

ACETAMIGRA

DESCRIPCIÓN DEL PRODUCTO

Es un medicamento antimigrañoso, que combina la acción analgésica del acetaminofén y la acción vasoconstrictora del tartrato de ergotamina; la fórmula incluye cafeína como un modulador de estas acciones.

COMPOSICIÓN

Cada comprimido contiene acetaminofén 500 mg + cafeína 100 mg + ergotamina tartrato 1 mg.

FARMACODINÁMICA

El acetaminofén inhibe a nivel central la actividad de la ciclooxigenasa, INDISPENSABLE PARA LA síntesis de las prostaglandinas causantes de inflamación y dolor.

La Cafeína es una metilxantina con efecto estimulante leve. Incrementa la liberación de norepinefrina produciendo vasoconstricción cerebral y aumentando la actividad neural en numerosas áreas cerebrales, aumentando el estado de alerta y postergando la fatiga, aunque en pacientes inusualmente sensibles puede inducir nerviosismo e insomnio. Muchos efectos de la cafeína se atribuyen al antagonismo competitivo que ejerce en los receptores de adenosina.

La Ergotamina tiene acción antagonista o agonista parcial sobre los receptores serotoninérgicos, dopaminérgicos y alfa – adrenérgicos. En el tratamiento de la migraña sus acciones se relacionan probablemente con sus efectos sobre los receptores de serotonina y con cierto efecto agonista alfa. Ergotamina reduce el flujo sanguíneo extracraneal disminuyendo la amplitud de las pulsaciones de las arterias extracraneales y disminuyendo la hiperperfusión del territorio basilar. La cafeína actúa en forma sinérgica con la ergotamina en la migraña; el efecto vasoconstrictor de la ergotamina se potencia, evitando el uso de dosis más altas de ambos medicamentos. Otros estudios han mostrado que cafeína estimula la absorción gastrointestinal de ergotamina.

INDICACIONES Y USO

Cefalea migrañosa y tensional

ADMINISTRACIÓN Y DOSIS RECOMENDADAS

Adultos y adolescentes a partir de los 15 años de edad: uno – dos comprimidos 3 – 4 veces al día durante el ataque migrañoso durante un máximo de dos días.

FARMACOCINÉTICA

El Acetaminofén se absorbe rápidamente cuando se lo administra por vía oral. El inicio del efecto analgésico se presenta a la media hora y dura entre 4 a 6 horas. – La concentración plasmática máxima ocurre entre los 30 minutos a 2 horas. La vida media es de aproximadamente 2 horas. Se metaboliza en el hígado, siendo el mayor

metabolito el glucoronido conjugado; también se produce un metabolito intermedio formado por oxidación en la vía citocromo P-450 oxidasa, que debe ser detoxificado por conjugación con glutatión hepático y luego eliminado como conjugados de cisteína y mercaptopurato. Cuando se incrementa la cantidad de acetaminofén a ser eliminado por la vía del sistema P-450, el glutatión hepático se depleta y el metabolito intermediario del acetaminofén no se conjuga y se liga covalentemente al hígado generando necrosis hepática.

La Cafeína es bien absorbida desde el tracto gastrointestinal, se distribuye rápidamente por los tejidos corporales, cruza fácilmente la barrera placentaria. Se metaboliza en el hígado utilizando el sistema enzimático citocromo P450. Su acción es prolongada y puede mantenerse a nivel sistémico hasta por 60 horas. La adición de cafeína a un analgésico aumenta su potencia de alivio del dolor en un 40%.

La absorción oral de Ergotamina es incompleta y errática, pero la cafeína aumenta su velocidad de absorción y el nivel plasmático máximo. Se metaboliza extensamente en el hígado y el 90% se elimina por la bilis. La vida media de eliminación es de 2 horas, pero puede almacenarse en algunos tejidos explicando en ciertos casos su efecto prolongado y su eventual potencial de toxicidad.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes del producto o a otros anti-inflamatorios no esteroideos. Por su contenido de ergotamina, el producto no debe usarse en pacientes con enfermedad vascular oclusiva, hipertensión o embarazo. El uso de ergotamina con inhibidores potentes de las enzimas microsomaes CYP 3A4 (inhibidores de proteasas, macrólidos y antifúngicos) está contraindicado por el riesgo de interacciones serias y fatalidades secundarias a isquemia.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

No debe excederse la dosis recomendada de acetaminofén. En alcohólicos crónicos puede ocurrir hepatotoxicidad e insuficiencia hepática severa. La hepatotoxicidad es causada probablemente por inducción de enzimas microsomaes hepáticas, que producen disminución de glutatión. Los alcohólicos crónicos deben limitar la ingesta de acetaminofén a ≤ 2 g/día.

Debido a su permanencia sistémica prolongada, la cafeína no debe utilizarse para el tratamiento abortivo de la migraña por más de dos días a la semana. Con un uso más frecuente, la cafeína puede acumularse y producir una cefalea de rebote después de su retirada. La administración prolongada o las dosis excesivas de ergotamina pueden causar ergotismo, dependencia, cefalea de rebote o trastornos vasculares por vasoconstricción.

Embarazo: el producto está contraindicado. **Lactancia:** no se recomienda su uso en las madres lactantes. **Pediatría:** no

se recomienda el uso en niños. **Geriatría:** precaución en ancianos con insuficiencia hepática o renal. **Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas**

Basándose en sus propiedades farmacodinámicas, es improbable que la combinación antimigrañosa altere esta capacidad.

INTERACCIONES

la administración de acetaminofén con alcohol aumenta la hepatotoxicidad, fundamentalmente en alcohólicos. Los anticolinérgicos y el carbón activado retardan la absorción del acetaminofén. Los beta-bloqueadores incrementan los efectos farmacológicos del acetaminofén. Los anticonceptivos orales disminuyen la vida media del acetaminofén. El potencial hepatotóxico del acetaminofén se incrementa con dosis altas o administración prolongada de drogas que inducen enzimas microsomaes hepáticas (barbitúricos, carbamazepina, isoniazida, rifampicina, hidantoínas). Acetaminofén puede disminuir los efectos de lamotrigine, diuréticos y zidovudina. El fluconazol, ciertas quinolonas (enoxacina, ciprofloxacina y pefloxacina), el verapamil y los anticonceptivos pueden inducir toxicidad por cafeína. La cafeína puede aumentar o disminuir los efectos de las benzodiazepinas y disminuir el efecto de la carbamazepina, del hierro, del litio y del dipiridamol. En pacientes con enfermedad hepática, la administración conjunta de cafeína con otras metilxantinas (como teofilina) puede inducir toxicidad por ambas drogas.

EFFECTOS INDESEABLES

Las reacciones adversas de acetaminofén son anemia hemolítica, neutropenia, leucopenia, pancitopenia, trombocitopenia, erupciones cutáneas, urticaria, reacciones eritematosas de piel, fiebre, hipoglicemia, coma e ictericia. La ergotamina a las dosis habituales se considera un medicamento seguro; en casos infrecuentes se ha reportado náusea, vómito, diarrea, debilidad, mialgias, parestesias, taquicardia y dolor **precordial**.

PRESENTACIÓN COMERCIAL

ACETA Migra, comprimidos con acetaminofén 500 mg, cafeína 100 mg y ergotamina tartrato 1 mg, caja por 20



Caja por 20 comprimidos

