

DICLOFENACO DIETILAMÔNIO

EMS S/A

Emulgel 1%

11,6 mg de diclofenaco dietilamônio

diclofenaco dietilamônio

“Medicamento genérico Lei nº 9.787, de 1999”

diclofenaco dietilamônio

Gel tópico. Bisnagas com 60 g.

USO TÓPICO

USO ADULTO E PEDIÁTRICO ACIMA DE 14 ANOS DE IDADE.

COMPOSIÇÃO:

Cada g do diclofenaco dietilamônio contém 11,6 mg de diclofenaco dietilamônio, equivalentes a 10,5 mg de diclofenaco potássico e 10,0 mg de diclofenaco sódico.

Excipientes: carbômer, dietilamina, propilenoglicol, petrolato líquido, oleato de decila, álcool cetosteárilico etoxilado, butil-hidroxitolueno, álcool isopropílico, essência melody e água purificada qsp,

INFORMAÇÕES TÉCNICAS AO PROFISSIONAL DE SAÚDE

1. INDICAÇÕES:

Alívio da dor, da inflamação e do inchaço em:

- Inflamações do tecido mole: de origem traumática dos tendões, ligamentos, músculos e articulações, por exemplo, devido à entorses, lesões, contusões, distensões, ou dores musculares (p.ex. torcicolo) e nas costas, bem como lesões oriundas de práticas esportivas^{1,2,3,4,5};
- Formas localizadas de reumatismos dos tecidos moles: Tendinite (por ex., cotovelo do tenista), bursite, síndrome do ombro e da mão, periartropatia^{3,4,6,7,8};
- Formas localizadas de reumatismo degenerativo: osteoartrose de articulações periféricas e coluna vertebral^{4,9,10,11,12,13,14,15}.

Para o alívio da dor de alguns tipos de artrites leves e localizadas (joelho e dedos).

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA:

O diclofenaco dietilamônio demonstrou eficácia no alívio da dor e inflamação, bem como melhora no tempo de retorno às atividades normais em:

- inflamações do tecido mole, p.ex. entorses, lesões e contusões ou dores nas costas (injúrias esportivas)¹
- reumatismos de tecido mole, p. ex. Tendinite, bursite²
- alívio da dor de artrite não séria nos joelhos e dedos^{3 a 4}

3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

Grupo farmacoterapêutico: medicamento tópico para dor nas articulações e dor muscular. Medicamento antiinflamatório tópico, não-esteroidal, para uso tópico. (ATC M02A A15).

O diclofenaco é um medicamento antiinflamatório não-esteroidal (AINE), com pronunciadas propriedades analgésica, antiinflamatória e antipirética. A inibição da síntese de prostaglandinas é o mecanismo de ação primário do diclofenaco.

O diclofenaco dietilamônio é um medicamento antiinflamatório e analgésico desenvolvido para uso tópico. Nas inflamações e dores de origem traumática ou reumática, O diclofenaco dietilamônio alivia a dor, reduz o inchaço e diminui o tempo para o retorno às funções normais. Devido à base aquosa-alcoólica, o gel também exerce um efeito suavizante e refrescante.

Os dados clínicos demonstraram que o diclofenaco dietilamônio reduz a dor aguda em uma hora após a aplicação inicial (p <0,0001 contra o gel placebo). Noventa e quatro por cento (94%) dos pacientes respondeu a O diclofenaco dietilamônio após 2 dias de tratamento versus 8% com gel placebo (p<0,0001). A resolução de dor e deficiência funcional foram alcançados após 4 dias de tratamento com o diclofenaco dietilamônio (p <0,0001 contra o gel placebo).

Absorção: a quantidade de diclofenaco absorvida sistemicamente a partir do diclofenaco dietilamônio é proporcional ao tamanho da área da pele tratada, e depende tanto da dose total aplicada como do grau de hidratação da pele. Foram determinadas quantidades de absorção em cerca de 6% da dose de diclofenaco após aplicação tópica de 2,5 g do diclofenaco dietilamônio em 500 cm² de pele, determinada pela eliminação renal total, comparada com do diclofenaco potássico comprimidos. Uma oclusão por um período de 10 horas leva a um aumento de três vezes na quantidade absorvida de diclofenaco.

Distribuição: as concentrações de diclofenaco foram medidas no plasma, no tecido sinovial e no fluido sinovial após administração tópica do diclofenaco dietilamônio nas articulações da mão e dos joelhos. As concentrações plasmáticas máximas são aproximadamente 100 vezes menores do que após a administração oral da mesma quantidade de diclofenaco: 99,7% do diclofenaco está ligado às proteínas séricas, principalmente à albumina (99,4%).

O diclofenaco acumula na pele, que atua como reservatório a partir do qual há uma libertação sustentada do ativo nos tecidos subjacentes. A partir daí, o diclofenaco, preferencialmente, distribui e persiste em profundas tecidos inflamados, tais como a articulação, onde ele se encontra em concentrações até 20 vezes mais elevado do que no plasma.

Metabolismo: a biotransformação do diclofenaco envolve parcialmente a glucuronidação da molécula intacta, mas principalmente a hidroxilação simples e múltipla que resulta em vários metabólitos fenólicos, a maior parte dos quais é convertida em conjugados glucuronídeos. Entretanto, dois dos metabólitos fenólicos são biologicamente ativos, em uma amplitude bem menor que a do diclofenaco.

Eliminação: o clearance sistêmico total do diclofenaco do plasma é 263 ± 56 ml/min. A meia-vida terminal plasmática é de 1-2 horas. Quatro dos metabólitos, incluindo os dois ativos, também têm meias-vidas plasmáticas curtas de 1-3 horas. Um dos metabólitos, o 3'-hidroxi-4'-metoxi-diclofenaco tem uma meia-vida maior, mas é virtualmente inativo. O diclofenaco e seus metabólitos são excretados principalmente pela urina.

Características em pacientes: não é esperado o acúmulo de diclofenaco e de seus metabólitos em pacientes que sofrem de insuficiência renal. Nos pacientes com hepatite crônica ou com cirrose não descompensada, a cinética e o metabolismo do diclofenaco são as mesmas que nos pacientes sem doença hepática.

Dados de segurança Pré-Clínicos:

Estudos pré-clínicos dos estudos de toxicidade de dose aguda e doses repetidas, bem como os estudos de genotoxicidade, mutagenicidade e carcinogenicidade com diclofenaco não revelaram nenhum risco específico para humanos, nas doses terapêuticas. Não há evidência de que o diclofenaco tenha potencial teratogênico em camundongos, ratos ou coelhos. Não há influência do diclofenaco sobre a fertilidade em ratos. O diclofenaco não influenciou a fertilidade das matrizes (ratos) nem o desenvolvimento pré, peri e pós-natal da prole.

Referência Bibliográfica

1. Diebschlag W. Diclofenac bei stumpf-traumatischen Sprunggelenkschwellungen. *Fortschr Med* 1986;104(21):437-40.
2. Commandre FA, Fornaris E, Chouchane A, Raybaud A, Zakarian H, Gaudinat R, et al. Traitement percutané par le Diclofénac en émulsion gel de la petite traumatologie et pathologie locomotrice du sport (contrôle téléthermographique). *LMM/ Médecine du Sud-est, Médecine du sport*, Février/Mars 1988;3-8.
3. El-Hadidi T, El-Garf A. Double-blind Study Comparing the Use of Voltaren Emulgel versus Regular Gel During Ultrasonic Sessions in the Treatment of Localized Traumatic and Rheumatic Painful Conditions. *J Int Med Res* 1991;19:219-27.
4. Mucha C. Perkutane Applikation von Diclofenac - eine multizentrische Studie aus Klinik und Praxis. *Medwelt* 1987;38:1206-09.
5. Schneider H. Lokaltherapie bei Sportverletzungen - Eine vergleichende Untersuchung von Voltaren Emulgel und einem Referenzpräparat. *Therapiewoche* 1986;36(28)(Sonderdruck):1-7.
6. Report FVOE02 (=NF112). Controlled study of Voltaren Emulgel 1% versus placebo in non-articular rheumatism. Laboratoires Ciba-Geigy Rueil-Malmaison 1986; 1-14 (plus Statistical Report with Appendices).
7. Schapira D, Linn S, Scharf Y. A placebo-controlled evaluation of diclofenac diethylamine salt in the treatment of lateral epicondylitis of the elbow. *Current Therapeutic Research* 1991;49(2):162-68.

Referências Adicionadas de BPI 28 de Abril de 1993

8. GP 45'840 G, Clinical Trial Report TO/PO 3/1984. Short-term (2 weeks), single-blind, between-patient, multi-centre trial comparing diclofenac ocaliz with Rheumon® Gel in extra-articular rheumatism. Ciba-Geigy Limited Basle 1984;1-24. (plus Appendix).
9. Clinical Trial Report TO/PM 1/1984. Diclofenac Emulgel, topical ocalizedtics, clinical trial report, open, multi-centre trial under practitioners' conditions in patients with localized rheumatic conditions. Ciba-Geigy Limited Basle 1984;1-40.
10. Huskisson EC. Report: Voltarol Emulgel as adjunct therapy in patients with osteoarthritis of the knee(s). St. Bartholomew's Hospital London 1985;1-7.
11. Manteuffel G-E von, Häringer E. Topische Darreichungsformen von nichtsteroidalen Antirheumatika zur Therapie von aktivierten Arthrosen. Eine Vergleichsstudie. *Rheuma* 1986;6:31-33.
12. Plaut GS. A new anti-rheumatic gel. *Scott Med J* 1990;10:16-18.
13. GP 45'840 Clinical Trial Report NGB 9091. Voltarol Emulgel in osteoarthritis of the knee. An

- investigator-blind multicentre general practice comparison of Voltarol Emulgel and piroxicam gel in the treatment of osteoarthritis of the knee. Ciba-Geigy Pharmaceuticals Horsham 1993;1-101.
14. Rau R, Höckel S. Piroxicam-Gel versus Diclofenac-Gel bei aktivierten Gonarthrosen. Fortschr Med 1989; 107(22):485-88.
15. Stoidner B, Stolle A, Schneider B. Lokalbehandlung degenerativer Wirbelsäulen-erkrankungen. Z Allg Med 1987;63:502-04.

4. CONTRAINDICAÇÕES:

Hipersensibilidade conhecida ao diclofenaco, ou à qualquer componente da formulação; hipersensibilidade ao ácido acetilsalicílico ou a outros medicamentos antiinflamatórios não esteroidais. O diclofenaco dietilamônio é também contra-indicado a pacientes nos quais crises de asma, urticária ou rinite aguda são desencadeadas por ácido acetilsalicílico, ou por outros medicamentos antiinflamatórios não esteroidais.

O diclofenaco dietilamônio é contra-indicado durante o último trimestre da gravidez.

O diclofenaco dietilamônio não é indicado para crianças abaixo de 14 anos, exceto nos casos de artrite juvenil crônica.

5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES:

A probabilidade de eventos adversos sistêmicos ocorrer com a aplicação tópica do diclofenaco dietilamônio é baixa, mas não deve ser excluída quando o diclofenaco dietilamônio for aplicado em áreas de pele relativamente extensas e por um período de tempo prolongado.

O diclofenaco dietilamônio deve ser aplicado somente sobre a pele intacta (ausência de feridas abertas ou escoriações). Evitar o contato do produto com os olhos e as mucosas. O diclofenaco dietilamônio não deve ser ingerido.

Embora faixas comumente utilizadas em lesões do tipo entorses possam até ser utilizadas, o diclofenaco dietilamônio não deve ser utilizado com bandagens oclusivas que não permitam a passagem de ar para a região da lesão.

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica, estando contra-indicado durante o último trimestre da gravidez.

A probabilidade de efeitos adversos sistêmicos com o uso do diclofenaco tópico é baixa, se comparada com a frequência observada em pacientes que utilizam diclofenaco por via oral. Entretanto, se o diclofenaco dietilamônio for aplicado em uma área relativamente extensa de pele, por um período de tempo prolongado, a possibilidade de efeitos adversos sistêmicos não pode ser descartada. No caso do uso do diclofenaco dietilamônio ser planejado desta maneira, solicita-se que as informações válidas para as formas sistêmicas de diclofenaco sejam prontamente consultadas.

Efeitos na habilidade de dirigir e/ou operar máquinas:

A aplicação tópica do diclofenaco dietilamônio não tem influência na habilidade de dirigir e/ou operar máquinas.

Uso em idosos, crianças e outros grupos de risco:

Idosos:

A dose usual de adultos pode ser usada por idosos.

Crianças:

A segurança e eficácia do diclofenaco, independente da formulação farmacêutica, não foi ainda estabelecida em crianças. Assim sendo, com exceção de casos de artrite juvenil crônica, o uso do diclofenaco não é recomendado em crianças de idade inferior a 14 anos.

Gravidez: O diclofenaco dietilamônio não deve ser utilizado durante a gravidez, especialmente durante o terceiro trimestre da gravidez. Nesse período, o uso de diclofenaco ou outros inibidores de prostaglandina-sintetase pode resultar em fechamento prematuro do ducto arterial ou em inércia uterina. Os estudos em animais não demonstraram qualquer efeito prejudicial direto ou indireto sobre a gravidez, no desenvolvimento embrionário / fetal, no parto ou no desenvolvimento pós-natal.

