

# Laproter® Forte

Acetaminofén 500 mg / Cafeína 65 mg

Capletas



## COMPOSICIÓN:

Cada capleta contiene:

Acetaminofén.....	500 mg
Cafeína.....	65 mg
Excipientes, c.s.p.....	1 capleta

## DESCRIPCIÓN:

**Laproter® Forte** es la combinación de acetaminofén + cafeína. El acetaminofén es un fármaco analgésico / antipirético y la cafeína contribuye a aumentar la eficacia del acetaminofén, con un inicio de acción más rápido con la terapia combinada.

## INDICACIONES:

**Laproter® Forte** está indicado para un mayor efecto analgésico en dolores de cabeza y migraña, dolores musculares, articulares, dentales y de espalda.

## FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:

### Acetaminofén

El acetaminofén es rápido y completamente absorbido, alcanzando concentraciones plasmáticas máximas entre 15 minutos y 2 horas después de su administración oral. La biodisponibilidad del acetaminofén es de 60 a 98%. Los alimentos reducen la concentración máxima del acetaminofén por 49%. Su distribución es uniforme en todos los fluidos corporales (volumen de distribución de 1 a 2 L/kg) y el 10-30% se encuentra unido a proteínas plasmáticas. El 25% del medicamento se metaboliza en el hígado por efecto de primer paso. Es extensamente metabolizado en el hígado y su depuración corporal total corresponde a 5 mL/min-1/kg-1.

Después de una sobredosis de acetaminofén, la acumulación de un metabolito hidroxilado que es normalmente inactivado al conjugarse con glutatión puede causar daño hepático. Se excreta en la orina en las primeras 24 horas de 90 a 100% de la dosis como metabolitos conjugados sin acción farmacológica. Sólo del 1 al 4% de la dosis del acetaminofén es eliminada de manera intacta por la orina. Tiene una vida media de 2 a 4 horas.

El mecanismo de acción del acetaminofén no ha sido completamente dilucidado. Se cree que actúa inhibiendo la síntesis de prostaglandinas a nivel del sistema nervioso central (SNC), y que bloquea los impulsos dolorosos a nivel periférico. Es posible que este último efecto esté mediado por la inhibición de la síntesis de prostaglandinas y otros mediadores de la respuesta dolorosa. El acetaminofén actúa a nivel central sobre el centro regulador de la temperatura en el hipotálamo para provocar vasodilatación periférica, lo que genera un mayor flujo de sangre hacia la piel, sudación y pérdida de calor.

### Cafeína

La cafeína es completa y rápidamente absorbida tras su administración oral, alcanzando concentraciones plasmáticas máximas (5 a 25 mcg/mL) entre 30 y 90 minutos. No existe evidencia de metabolismo presistémico. La cafeína se distribuye ampliamente en el organismo con un volumen de distribución aparente correspondiente a 0.55 L/kg y se une a las proteínas plasmáticas en aproximadamente 36%. Dado que la cafeína es metabolizada por el sistema de oxidadas de función mixta hepática, su eliminación se incrementa en los fumadores y disminuye en pacientes a quienes se administra cimetidina, disulfiram y anticonceptivos orales. En el adulto, su eliminación se lleva a cabo por metabolismo hepático. Se metaboliza 80% del fármaco a metabolitos conjugados sin acción farmacológica y sólo 4% se convierte en teofilina con un pobre efecto. Su vida media es de 4 a 5 horas. Se elimina por orina como metabolitos y alrededor del 1% sin cambios.

La cafeína es un potente inhibidor competitivo de la fosfodiesterasa, enzima responsable de la inactivación del AMPc, mediador de varias funciones celulares como la relajación del músculo liso e inhibición de la liberación de histamina por los mastocitos. La cafeína también incrementa la permeabilidad del calcio en el retículo sarcoplásmico y bloquea los receptores de adenosina. Debido a sus efectos estimulantes en el SNC produce sensación de bienestar en los pacientes como mejoría del estado de ánimo, menor somnolencia, menor fatiga y mayor rapidez y claridad de pensamiento, a las dosis de 50 a 200 mg.

## REACCIONES ADVERSAS:

### Acetaminofén

Si se toma en las dosis recomendadas, el acetaminofén usualmente carece de efectos secundarios. La ingestión de altas dosis puede producir ocasionalmente mareos, nerviosismo e insomnio. También puede producir reacciones cutáneas. La evidencia clínica y de laboratorio de hepatotoxicidad puede demorarse en aparecer hasta una semana.

### Cafeína

Insomnio, agitación, excitación; náuseas, vómitos, diarrea, gastralgia, cefalea, tinnitus, desorientación, extrasístoles, palpitaciones, taquicardia, arritmia cardíaca, irritabilidad, sofocos, taquiplea, poliuria. Con dosis altas: cuadros de neurosis y ansiedad. Flebitis en el lugar de la perfusión, inflamación en el lugar de la perfusión.

## **PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:**

El riesgo de hepatotoxicidad y sangrado gástrico es mayor en consumidores crónicos de alcohol (más de tres bebidas al día). No se use por más de 5 días, ya que el acetaminofén puede causar daño hepático. Se debe utilizar con precaución en pacientes con deficiencia de glucosa 6 fosfato deshidrogenasa, ya que se han reportado casos de anemia hemolítica con el uso de acetaminofén. Dosis mayores a 250 mg/día de cafeína incrementan la frecuencia y severidad de los efectos secundarios, se recomienda limitar el uso de alimentos, bebidas u otros medicamentos que contengan cafeína.

## **CONTRAINDICACIONES:**

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula, insuficiencia o daño hepático.

## **INTERACCIONES:**

### **Acetaminofén**

El acetaminofén puede potenciar el efecto de los anticoagulantes orales como acenocumarol o warfarina, se recomienda no consumir más de 2 gramos al día de paracetamol, en caso de tratamiento crónico vigilar el INR. Debido a que no existe una alternativa más segura, el acetaminofén sigue siendo el analgésico y antipirético de elección en los pacientes tratados con anticoagulantes orales. Fosfenitoína y fenitoína disminuyen la efectividad del acetaminofén e incrementan el riesgo de hepatotoxicidad. Se debe evitar el uso crónico y múltiples dosis de paracetamol en pacientes tratados con zidovudina para evitar el riesgo de hepatotoxicidad y neutropenia. La colestiramina disminuye la absorción del acetaminofén y la metoclopramida acelera la velocidad de absorción. El uso concomitante de alcohol y acetaminofén incrementa el riesgo de hepatotoxicidad. Se debe tener precaución en pacientes quienes consumen 3 o más bebidas alcohólicas al día. En pacientes con alcoholismo crónico se recomienda evitar el uso de acetaminofén. En pacientes quienes consumen regularmente alcohol, el mayor riesgo de toxicidad por acetaminofén ocurre después de un periodo de abstinencia de alcohol (12 horas) ya que el CYP2E1 se encuentra aún inducido, lo que favorece la formación del metabolito hepatotóxico del acetaminofén y por otro lado no hay alcohol para que compita por el citocromo. Los alimentos disminuyen la tasa de absorción del acetaminofén, para un rápido alivio del dolor se recomienda tomar el medicamento con el estómago vacío.

### **Cafeína**

El disulfiram incrementa la vida media de la cafeína. La cafeína disminuye el metabolismo de la teofilina incrementando las concentraciones plasmáticas y el riesgo de toxicidad. La cafeína reduce los efectos sedativos y ansiolíticos de las benzodiazepinas. El uso de fenilpropanolamina junto con cafeína incrementa la presión arterial y eleva los niveles plasmáticos de cafeína. Ciprofloxacina y verapamilo incrementan la vida media de la cafeína. En general, las quinolonas aumentan dos a cuatro veces las concentraciones plasmáticas de la cafeína.

## **RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:**

Su uso durante el embarazo y la lactancia queda a criterio médico.

## **SOBREDOSIFICACIÓN Y TRATAMIENTO:**

En caso de sobredosificación masiva los datos clínicos son: náusea, vómito, diaforesis, malestar general; se debe provocar el vómito mediante la toma de jarabe de ipecacuana ya que dentro de las primeras 24 a 72 horas postingesta no existe evidencia de daño hepático. La acetilcisteína es el antídoto universal para la sobredosificación de paracetamol y es más efectiva si se administra dentro de las primeras 10-12 horas después de la ingesta de la sobredosis, además de las medidas de soporte necesarias.

## **DOSIFICACIÓN Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:**

**Vía de administración:** oral.

**Adultos y niños mayores de 12 años:** 1 a 2 capletas cada 4 a 6 horas (3 ó 4 veces al día) sin exceder de 8 capletas en 24 horas.

## **PRESENTACIONES:**

Caja conteniendo 1 blíster con 10 capletas.  
Caja conteniendo 3 blísteres con 10 capletas.  
Caja conteniendo 10 blísteres con 10 capletas.  
Caja conteniendo 75 sobres con 2 capletas.

## **LEYENDAS DE PROTECCIÓN:**

Medicamento de venta libre.  
Manténgase fuera del alcance de los niños.  
Consérvese en un lugar fresco y seco entre 25 – 30 °C. Protéjase de la luz.



**Fabricante y Titular:**  
**LABORATORIO LAPROFAR, S.R.L.**  
C/2da. Av. Los Restauradores No.1,  
Sabana Perdida, Santo Domingo Norte.