

## FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL

### LERTUS GEL TÓPICO 1% DICLOFENACO DIETILAMINA

Industria Paraguaya

Venta bajo Receta.

#### FÓRMULA:

***Cada 100 gramos de gel contienen:***

Diclofenaco dietilamina	1,160 g
(Equivalente a Diclofenaco sódico	1,000 g)

Excipientes c.s: Alcohol isopropílico, Metilparabeno, Carbopol 940, Macrogol 400, Propilenglicol, Cera emulsionable, Vaselina líquida, Trietanolamina, Miristato de isopropilo, Esencia de lavanda, Agua purificada.

#### ACCIÓN TERAPÉUTICA

Preparado con antiinflamatorios no esteroideos para uso tópico. Diclofenaco.

Clasificación ATC: M02AA15

#### INDICACIONES

Alivio local del dolor y de la inflamación leves y ocasionales producidos por: pequeñas contusiones, golpes, distensiones, tortícolis u otras contracturas, lumbalgias y esguinces leves producidos como consecuencia de una torcedura.

#### POSOLOGÍA Y MODO DE ADMINISTRACIÓN

***Posología:***

Aplicar el gel sobre el área afectada 3 a 4 veces al día, con un suave masaje sobre la piel. La cantidad de gel necesaria depende del tamaño del área afectada (aproximadamente el tamaño de una cereza y una nuez

Página 1 de 8

Esta información es propiedad de Tecnofarma S.A. Su contenido está dirigido a profesionales prescriptores, se prohíbe la reproducción, divulgación o utilización total o parcial de este documento o de su contenido, salvo autorización expresa del propietario y con consentimiento por escrito. Este documento ha sido preparado según lo aprobado por el ISP bajo Resolución Exenta RW N°23011/20 para el producto REG. ISP N° F-5604/20.

CL--2400089

respectivamente) de LERTUS son suficientes para tratar un área de entre 400 y 800 cm<sup>2</sup>.

Después de la aplicación, deben lavarse las manos a no ser que éstas sean el lugar del tratamiento.

***Duración del tratamiento:***

Si los síntomas empeoran o persisten después de 7 días de tratamiento, debe evaluarse la situación clínica.

***Forma de administración***

LERTUS es para uso tópico exclusivamente.

**CONTRAINDICACIONES:**

- Hipersensibilidad conocida al diclofenaco o a alguno de los excipientes del producto.
- En los pacientes que hayan sufrido previamente asma, angioedema pólipos nasales, broncoespasmo, urticaria o rinitis aguda provocada por el ácido acetilsalicílico u otro fármaco antiinflamatorio no esteroideo (AINEs). **En casos raros se han presentado reacciones anafilácticas fatales y asmáticas severas.**
- Durante el tercer trimestre del embarazo.
- No aplicar sobre heridas, lesiones eczematosas, mucosas, ni en quemaduras.

**ADVERTENCIAS:**

- No utilizar en zonas extensas. Utilizar exclusivamente en la zona afectada
- Debe considerarse la posibilidad de sufrir efectos adversos sistémico (aquellos asociados con el uso de formas sistémicas de diclofenaco) si se utiliza LERTUS a una dosis superior, o durante un periodo más largo de los recomendados.
- Debe aplicarse sobre piel sana e intacta, sin lesiones ni heridas abiertas.
- Evitar el contacto con los ojos y mucosas

- No ingerir
- No aplique simultáneamente en la misma zona con otras preparaciones tópicas
- No debe utilizarse vendajes oclusivos.
- No exponer al sol la zona tratada para reducir el riesgo de aparición de reacciones de fotosensibilidad (pudiendo aparecer en la piel lesiones como eczema vesículo-ampollosa).

## **PRECAUCIONES**

### ***Excipientes***

Este medicamento puede producir irritación de la piel porque contiene propilenglicol.

### ***Interacciones***

No es probable que se produzcan interacciones ya que la absorción sistémica de diclofenaco desde la aplicación tópica es muy baja. No obstante, se valorará la conveniencia de utilizar otros analgésicos durante el tratamiento con este medicamento.

### ***Embarazo:***

No se dispone de datos clínicos suficientes sobre el uso de diclofenaco por vía cutánea durante el embarazo. La concentración sistémica de diclofenaco es más baja tras la aplicación cutánea, comparado con formulaciones orales. Con referencia a la experiencia del tratamiento con AINES con absorción sistémica, se recomienda lo siguiente:

La inhibición de la síntesis de prostaglandinas puede afectar de manera negativa al embarazo y/o desarrollo embrionario fetal. Los datos de los estudios epidemiológicos sugieren un incremento del riesgo de aborto y de malformaciones cardíacas y gastrosquisis después del uso de un inhibidor de la síntesis de prostaglandinas al inicio del embarazo. El riesgo absoluto de malformaciones cardiovasculares se incrementó de menos de 1% a aproximadamente 1,5%. Se cree que el riesgo se incrementa con la dosis y la duración del tratamiento. En animales, la administración de un inhibidor de la síntesis de prostaglandinas ha demostrado dar lugar a un incremento de la

perdida fetal pre y post- implantación y muerte embriofetal. Además, se han reportado incrementos en la incidencia de varias malformaciones, incluyendo las cardiovasculares, en animales a los que se administró un inhibidor de la síntesis de prostaglandinas durante el periodo de organogénesis.

