eficacia no han sido establecidas en este grupo etario, por lo tanto no se debe emplear el producto en niños ni adolescentes.

Modo de administración:

El comprimido se debe tomar con suficiente cantidad de líquido (por ejemplo un vaso de agua) y preferentemente lejos de las comidas. En caso de dolor agudo se recomienda la administración del producto como mínimo 30 minutos antes de las comidas.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al dexketoprofeno, a cualquier otro AINE o a cualquiera de los componentes del producto. Pacientes en los cuales el uso de AINEs pueda provocar ataques de asma, broncoespasmo, rinitis aguda, o causar pólipos nasales, urticaria o edema angioneurótico. Pacientes que sufren reacciones fototóxicas o fotoalérgicas con el uso de ketoprofeno o fibratos. Pacientes con antecedente de hemorragia gastrointestinal o perforación relacionado a tratamientos previos con AINEs. Úlcera péptica/hemorragia gastrointestinal activa o recidivante, otras hemorragias activas u otros trastornos hemorrágicos. Pacientes con dispepsia crónica. Paciente con insuficiencia cardíaca severa. Pacientes con enfermedad de Crohn o colitis ulcerosa. Pacientes con insuficiencia renal moderada a severa (clearance de creatinina < 50 ml/min), pacientes con insuficiencia hepática severa. Pacientes con diátesis hemorrágica y otros trastornos de la coagulación. Pacientes con deshidratación severa, causada por vómitos, diarrea o por la ingesta de insuficiente cantidad de líquidos. Embarazo. Lactancia.

ADVERTENCIAS:

Se debe evitar la administración conjunta de dexketoprofeno con otros AINEs, incluyendo inhibidores selectivos de la ciclooxigenasa-2.

Tracto gastrointestinal: como con todos los AINEs, se han reportado hemorragias gastrointestinales, úlceras o perforaciones, incluyendo casos fatales, con o sin síntomas de aviso previo o antecedentes de eventos gastrointestinales severos. Por lo tanto, de ocurrir una hemorragia gastrointestinal o úlcera se deberá suspender el tratamiento con dexketoprofeno. El riesgo de hemorragia gastrointestinal, úlcera o perforación, en pacientes con antecedentes de úlcera, hemorragias o perforación, y en ancianos, es mayor cuando la dosis del AINE es elevada.

Antes de iniciar el tratamiento con dexketoprofeno, se debe revisar cualquier antecedente de esofagitis, gastritis y/o úlcera péptica, para asegurar su total curación. En los pacientes con síntomas gastrointestinales o antecedente de enfermedad gastrointestinal, se debe monitorear la aparición de trastornos gastrointestinales, especialmente hemorragia gastrointestinal.

En los pacientes que requieran el uso conjunto de ácido acetilsalicílico o de otros fármacos que puedan incrementar el riesgo gastrointestinal se deberá considerar una terapia combinada con agentes protectores, por ejemplo, misoprostol o inhibidores de la bomba de protones.

Los pacientes con antecedentes de toxicidad gastrointestinal, especialmente los ancianos, deberán comunicar cualquier síntoma abdominal inusual (especialmente hemorragia gastrointestinal),

principalmente al inicio del tratamiento.

En pacientes que reciban medicaciones concomitantes que puedan incrementar el riesgo de úlcera o hemorragia, tales como corticosteroides orales, anticoagulantes (como warfarina) inhibidores selectivos de la recaptación de serotonina o agentes antiagregantes (como el ácido acetilsalicílico) se aconseja administrar dexketoprofeno con precaución (véase PRECAUCIONES - Interacciones). **Renal:** la utilización de AINEs en pacientes con alteraciones de las funciones renales puede provocar un deterioro de la función renal, retención de líquidos y edema. En pacientes que reciben tratamiento con diuréticos o aquellos que puedan desarrollar hipovolemia, se debe administrar con precaución, ya que existe un mayor riesgo de nefrotoxicidad.

La administración adecuada de líquido durante el tratamiento con dexketoprofeno puede prevenir una deshidratación y posiblemente un incremento de la toxicidad renal asociada.

Los AINEs, incluyendo dexketoprofeno, pueden elevar los niveles plasmáticos de nitrógeno ureico y de creatinina. Al igual que otros inhibidores de la síntesis de las prostaglandinas, a dexketoprofeno se lo puede asociar con efectos indeseables del sistema renal que pueden dar lugar a nefritis glomerular, nefritis intersticial, necrosis papilar renal, síndrome nefrótico e insuficiencia renal aguda.

Hepático: los AINEs, incluyendo dexketoprofeno, pueden causar pequeños incrementos transitorios de algunos parámetros hepáticos así como incrementos significativos en AST y ALT. La terapia con dexketoprofeno debe ser discontinuada en casos de incrementos relevantes en tales parámetros.

Hipertensión arterial y/o fallo cardíaco y/o enfermedad cerebrovascular: estudios clínicos revelaron que el empleo de algunos AINEs (especialmente en dosis altas y en tratamientos de larga duración) está asociado a un pequeño aumento en el riesgo de eventos aterotrombóticos (por ejemplo infarto de miocardio o ictus). En el caso de dexketoprofeno la información para poder confirmar o excluir dicho riesgo es escasa. Se aconseja tener precaución en pacientes con antecedentes de cardiopatía, en particular, en pacientes con episodios previos de insuficiencia cardíaca debido a que existe un riesgo aumentado de desencadenar un fallo cardíaco.

Los pacientes con hipertensión, insuficiencia cardíaca congestiva, enfermedad coronaria establecida, arteriopatía periférica y/o enfermedad cerebrovascular no controlada, sólo deben recibir tratamiento con dexketoprofeno, si el médico considera necesario el uso de la droga. Esta misma consideración se debe realizar antes de iniciar un tratamiento de larga duración en pacientes con factores de riesgo cardiovascular conocidos (por ejemplo hipertensión, hiperlipidemia, diabetes mellitus, fumadores).

Reacciones cutáneas: en asociación con el uso de AINEs, se han reportado muy raramente reacciones cutáneas severas, algunas de ellas fatales, incluyendo dermatitis exfoliativa, síndrome de Stevens-Johnson y necrólisis epidérmica tóxica, principalmente al inicio del tratamiento. El producto se debe discontinuar en la primera aparición de rash cutáneo, lesiones de las mucosas o

cualquier otro signo de hipersensibilidad.

Pacientes con varicela: Se recomienda evitar la utilización de dextetoprofeno en caso de varicela, debido a que puede ser el origen de complicaciones serias de infecciones cutáneas y de los tejidos blandos.

El dextetoprofeno, como otros AINEs, puede enmascarar los síntomas de enfermedades infecciosas.

Fertilidad femenina: al igual que otros AINEs, el uso de dextetoprofeno puede disminuir la fertilidad femenina, por lo tanto, no se recomienda su uso en mujeres que deseen quedar embarazadas. En mujeres que presenten dificultades para concebir o que estén con estudios por infertilidad, se deberá considerar la discontinuación de dextetoprofeno.

PRECAUCIONES:

Administrar dextetoprofeno con precaución en las siguientes situaciones:

- pacientes con antecedentes alérgicos
- pacientes con trastorno congénito del metabolismo de la porfirina (por ejemplo porfiria aguda intermitente)
- deshidratación
- luego de una cirugía mayor
- pacientes con trastornos hematopoyéticos, lupus eritematoso o enfermedad mixta del tejido conectivo.

Capacidad para conducir y utilizar máquinas: el producto puede disminuir, de manera leve a moderada, la capacidad para conducir y utilizar maquinaria, debido a la posibilidad de aparición de vértigo o somnolencia.

Pacientes ancianos: los pacientes ancianos son más predispuestos a sufrir alteraciones en las funciones renal, hepática y cardiovascular.

Pacientes pediátricos: no se ha establecido la seguridad y eficacia en niños ni adolescentes, por lo tanto no se debe emplear el producto en esta población.

Embarazo: la inhibición de la síntesis de prostaglandinas puede afectar de forma adversa al embarazo y/o al desarrollo embrio-fetal. Estudios epidemiológicos sugieren un riesgo aumentado de aborto y de malformación cardíaca y gastroquiasis luego de utilizar inhibidores de la síntesis de prostaglandinas al principio del embarazo. El riesgo absoluto de malformaciones cardiovasculares se incrementa entre el 1-1,5% y se cree que el riesgo aumenta en función de la dosis y de la duración del tratamiento.

