

1

2

Capsules

3

## Caffeine-200

4

**Descripción:** Capsula de gelatina color azul con blanco, tamaño 0

5

**Presentación:** Frasco de HDPE de 250cc con 60 capsulas de 200mg

6

**Acción Terapéutica:** Restauración de fatiga física y reducción de cansancio mental, estimulante metabólico.

7

8

**Indicaciones:**

9

Caffeine-200 está indicado para la restauración de fatiga física y reducción de cansancio mental, también como estimulante metabólico en los regímenes para bajar de peso.

10

11

12

**Composición:** Cafeína (trimetilxantina) 200 Mg.

13



14

15

16

**Mecanismo De Acción:** La cafeína cruza fácilmente la barrera del cerebro que separa la sangre del interior del cerebro. Una vez en el cerebro el principal modo de acción es como un antagonista de receptores de adenosina. La molécula de cafeína es estructuralmente semejante al adenosina, y a los lazos receptores de adenosina en la superficie de células sin activarlos (un mecanismo de "antagonista" de acción). Por lo tanto, la cafeína actúa como un inhibidor competitivo.

19

21

22

Adenosina es encontrado en cada parte del cuerpo, porque juega un papel fundamental en el sistema de energía-metabolizadora de ATP, pero tiene funciones especiales en el cerebro. Hay

23

24 mucha evidencia que concentraciones de adenosina en el cerebro son aumentadas por varios  
25 tipos de énfasis metabólicos (inclusive anoxia e isquemia), y el acto para proteger el cerebro es  
26 suprimiendo actividad neural y aumentando riego sanguíneo. Así la cafeína, contrarrestando  
27 adenosina tiene generalmente un efecto de des inhibitorio en la actividad de cerebro.

28 Los mecanismos de la liberación de Adenosina en el cerebro son complejos. Hay evidencia que la  
29 adenosina funciona como un neurotransmisor sinápticamente soltado a veces, pero hay aumentos  
30 o énfasis-relacionados a la adenosina que parecen ser producidos principalmente por  
31 metabolismo extracelular de ATP. No es probable que la adenosina sea el neurotransmisor  
32 primario para ningún grupo de neuronas, sino que es soltado junto con otros transmisores por  
33 varios tipos de neuronas. A diferencia de la mayoría de los neurotransmisores, la adenosina no  
34 parece ser embalado en vesículas que son soltadas a manera de voltaje-controlado, pero al existir  
35 la posibilidad de tal mecanismo no ha sido excluido completamente.

36

37 Varias clases de receptores de adenosina han sido descritas, con distribuciones anatómicas  
38 diferentes. Los receptores A1 son distribuidos extensamente, y actúan para inhibir la recepción del  
39 calcio. Los receptores A2A en los ganglios elementales son concentrados en un área que juega un  
40 papel crítico en el control de la conducta, pero puede ser encontrado en otras partes del cerebro  
41 también, en densidades más bajas. Hay evidencia que UN receptores 2A interactúan con el  
42 sistema de dopamina, que participa en recompensa y el despertar. Los receptores (A2A también  
43 pueden ser encontrados en membranas arteriales de paredes y glóbulos).

44

45 Más allá de su papel de neuro-protector, hay razones para creer que la adenosina puede estar mas  
46 específicamente implicado en el control del ciclo de sueño. Se ha discutido que esa acumulación  
47 de adenosina puede ser una causa primaria de la sensación de la somnolencia que sigue la  
48 actividad mental prolongada, y que los efectos pueden ser mediados por inhibición de las  
49 neuronas wake-promoting a través de receptores A1, y de la activación de las neuronas sleep-  
50 promoting a través de efectos indirectos en receptores A2A. Estudios más recientes han  
51 proporcionado evidencia adicional para la importancia de A2A, pero no de los receptores A1, los  
52 receptores.

53 Parte de los efectos secundarios de la cafeína probablemente son causados por acciones no  
54 relacionadas a la adenosina. La cafeína es conocida por ser un inhibidor competitivo de la enzima  
55 Camp-fosfodiesterasa (CAMP-PDE) que convierte amp cíclico (CAMP) en células a su forma no  
56 cíclica, permitiendo así que CAMP se constituya en células. Amp cíclico toma parte en la activación  
57 de Proteína Kinase UN (PKA) empezar el fosforilizacion de enzimas específicas utilizadas en la  
58 síntesis de glucosa. Al bloquear el remanente de cafeína intensifica y prolonga los efectos de la  
59 epinefrina y esta como drogas tales como anfetamina, metanfetamina, metilfenidato. Las  
60 concentraciones aumentadas de CAM en células parietales causan una activación aumentadas de