Durante el primer y el segundo trimestre del embarazo, no se debe administrar diclofenaco a no ser que sea claramente necesario. Si se utiliza diclofenaco en una mujer que esté intentando quedar embarazada, o durante el primer y el segundo trimestre del embarazo, la dosis y la duración del tratamiento deben ser las menores posibles.

Durante el tercer trimestre del embarazo, todos los inhibidores de la síntesis de prostaglandinas pueden exponer al feto a:

- Toxicidad cardiopulmonar (con cierre prematuro del ductus arteriosos e hipertensión pulmonar).
- Disfunción renal, que puede progresar a fallo renal con oligohidroamnios.

Además, pueden exponer a la madre y al neonato a:

- Posible prolongación del tiempo de sangrado, efecto antiagregante puede tener lugar incluso a dosis muy bajas
- Inhibición de las contracciones intrauterinas, dando lugar a retraso o prolongación del parto

Consecuentemente, está contraindicado el uso de diclofenaco en el tercer trimestre del embarazo

#### **Lactancia:**

Como otros AINEs, diclofenaco se excreta en la leche materna en pequeñas cantidades. Sin embargo, con las dosis terapéuticas de LERTUS, no se anticipa que se produzcan efectos adversos sobre el lactante.

Debido a la falta de estudios controlados en mujeres en periodo de lactancia no se recomienda el uso de LERTUS, salvo que el beneficio esperado supere

los riesgos potenciales para el recién nacido. En caso de que su administración fuera necesaria, LERTUS no deberá ser aplicado sobre los pechos o sobre una gran superficie de la piel, ni durante un periodo prolongado de tiempo.

***Datos preclínicos sobre seguridad:***

Los datos no clínicos obtenidos en estudios de toxicidad aguda y a dosis repetidas, así como en estudios de genotoxicidad y carcinogénesis con diclofenaco han revelado que no existe un riesgo específico para humanos a las dosis terapéuticas previstas. Diclofenaco 11,6 mg/g fue bien tolerado en varios estudios. No se identificó potencial de fototoxicidad y el gel contenido diclofenaco no causó sensibilización cutánea.

Diclofenaco no demostró evidencia de daños sobre la fertilidad de ratas macho o hembra.

No existe evidencia de que el diclofenaco tenga un potencial teratogénico en ratones, ratas o conejos.

***Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas.***

La aplicación cutánea de LERTUS no influye sobre la habilidad para conducir y utilizar máquinas.

## **REACCIONES ADVERSAS**

Las reacciones adversas incluyen reacciones locales, leves y pasajeras en el lugar de aplicación. En algunos casos muy raros pueden ocurrir reacciones alérgicas.

Las reacciones adversas relacionadas con diclofenaco dietilamina por vía tópica comunicadas durante el uso se listan en la Tabla 1, utilizándose la siguiente clasificación: frecuentes ( $\geq 1/100$  a  $< 1/10$ ); poco frecuentes ( $\geq 1/1.000$  a  $< 1/100$ ); raras ( $\geq 1/10.000$  a  $< 1/1.000$ ); muy raras ( $< 1/10.000$ ), incluyendo casos aislados.

Tabla 1

Clasificación de órganos y sistemas	Frecuencia	Reacciones adversas
Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos	Muy raros	Asma
Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo	Frecuentes	Erupción, eczema, eritema, prurito, dermatitis (incluyendo dermatitis de contacto)
	Raros	Dermatitis ampollosa.
	Muy raros	Reacciones de fotosensibilidad.
Infecciones e infestaciones	Muy raros	Erupción pustular
Trastornos del sistema inmunológico	Muy raros	Angioedema, hipersensibilidad (incluyendo urticaria)

La absorción sistémica de diclofenaco por vía tópica es muy baja comparada con los niveles plasmáticos del principio activo después de la administración oral. Por lo tanto, la probabilidad de que se produzcan reacciones adversas sistémicas (como trastornos digestivos o renales, broncoespasmo) es muy baja tras la aplicación tópica, en comparación con la frecuencia de reacciones adversas asociadas a la administración oral. Sin embargo, si se usa el diclofenaco sobre una gran zona de piel y durante un largo periodo de tiempo, pueden ocurrir reacciones adversas sistémicas.

### **SOBREDOSIFICACIÓN:**

No es probable que se produzcan casos de sobredosis por la baja absorción sistémica del diclofenaco aplicado de forma tópica

No obstante, se pueden esperar efectos adversos, similares a aquellos observados tras una sobredosis de diclofenaco en comprimidos, cuando se produce su ingesta (1 tubo de 100gr contiene el equivalente a 1000mg de diclofenaco sódico).

En caso de ingestión accidental, que puede derivar en reacciones adversas sistémicas, se adoptaran las medidas terapéuticas habituales en casos de sobredosis con medicamento antiinflamatorios no esteroideos.

**ANTE LA EVTUALIDAD DE UNA SOBREDOSIFICACIÓN, CONCURRIR AL HOSPITAL MAS CERCANO.**

## **CARACTERISTICAS FARMACOLOGICAS/PROPIEDADES**

### ***Mecanismo de acción***

Diclofenaco es un fármaco antiinflamatorio no esteroideo (AINE) con marcadas propiedades analgésicas, antiinflamatorias y antipiréticas. El principal mecanismo de acción de diclofenaco es la inhibición de la síntesis de las prostaglandinas.

LERTUS es una forma farmacéutica de aplicación tópica con actividad antiinflamatoria y analgésica.

Diclofenaco alivia el dolor, disminuye la hinchazón y reduce el tiempo de recuperación en casos de inflamación y dolor de origen traumático o reumático.

### ***Farmacocinética***

#### **Absorción**

La cantidad de diclofenaco absorbida a través de la piel es proporcional al tamaño del área afectada, y depende tanto del total de la dosis aplicada como del grado de hidratación de la piel. La absorción puede llegar al 6% de la dosis de diclofenaco aplicada después de una aplicación tópica de 2,5gr de LERTUS sobre una superficie de 500cm<sup>2</sup>, determinada como referencia a la eliminación renal total en comparación con los comprimidos de diclofenaco. Una oclusión del área durante 10 horas resulta en un incremento de 3 veces la cantidad absorbida de diclofenaco.

#### **Distribución**

Las concentraciones de diclofenaco han sido medidas tanto en plasma, tejido y fluidos sinoviales después de la aplicación tópica en las articulaciones de la mano y rodilla. Las concentraciones plasmáticas máximas son aproximadamente 100 veces menores que tras la administración oral de la misma cantidad de diclofenaco. El 99,7% de diclofenaco se une a las proteínas séricas, principalmente a la albumina (99,4%).

**Página 7 de 8**

Esta información es propiedad de Tecnofarma S.A. Su contenido está dirigido a profesionales prescriptores, se prohíbe la reproducción, divulgación o utilización total o parcial de este documento o de su contenido, salvo autorización expresa del propietario y con consentimiento por escrito. Este documento ha sido preparado según lo aprobado por el ISP bajo Resolución Exenta RW N°23011/20 para el producto REG. ISP N° F-5604/20.

**CL--2400089**

La concentración de diclofenaco es mayor en tejido sinovial que en el plasma debido a sus propiedades (vida media plasmática corta, pKa bajo, pequeño volumen de distribución, alta unión a proteínas) lo que le proporciona afinidad por el tejido inflamado.

#### Metabolismo:

La biotransformación de diclofenaco implica en parte la glucuronidación de la molécula intacta, si bien se producen principalmente hidroxilaciones únicas o múltiples que generan varios metabolitos fenólicos, la mayoría de los cuales se convierten en conjugados glucuronidos. Dos de los metabolitos fenólicos son biológicamente activos, aunque en mucho menor medida que diclofenaco.

#### Eliminación:

El aclaramiento sistémico total de diclofenaco es de  $263 \pm 56$  ml/min. La vida media plasmática terminal es de 1-2 horas. Cuatro de los metabolitos, incluidos los dos activos, tiene vidas medias plasmáticas cortas de entre 1 y 3 horas. Un metabolito, 3'-hidroxi-4'-metoxi-diclofenaco, tiene una vida media más larga, pero es virtualmente inactivo. Diclofenaco y sus metabolitos se excretan principalmente por la orina.

#### ***Farmacocinética en poblaciones especiales:***

No se prevé acumulación de diclofenaco ni de sus metabolitos en pacientes con insuficiencia renal. En pacientes con hepatitis crónica o cirrosis no descompensada, la cinética y el metabolismo de diclofenaco son los mismo que en los pacientes sin enfermedades hepáticas.

#### **CONSERVACIÓN:**

Almacenar a temperatura no mayor de 30° C.

#### **PRESENTACIONES:**

Envases conteniendo un pomo por 60gr