



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO (DCI)

DICLOFENACO

2. VÍA DE ADMINISTRACIÓN

Vía oftálmica.

3. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Agentes antiinflamatorios
Código ATC: S01BC.03

3.1. Farmacodinamia

Antiinflamatorio no esteroideo (AINE) derivado del ácido fenilacético con actividad analgésica, antiinflamatoria y antipirética por vía sistémica. Su acción tras la administración oftálmica se cree que podría ser debida a la inactivación de las isoenzimas ciclooxigenasa-1 y ciclooxigenas-2 que catalizan la conversión del ácido araquidónico en prostaglandinas a nivel ocular, impidiendo así la participación de éstas como mediadoras del proceso inflamatorio local.

Existe evidencia clínica de eficacia del diclofenaco administrado por vía tópica ocular para el alivio de la inflamación y el dolor asociados a procedimientos quirúrgicos oftalmológicos como extracción de cataratas y cirugía corneal refractiva.

Se formula como sal sódica en solución al 0.1% para administración oftálmica

3.2. Farmacocinética

La evidencia clínica disponible revela que tras la instilación de 2 gotas de una solución al 0.1% de diclofenaco sódico en ambos ojos, las concentraciones plasmáticas del fármaco se ubican por debajo del límite de detección analítica (10 ng/mL), lo que sugiere una absorción sistémica de muy escasa magnitud.

La cinética de la mínima cantidad absorbida se asume similar a la observada con la administración por vía oral o parenteral. Se une a proteínas plasmáticas en un 99,6% y se biotransforma en el hígado mediante hidroxilación y posterior glucuronidación, dando lugar a metabolitos con mínima o nula actividad farmacológica que se excretan en un 65% por la orina y el resto con las heces. Su vida media de eliminación es de 1-2 horas.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Se desconoce si tras la administración oftálmica se excreta en la leche materna o si atraviesa la placenta.

3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

Los estudios a largo plazo en roedores para evaluar potencial carcinogénico del diclofenaco por vía sistémica mostraron resultados negativos, al igual que las pruebas de mutagenicidad realizadas (ensayo *in vivo* de micronúcleos de ratón y ensayos *in vitro* de aberración cromosómica en linfocitos humanos y test de Ames para *Salmonella typhimurium*).

Aunque no se observó teratogenicidad en los estudios de reproducción con la exposición sistémica, ni efectos adversos sobre la fertilidad, hubo evidencias de fetotoxicidad y alteraciones de la fertilidad en los animales de experimentación, presumiblemente asociadas a la inhibición de la síntesis de prostaglandinas (retraso del crecimiento intrauterino, mortalidad fetal, abortos, aumento de las pérdidas pre- y post-implantación, distocia, gestación prolongada, reducción del número de crías por camada, bajo peso de las crías nacidas vivas y cierre prematuro del ducto arterioso).

4. INDICACIONES

Tratamiento tópico ocular de condiciones que cursan con inflamación y/o dolor de intensidad leve a moderada.

5. POSOLOGÍA

5.1. Dosis

Solución oftálmica al 0.1% (1 mg/mL)

- Adultos: 2 gotas en el ojo afectado cada 6 horas.

En procedimientos quirúrgicos oftalmológicos:

- Previo al procedimiento: 1 gota cada 40 minutos, comenzando 3 horas antes de la intervención.
- Posterior al procedimiento: 3 gotas luego de la intervención, seguido por 1 gota 3 a 5 veces al día durante el tiempo que el médico indique.



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

5.2. Dosis máxima diaria

Las dosis usuales establecidas. El uso de dosis mayores o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en pacientes especiales

- **Insuficiencia renal:** No se requieren ajustes de dosificación.
- **Insuficiencia hepática:** No se requieren ajustes de dosificación.
- **Ancianos:** No se requieren ajustes de dosificación.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

- Lavar bien las manos antes de cada aplicación.
- Inclinar la cabeza hacia atrás e instilar la dosis prescrita en el fondo de saco conjuntival del ojo afectado mientras se tira suavemente del párpado inferior hacia abajo y se mira hacia arriba.
- Evitar el contacto de la boquilla del dispensador con la zona afectada o con alguna otra superficie u objeto.
- Lavar bien las manos después de cada aplicación.
- No aplicar en exceso, con mayor frecuencia, ni por más tiempo del indicado por el médico.

Cuando se emplee más de un medicamento por vía oftálmica, la aplicación de éstos debe espaciarse al menos 5 minutos. Si uno de los productos es ungüento, deberá administrarse de último.