No se aconseja el uso de dextetoprofeno durante el embarazo (véase CONTRAINDICACIONES).

Lactancia: se desconoce si el dextetoprofeno se excreta en la leche humana. En consecuencia, se desaconseja su empleo en madres que amamantan.

Interacciones no recomendadas:

- **Otros AINEs:** la administración conjunta con otros AINEs, incluyendo elevadas dosis de salicilatos (≥ 3 g/día), puede potenciar el riesgo de úlceras y hemorragias gastrointestinales, debido a un efecto sinérgico.

- **Anticoagulantes:** como todos los AINEs, el dextetoprofeno puede aumentar los efectos de los anticoagulantes, como warfarina, debido a la elevada unión a proteínas plasmáticas, a la inhibición de la función plaquetaria y al daño de la mucosa gastroduodenal. Si la combinación no puede ser evitada, será necesario un estricto control clínico y el monitoreo de los valores de laboratorio del paciente.

Heparinas: existe un riesgo aumentado de hemorragia (debido a la inhibición de la función plaquetaria y al daño de la mucosa gastroduodenal). Si la combinación no puede ser evitada, será necesario un estricto control clínico y el monitoreo de los valores de laboratorio del paciente.

- **Corticosteroides:** existe un mayor riesgo de ulceración gastrointestinal o hemorragia.

- **Litio:** la administración conjunta con AINEs aumenta los niveles de litio en sangre, pudiendo alcanzar valores tóxicos (disminución de la excreción renal del litio). En consecuencia, se requiere el monitoreo de los niveles de litio en sangre, durante el inicio, el ajuste y la finalización del tratamiento con dextetoprofeno.

- **Metotrexato (a dosis elevadas de 15 mg/semana o más):** los AINEs disminuyen el clearance renal de metotrexato, incrementando su toxicidad hematológica.

- **Hidantoínas y sulfonamidas:** se pueden incrementar los efectos tóxicos de estas sustancias.

Interacciones que requieren precaución:

- **Diuréticos, inhibidores de la enzima de conversión de la angiotensina (IECA), antibióticos aminoglucósidos y antagonistas de los receptores de la angiotensina II (ARA II):** el dextetoprofeno puede reducir el efecto de los diuréticos y de las drogas antihipertensivas. En algunos pacientes con compromiso de la función renal (por ejemplo, pacientes deshidratados o ancianos con compromiso de la función renal), la administración conjunta de agentes que inhiben la ciclooxigenasa con IECAs o con antagonistas ARA II o con antibióticos aminoglucósidos puede agravar el deterioro, normalmente reversible, de la función renal. Si se combina dextetoprofeno y un diurético, se deberá asegurar la correcta hidratación del paciente y se debe monitorear la función renal al inicio del tratamiento.

- **Metotrexato (a dosis bajas, menos de 15 mg/semana):** los AINEs disminuyen el clearance renal de metotrexato, incrementando su toxicidad hematológica. Durante las primeras semanas de tratamiento conjunto, se debe monitorear semanalmente el recuento hematológico. Se debe incrementar la vigilancia, en presencia de la función renal levemente alterada, y en ancianos.

- **Pentoxifilina:** aumenta el riesgo de hemorragia. Se debe incrementar la vigilancia clínica y controlar con mayor frecuencia el tiempo de sangría.

- **Zidovudina:** luego de la primera semana de iniciado el tratamiento con el AINE, puede aumentar el riesgo de toxicidad de la línea celular roja por la acción sobre los reticulocitos, provocando anemia severa. Por lo tanto, se aconseja realizar un monitoreo del recuento sanguíneo completo y de reticulocitos, una o dos sema-

nas después del inicio del tratamiento con el AINE.

- **Sulfonilureas:** los AINEs pueden incrementar el efecto hipoglucemiante de las sulfonilureas por desplazamiento de los puntos de unión a proteínas plasmáticas.

Interacciones que deben ser tenidas en cuenta:

- **Beta-bloqueantes:** el tratamiento conjunto con AINEs puede disminuir el efecto antihipertensivo, vía inhibición de la síntesis de prostaglandinas.

- **Ciclosporina y tacrolimus:** el tratamiento conjunto con AINEs puede incrementar la nefrotoxicidad debido a los efectos mediados por las prostaglandinas renales. En estos casos se debe controlar la función renal.

- **Trombolíticos:** se incrementa el riesgo de hemorragia.

- **Antiagregantes plaquetarios e inhibidores selectivos de la recaptación de serotonina (ISRS):** se incrementa el riesgo de hemorragia gastrointestinal.

- **Probenecid:** se pueden incrementar las concentraciones plasmáticas de dextetoprofeno; esta interacción se puede deber a un mecanismo inhibitorio de la secreción en el túbulo renal y de la glucuroconjugación. Se requiere un ajuste de dosis del dextetoprofeno.

- **Glucósidos cardíacos:** el tratamiento conjunto con AINEs puede elevar los niveles plasmáticos de los glucósidos cardíacos.

- **Mifepristona:** los AINEs no deberían utilizarse en los 8-12 días posteriores a la administración de la mifepristona, debido al riesgo de que los inhibidores de la síntesis de prostaglandinas alteren su eficacia.

- **Quinolonas antibacterianas:** estudios en animales muestran que altas dosis de quinolonas administradas en combinación con AINEs, puede incrementar el riesgo de convulsiones.

REACCIONES ADVERSAS:

Las reacciones adversas más frecuentemente descritas entre el 1% y el 10% de los pacientes fueron: náuseas y/o vómitos, dolor abdominal, diarrea, dispepsia.

Otras reacciones adversas reportadas, ocasionalmente, incluyen: **Gastrointestinales:** gastritis, constipación, sequedad bucal, flatulencia, úlcera péptica hemorrágica o con perforación.

Vasculares: sofocos, hipertensión.

Cardíacas: palpitaciones.

Renales: insuficiencia renal aguda, poliuria.

Inmunológicas: edema de laringe.

Metabólicos y nutricionales: anorexia.

Psiquiátricas: insomnio, ansiedad.

Respiratorias: bradipnea.

Dermatológicas: rash, urticaria, acné, sudoración incrementada.

Musculoesqueléticas: dolor lumbar.

Genitourinario: alteraciones menstruales, alteraciones prostáticas.

Otros: fatiga, dolor, astenia, escalofríos, malestar general, edema periférico.

Neurológico: cefalea, mareo, somnolencia, parestesia, síncope, vértigo.

Hepatobiliares: hepatitis.

Laboratorio: test de la función hepática anormal.

SOBREDOSIFICACION:

No se han reportado casos de sobredosis, por lo que se desconoce la sintomatología asociada a la misma.

Medicamentos similares han producido trastornos gastrointestinales (vómitos, anorexia, dolor abdominal) y neurológicos (somnolencia, vértigo, desorientación, dolor de cefalea).

En caso de sobredosis o ingestión accidental, se debe proceder inmediatamente a la instauración de tratamiento sintomático en base a la condición clínica del paciente. Si un adulto o niño ingiere más de 5 mg/Kg de dextetoprofeno, se deberá administrar carbón activado en la primera hora posterior a la toma. El dextetoprofeno es dializable.

Ante la eventualidad de una sobredosificación concurrir al hospital más cercano o consultar a los centros toxicológicos del:

Hospital Posadas

(011) 4654-6648 / 4658-7777

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez

(011) 4962-2247 / 6666

PRESENTACION:

Envases con 20 y 40 comprimidos recubiertos ranurados.



Comprimidos redondos, color blanco, ranurados codificados en una cara con isotipo de identificación Baliarda.



CONDICIONES DE CONSERVACION:

Mantener a temperatura no superior a 30° C. Proteger de la humedad.

Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud.

Certificado N° 58.022

Director Técnico: Alejandro Herrmann, Farmacéutico.

Todo tratamiento exige un control periódico, debiendo consultarse al médico ante la menor duda o efecto indeseable del medicamento. Siguiendo los criterios de la OMS se aconseja no administrar medicamentos durante el primer trimestre del embarazo y aún durante todo el transcurso del mismo, excepto cuando sean indicados por el médico. Todo medicamento debe mantenerse fuera del alcance de los niños.

Última revisión: Julio de 2016.



Baliarda S.A.

Saavedra 1260/62 - Buenos Aires