Lactação: Não são previstas quantidades mensuráveis da substância ativa no leite das lactantes.

Entretanto, o diclofenaco dietilamônio não deve ser aplicado a extensas áreas da pele, ou por período de tempo superior a uma semana.

6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Uma vez que a absorção sistêmica do diclofenaco a partir da aplicação tópica do gel é muito baixa, interações medicamentosas com o uso do diclofenaco dietilamônio são pouco prováveis.

7. CUIDADOS DE ARMAZENAGEM DO MEDICAMENTO

O diclofenaco dietilamônio deve ser mantido a temperatura ambiente (entre 15 e 30°C).

8. POSOLOGIA E MODO DE USAR:

O diclofenaco dietilamônio deve ser utilizado exclusivamente por via tópica.

Aplicar o diclofenaco dietilamônio sobre a região afetada, 3 a 4 vezes ao dia, massageando suavemente.

A quantidade necessária depende da extensão da área dolorida: 2 a 4 g do diclofenaco dietilamônio são suficientes para tratar uma área de cerca de 400-800 cm².

Após a aplicação, lavar as mãos, a menos que sejam o local tratado.

A duração do tratamento depende da indicação e da resposta clínica. O medicamento não deve ser usado por mais de 14 dias para inflamações do tecido mole ou reumatismos do tecido mole, ou por mais de 21 dias para artrite, a menos que recomendado pelo médico.

Quando utilizado sem prescrição médica, é recomendado que o paciente consulte um médico após 7 dias se os sintomas não melhorarem ou se houver piora.

9. REAÇÕES ADVERSAS

As reações adversas incluem reações da pele no local da aplicação, sendo leves e passageiras. Em caso muito raros, reações alérgicas podem ocorrer.

Reações da pele e tecido subcutâneo:

Comuns (> 0,01 < 0,1): dermatite de contato (ex.: rash localizado da pele, pruridos, eritema, edema ou pápulas).

Raras (> 0,0001 < 0,001): dermatite bulosa.

Muito raras (< 0,0001, incluindo relatos isolados): reações alérgicas da pele generalizadas, urticárias, angioedema, reações de fotosensibilidade.

Reações respiratórias, torácicas e mediastinais:

Muito raras (< 0,0001, incluindo relatos isolados): asma

Infecções e infestações:

Muito raras (< 0,0001, incluindo relatos isolados): erupção cutânea pustular

Reações no sistema imune:

Muito raras (< 0,0001, incluindo relatos isolados): hipersensibilidade, edema angioneurótico.

10. SUPERDOSE

A baixa absorção sistêmica do diclofenaco tópico torna a superdosagem muito improvável. Na eventual ingestão acidental, que resulte em efeitos adversos sistêmicos significativos, devem ser usadas as medidas terapêuticas gerais adotadas para o tratamento do envenenamento com medicamentos antiinflamatórios não esteroidais.

A neutralização gástrica e o uso de carvão ativado podem ser considerados, especialmente dentro de um curto período da ingestão.

DIZERES LEGAIS

Registro M.S. nº. 1.0235.0581

Farm. Resp. Dr. Ronnel Caza de Dio

CRF-SP nº. 19.710

EMS S/A

Rodovia Jornalista Francisco Aguirre Proença, s/nº, Km 08 - Chácara Assay

CEP 13186-901, Hortolândia – SP

CNPJ: 57.507.378/0003-65

INDÚSTRIA BRASILEIRA

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA.

 **0800-191914**
www.ems.com.br

Histórico de alteração para a bula

| Dados da submissão eletrônica | | | Dados da petição/notificação que altera bula | | | | Dados das alterações de bulas | | |
|-------------------------------|----------------|--|--|----------------|---------|-------------------|---|------------------|----------------------------|
| Data do expediente | Nº. expediente | Assunto | Data do expediente | Nº. expediente | Assunto | Data de aprovação | Itens de bula | Versões (VP/VPS) | Apresentações relacionadas |
| 22/01/2015 | | (10459) – GENÉRICO – Inclusão Inicial de Texto de Bula – RDC 60/12 | N/A | N/A | N/A | N/A | Atualização de texto de bula conforme bula padrão publicado no bulário. | VP/VPS | 11,6mg/g gel creme |