6. REACCIONES ADVERSAS

Se han reportado con porcentajes de incidencia y severidad variables:

- **Trastornos oculares:** Escozor; irritación; dolor; prurito; visión borrosa; presión intraocular elevada; lacrimación; iritis; trastornos corneales (erosión, edema, ulceración, depósitos, opacidad, adelgazamiento y perforación); rotura epitelial.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

- **Trastornos gastrointestinales:** Dolor abdominal; náuseas; vómito.
- **Trastornos del sistema nervioso:** Cefalea; insomnio.
- **Trastornos respiratorios:** Rinitis; disnea; tos; exacerbación del asma.
- **Trastornos del sistema inmunológico:** Reacciones de hipersensibilidad que incluyen: conjuntivitis alérgica; hiperemia conjuntival; edema palpebral; edema facial; erupción cutánea; urticaria; prurito; fotosensibilidad.
- **Trastornos generales:** Astenia; infección viral; fiebre; escalofríos:

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

No existen reportes de interacción medicamentosa con la administración tópica ocular de diclofenaco. Debido a su escasa absorción sistémica y baja concentración en las dosis usuales, es poco probable la ocurrencia de alguna interacción clínicamente importante.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito con la administración oftálmica.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

- Con el uso de AINEs en general se han reportado casos graves y potencialmente fatales de hipersensibilidad. Por ello, y considerando la posibilidad de una reacción cruzada, antes de iniciar un tratamiento con este producto se debe investigar cuidadosamente en el paciente la existencia de antecedentes en tal sentido. Así mismo, se debe instruir a los pacientes a suspender de inmediato el tratamiento y procurar asistencia médica ante la aparición repentina de signos y/o síntomas que sugieran una reacción de hipersensibilidad.

- Dado que los AINEs tópicos, al igual que los corticoesteroides, pueden enlentecer la cicatrización de heridas, la administración simultánea de ambos por vía oftálmica podría incrementar el riesgo.



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

- Ante la posibilidad de un efecto antiagregante plaquetario, se recomienda usar con precaución en pacientes con tendencias hemorrágicas o que reciben tratamiento con medicamentos que prolongan el tiempo de sangrado.

- El uso de AINEs oftálmicos, incluido el diclofenaco, se ha asociado a la posibilidad de lesiones corneales graves como: erosión, ulceración, perforación o adelgazamiento corneal y rotura epitelial. Debido a ello, se debe instruir a los pacientes a notificar de inmediato al médico si durante el tratamiento se presenta alguna manifestación ocular adversa que haga sospechar dicha complicación. En tales casos se deberá suspender el producto y proceder a las medidas diagnósticas y terapéuticas que correspondan.

- La experiencia post-mercadeo con AINEs oftálmicos sugiere que los pacientes con cirugías oculares complicadas, denervación corneal, defectos epiteliales corneales, diabetes mellitus, enfermedades de la superficie ocular (como síndrome de ojo seco), artritis reumatoide o que requieren someterse nuevamente a cirugía tras un período corto de tiempo, presentan un riesgo incrementado de efectos adversos que podrían comprometer seriamente la función visual. Por ello, se recomienda precaución extrema al usar diclofenaco oftálmico en tales circunstancias.

- Es importante advertir a los pacientes que durante la instilación deben evitar el contacto del gotero o dispensador con la zona afectada a objeto prevenir la posibilidad de lesiones oculares y la contaminación del producto.

- Se debe tener en presente que la actividad analgésica y antiinflamatoria del diclofenaco podría enmascarar los signos y síntomas de una infección ocular.

- La eficacia y seguridad del producto en niños no ha sido establecida.

- Debido a que el producto tiene en su composición cloruro de benzalconio como preservativo, el cual podría ser absorbido y acumulado por el material de los lentes de contacto blandos y causar irritación ocular en el usuario, se recomienda evitar el uso de estos lentes durante el tratamiento. (Texto aplicable sólo a productos que contienen cloruro de benzalconio)



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

8.2. Embarazo

Aunque en los estudios con animales de experimentación no se observaron efectos teratogénicos con la administración sistémica de diclofenaco, no existen estudios adecuados que demuestren su seguridad tras la administración oftálmica en mujeres embarazadas. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que a criterio médico el balance riesgo-beneficio sea favorable.

8.3. Lactancia

Dado que no se conoce si el diclofenaco se excreta en la leche materna tras la administración oftálmica, su empleo durante la lactancia dependerá de la valoración del balance riesgo/beneficio. No se administre durante la lactancia a menos que el médico lo indique

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al diclofenaco, al ácido acetilsalicílico y a otros AINEs.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

No se han descrito casos de sobredosificación por la administración tópica ocular de diclofenaco. La limitada capacidad de contención del saco conjuntival para un producto oftálmico dificulta que ello ocurra. No cabe esperar que se produzca alguna manifestación local o sistémica distinta a las reportadas con el uso de dosis terapéuticas.

10.2. Tratamiento

Lavar el ojo con abundante agua tibia.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

11. TEXTOS DE ETIQUETAS Y EMPAQUES

Vía de administración: Oftálmica.

Indicación y Posología: A juicio del facultativo.

Advertencias:

- Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo vigilancia médica.
- No se administre en el embarazo o cuando se sospeche su existencia, ni durante la lactancia, a menos que el médico lo indique.
- Para evitar la contaminación del producto, no toque ni ponga en contacto la punta del dispensador con la zona afectada o con alguna otra superficie u objeto.
- No exceda la dosis recomendada.
- Manténgase fuera del alcance de los niños.
- Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

Contraindicaciones:

- Alergia a los componentes de la fórmula, al ácido acetilsalicílico o a otros analgésicos antiinflamatorios.

CON PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA

