



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) ACEMETACINA

2. VÍA DE ADMINISTRACIÓN ORAL

3. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Antiinflamatorios y antirreumáticos no esteroideos. Derivados del ácido acético y sustancias relacionadas, **Código ATC:** M01AB11

3.1. Farmacodinamia

Acemetacina es un derivado del ácido indolacético. Sus efectos farmacológicos se deben en parte a los efectos de la indometacina, un producto metabólico de la acemetacina. Acemetacina tiene propiedades antiinflamatorias, analgésicas y antipiréticas y, al igual que otros antiinflamatorios, inhibe la agregación plaquetaria. Actúa en diferentes estadios del proceso inflamatorio, inhibiendo la síntesis de las prostaglandinas y la liberación de histamina; antagoniza la acción de la bradiquinina y serotonina e inhibe también la actividad del complemento y la liberación de hialuronidasa. Las propiedades estabilizadoras de la membrana previenen la liberación de las enzimas proteolíticas, resultando en una inhibición de los procesos inflamatorios exudativos y proliferativos.

3.2. Farmacocinética

Absorción:

Después de la administración oral, acemetacina presenta una absorción cercana a 100%.

Distribución:

Después del tratamiento por 6 días con acemetacina (3 x 60 mg/día), al final de la última administración se encontraron concentraciones más altas de acemetacina en el líquido sinovial, membrana sinovial, músculo y hueso que en la sangre; por lo tanto, la acemetacina se acumula principalmente en los tejidos involucrados en la patogénesis inflamatoria de tipo osteomuscular.

Metabolismo y eliminación:

La acemetacina se une a proteínas en 87.5%, lo que significa que está disponible rápidamente en los tejidos inflamados y en altas concentraciones debido a su nivel relativamente bajo de unión a proteínas. La vida media biológica es de aproximadamente 4.5 horas.

La acemetacina es eliminada por vía renal (40%) y por medio de la bilis (60% en las heces). La acemetacina eliminada por vía renal es excretada parcialmente como sustancia intacta (acemetacina libre y conjugada con ácido glucurónico), como el metabolito formado por esterólisis (indometacina libre y conjugada) y después del rompimiento del éter (en el grupo metoxi en la posición 5') y





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>

deacilación (separación del grupo p-clorobenzoilo) en forma de un compuesto farmacológicamente inactivo.

Biodisponibilidad:

La biodisponibilidad de la acetaminofén es de aproximadamente 100%, producto de su absorción casi completa y de su adecuada disponibilidad en los sitios de acción.

3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

En estudios *in vitro* se ha demostrado que acetaminofén, no tiene potencial efecto mutagénico o de reparación del ADN.

No se ha encontrado evidencia de potencial carcinogénico de acetaminofén en estudios a largo plazo en ratas.

El potencial embriotóxico de acetaminofén en ratas y conejos ha sido estudiado sin que a la fecha se hayan encontrado malformaciones. El periodo de gestación y la duración del parto se prolongaron posteriores a la administración de acetaminofén. No se detectó ningún efecto adverso sobre la fertilidad.

4. INDICACIONES

Tratamiento del dolor en reumatismo, procesos articulares degenerativos, gota.

5. POSOLOGÍA

5.1. Dosis

Concentración de 60 mg:

Adultos: 30 a 60 mg, una (1) a 3 veces al día.

Concentración de 90 mg:

Adultos: 90 a 180 mg, una (1) a 2 veces al día.

5.2. Modo de empleo o forma de administración

Las dosis habituales recomendadas corresponden a las dosis para adultos y deben ajustarse a la naturaleza y gravedad de la enfermedad. La duración del tratamiento depende del cuadro clínico; sin embargo, la terapia con dosis de 180 mg y más por día de acetaminofén no deben ser mayores de 7 días de tratamiento. Las capsulas deben ser ingeridas con una cantidad suficiente de líquidos, durante las comidas. La terapia en pacientes ancianos debe realizarse bajo una minuciosa observación médica.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)





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>

- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante uso post-comercialización y en datos de laboratorio).

Trastornos del sistema sanguíneo y linfático

Raras: Leucopenia.

Muy raras: Anemia hemolítica o aplásica, trombocitopenia, agranulocitosis, pancitopenia.

Trastornos gastrointestinales

Poco frecuentes: Náuseas, vómitos, sensibilidad gástrica, dolor gastrointestinal, diarreas, pérdida del apetito, hemorragia gastrointestinal oculta (puede causar anemia en casos excepcionales), úlceras gastrointestinales (algunas veces acompañada de hemorragias y perforación).

Muy raras: Estomatitis, aftas bucales.

Trastornos hepatobiliares

Muy raras: Lesión hepática, hepatitis tóxica.

Trastornos endocrinos

Muy raras: Hiperglicemia.

Trastornos renales y urinarios

Raras: Lesión renal

Muy raras: Insuficiencia renal aguda, problemas urinarios.

Trastornos cardiovasculares

Raras: Edema, aumento de la presión arterial.

Muy raras: Dolor torácico tipo anginoso.

Trastornos del sistema nervioso

Poco frecuentes: Cefalea, obnubilación, mareos, vértigo, somnolencia/fatiga.

Raras: Ansiedad, confusión, psicosis, alucinaciones, depresión, irritabilidad, debilidad muscular, neuropatías periféricas,

Muy raras: Convulsiones.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Raras: Reacciones de hipersensibilidad con eritema, exantema, enantema, angioedema, hiperhidrosis, urticaria y prurito, pérdida del cabello.

Muy raras: Dermatitis fototóxica.





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 del sistema inmunológico

Raras: Reacción anafiláctica.

Muy raras: Reacción alérgica grave con edema facial y palpebral.

Trastornos oculares

Raras: Degeneración del pigmento retiniano, opacificación de la córnea.

Muy raras: Alteraciones visuales con visión doble y chispa o el paciente puede llegar a ver manchas de colores.

Trastornos auditivos

Poco frecuentes: Acufenos, tinnitus.

Muy raras: Trastornos de la audición.

Trastornos del aparato reproductor y de la mama

Muy raras: Hemorragia vaginal.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Muy raras: Fiebre, dolor de garganta, lesiones superficiales en la boca, molestias de resfriado, cansancio grave, epistaxis y hemorragias cutáneas.

Exploraciones complementarias

Raras: Aumento de las enzimas hepáticas, aumento de la urea en sangre, hiperpotasemia.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Con el uso conjunto de acetaminofén y digoxina, puede producirse un aumento de la concentración de digoxina en suero.

Si se usa concomitantemente con litio, debe controlarse el aclaramiento del litio.

El uso simultáneo con Anticoagulantes puede provocar aumento del riesgo de hemorragias, debido a la inhibición de la síntesis de tromboxano.

El uso conjunto con Corticoides u otros antiinflamatorios, aumenta el riesgo de hemorragias gastrointestinales.

El uso simultáneo con Ácido acetilsalicílico, produce disminución de las concentraciones de acetaminofén en sangre.

El Probenecid puede enlentecer la eliminación de la acetaminofén.

El uso conjunto con Antibióticos penicilínicos, puede retrasar la eliminación de penicilina.

El uso concomitante con Diuréticos y antihipertensivos, puede debilitar el efecto hipotensor de los fármacos.

La Furosemida acelera la eliminación de acetaminofén.





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>

El uso conjunto con Diuréticos ahorradores de potasio, puede aumentar el nivel de potasio en sangre (hiperkalemia); debe controlarse frecuentemente la concentración de potasio en sangre.

Se recomienda una precaución especial si se usa acetaminofén simultáneamente con fármacos que actúan en el Sistema Nervioso Central o si se ingiere alcohol.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Durante la administración de este producto es recomendable realizar estudios del funcionalismo hepático, renal y del cuadro hematológico.

Su administración por cualquier vía debe ser restringida en caso de enfermedad del tubo digestivo. Si es indispensable utilizarlo, el médico debe tomar las medidas para proteger las vías digestivas contra la posibilidad de exacerbación de afecciones gastrointestinales.

Debe evitarse la administración simultánea de este producto con otros agentes analgésicos y/o antiinflamatorios.

Pacientes con antecedentes de discrasias sanguíneas, úlcera gastro-intestinal, enfermedad de Crohn y colitis ulcerosa, alteraciones del funcionalismo hepático y renal, insuficiencia cardíaca, hipertensión arterial, asma bronquial y en adultos mayores.

Los síntomas de epilepsia, enfermedad de Parkinson y trastornos psiquiátricos preexistentes pueden intensificarse en pacientes bajo tratamiento con acetaminofén.

Este medicamento puede dañar la rapidez de las reacciones psicomotoras.

8.1. Embarazo

Durante el último trimestre del embarazo, no debe tomarse acetaminofén debido a que puede inhibir las contracciones uterinas e incrementar la tendencia a la hemorragia. Durante el primer y segundo trimestre del embarazo, acetaminofén sólo debe administrarse tras una evaluación cuidadosa de riesgos/beneficios, ya que se dispone de experiencia insuficiente en mujeres embarazadas.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia.

8.2. Lactancia

Pequeñas cantidades de acetaminofén pasan a la leche materna. Los experimentos animales no han aportado ninguna evidencia de malformaciones congénitas.

En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica suspéndase la lactancia materna mientras dure el tratamiento.

9. CONTRAINDICACIONES

- Hipersensibilidad a la acetaminofén, indometacina u otro antiinflamatorio no esteroideo.



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>

- Dishematopoyesis no resueltas.
- Úlcera péptica activa u otra patología hemorrágica del tracto gastrointestinal.
- No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia.
- Insuficiencia hepática o renal severa.
- En menores de 14 años al no disponerse de experiencia en este grupo de edades.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

Dado el mecanismo de acción del fármaco, la sobredosis o el uso incorrecto pueden causar síntomas, como náuseas, vómitos, dolor epigástrico, sudoración, trastornos del sistema nervioso, hipertensión, edema en tobillos, oliguria, hematuria, depresión respiratoria, convulsiones y coma.

10.2. Tratamiento

No se conoce ningún antídoto específico.

Si se observan síntomas de sobredosis, se recomienda tomar medidas para la descontaminación que incluyen: lavado gástrico, inducción de diuresis, Mantenimiento del equilibrio líquido (electrolítico).

Tratamiento de shock, si se presenta.

Tratamiento sintomático.

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA.

INDICACIONES Y POSOLOGÍA: A juicio del facultativo.

VÍA DE ADMINISTRACIÓN: Oral.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica.

En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.

Durante su administración evítese actividades que impliquen coordinación y estado de alerta mental.

El paciente debe informar al médico de cualquier efecto indeseable, especialmente en casos de trastornos digestivos.

Manténganse fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis prescrita.

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

PRECAUCIONES:

En conductores de vehículos y operadores de máquinas.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche de su existencia,





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>

CON PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA.



Gobierno **Bolivariano**
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