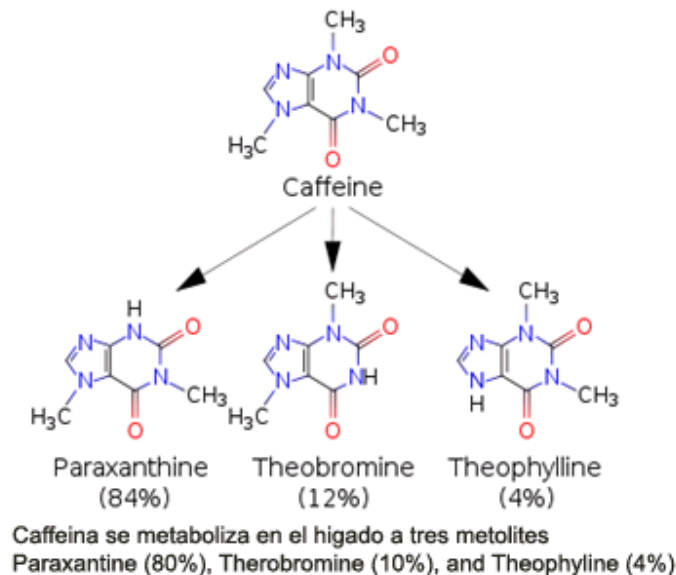
61 la proteína quinase UN (PKA) la cual resulta en el incremento de  $H^+ / K^+ ATP$  ase, el cual resulta  
62 en el incremento del ácido gástrico secretado por las células.

63

64 Los metabolitos de la cafeína también contribuyen a los efectos de la cafeína. Paraxantina es  
65 responsable de un aumento en el proceso de lipólisis, que suelta glicerol y ácidos grasos en la  
66 sangre para ser utilizados como una fuente de combustible por los músculos. Teobromina es un  
67 vasodilatador que aumenta la cantidad de oxígeno y alimento nutritivo que fluye al cerebro y  
68 músculos. Teofilina actúa como un relajante liso muscular de los bronquios y actúa como un  
69 cronotopo e inotropo que aumentan el ritmo y eficiencia del corazón.

## 70 **Metabolismo**

71 La vida media de la cafeína—el tiempo requerido para que el cuerpo elimine una mitad de la  
72 cantidad total de cafeína—varía extensamente entre individuos por factores tales como la edad,  
73 función de hígado, el embarazo, algunas medicinas concurrentes, y el nivel de enzimas en el  
74 hígado necesitado para el metabolismo de cafeína. En adultos sanos, la vida media de cafeína es  
75 aproximadamente 3–4 horas. En mujeres que toman anticonceptivos orales esto es aumentado a  
76 5–10 horas, y en mujeres embarazadas la vida media es aproximadamente 9–11 horas. La Cafeína  
77 puede acumularse en individuos con afección hepática severa, aumentando su vida media hasta  
78 96 horas. En niños y jóvenes niños, la vida media puede ser más larga que en adultos; la vida  
79 media en un bebé recién nacido puede ser siempre de 30 horas. Otros factores como fumar  
80 pueden acortar vida media de la cafeína.



81

82 La cafeína es metabolizada en el hígado por el sistema de enzimas de cito croma oxidase P450  
83 (específicamente, el isozima 1A2) en tres dimetil-xantinas metabólicas, y cada tiene sus propios  
84 efectos en el cuerpo:

85 \* Paraxantina (80%): Tiene el efecto de lipólisis creciente, elevando el glicerol liberando niveles de  
86 ácido graso en el plasma sanguíneo.

87 \* Teobromina (10%): Dilata los vasos sanguíneos y aumenta el volumen de orina. Teobromina es  
88 también el principal alcaloide en el cacao, y por lo tanto chocolate.

89 \* Teofilina (4%): relaja los músculos lisos de los bronquios, y es utilizado para tratar el asma. La  
90 dosis terapéutica de teofilina, sin embargo, es muchas veces más que los niveles alcanzados por el  
91 metabolismo de la cafeína.

92

93 Cada uno de estos metabólicos son metabolizados y entonces son excretados en la orina.

#### 94 **Eliminación**

95 La cafeína llega al torrente sanguíneo a los 30-45 minutos de su consumo. A continuación, se  
96 distribuye por el agua de todo el organismo, para posteriormente ser metabolizada y expulsada en  
97 la orina. La vida media de la cafeína en el interior del cuerpo es de 4 horas (los cálculos oscilan  
98 entre 2 y 10 horas). Durante el embarazo, disminuye la velocidad a la que se metaboliza la cafeína  
99 y las mujeres embarazadas mantienen generalmente los niveles de cafeína durante más tiempo.

100

101 **Contradicciones:** Hipersensibilidad a la cafeína, sus productos o alguno de sus componentes. No  
102 tomar durante embarazo o lactancia, la FDA recomienda que mujeres en estado no superen el  
103 consumo de 200 mg de cafeína al día, ya que estudios sugieren que las mujeres que consumen  
104 cafeína en este periodo tienen el doble de riesgo de un aborto. Consulte a su doctor si padece  
105 alguna condición hepática.

106 **Interacciones Farmacológicas:** la cafeína aumenta la eficacia de algunos fármacos. Las marcas de  
107 la cafeína potencian aliviadores al 40% más efectivo en aliviar dolores de cabeza y ayudan el  
108 cuerpo a absorber medicinas de dolor de cabeza más rápidamente, trayendo más rápido alivio. Por  
109 esta razón, muchas drogas sin receta de dolor de cabeza incluyen cafeína en su fórmula. También  
110 es utilizado con ergotamine en el tratamiento de dolores de cabeza de migraña y grupo así como  
111 vencer la somnolencia causada por antihistamínicos.

112 Las quinolinas antibacterianas (norfloxacin, ciprofloxacina, enoxacin, etc) reducen la eliminación  
113 de la cafeína, lo que puede originar un aumento exagerado de los efectos farmacológicos de esta  
114 sustancia.

115 La cafeína reduce las concentraciones séricas de litio por lo que pacientes bajo tratamiento con  
116 este fármaco deberán ser advertidos de una posible reducción de los efectos antidepresivos del  
117 mismo. La cafeína interacciona igualmente con los inhibidores de la monoaminoxidasa (IMAOs)  
118 potenciando los efectos simpaticomiméticos de estos que pueden traducirse en arritmias  
119 cardíacas o grave hipertensión. El consumo de café esta contraindicado durante el tratamiento  
120 con IMAOs (p.ej. furazolidona, procarbazina, y selegilina) y durante 2 semanas después de la  
121 discontinuación de estos fármacos.

122 Los pacientes tratados con benzodiazepinas para evitar el insomnio deben evitar el consumo de  
123 bebidas a base de cafeína poco antes de acostarse debido a que estas podrían antagonizar los  
124 efectos inductores del sueño de las primeras. Tampoco se deben administrar barbitúricos  
125 concomitantemente con cafeína, en primer lugar por ser los primeros inductores del metabolismo  
126 hepático con la consiguiente reducción de los niveles plasmáticos de la cafeína y en segundo lugar  
127 por poder anular la cafeína los efectos hipnóticos de los barbitúricos. Otros inductores del  
128 metabolismo hepático (fenitoína, rifampicina, etc.) pueden igualmente reducir la eficacia de la  
129 cafeína.

130 No se recomienda la administración concomitante de teofilina y de cafeína debido a la  
131 acumulación de efectos farmacológicos que podría conducir a una excesiva estimulación del  
132 sistema nervioso central con desarrollo de nerviosismo, irritabilidad, temblores, etc. En los  
133 neonatos, el uso conjunto de teofilina y cafeína puede resultar en el desarrollo de toxicidad

134 Las metilxantinas, incluyendo la cafeína bloquean los efectos de la adenosina, si bien cuando los  
135 niveles plasmáticos son muy elevados, mayores que los que se obtienen después de dosis  
136 terapéuticas. Sin embargo, este efecto antagónico se debe tener en cuenta si se administran dosis  
137 elevadas de cafeína.

138 El riluzol es un sustrato de las isoenzimas hepáticas CYP1A2 que puede afectar el metabolismo y el  
139 aclaramiento hepático de otros fármacos, incluyendo la cafeína. Sin embargo, no existe  
140 documentación clínica con respecto a esta posible interacción. Otros inductores del metabolismo  
141 hepático podrían afectar el metabolismo oxidativo de la cafeína. Algunos de estos inductores son  
142 la cimetidina, claritromicina, eritromicina, fluvoxamina, ketoconazol, tacrina, terbinafina y  
143 zileuton. En el caso de presentarse efectos adversos, se deberá reducir las cantidades de cafeína  
144 consumidas o administradas

145 La cafeína interfiere con los efectos de la creatina (una sustancia utilizada para incrementar los  
146 efectos ergogénicos de la musculación). Se ha comprobado que una dosis de 5 mg/kg/día de  
147 cafeína elimina por completo los efectos de creatina sobre la contracción muscular, si bien la  
148 cafeína no interfiere con la capacidad de creatina para aumentar los efectos de fosfocreatina en el  
149 músculo.

150 Debe tenerse en cuenta que el zumo de pomelos contiene un compuesto desconocido que inhibe  
151 el sistema enzimático del citocromo P450 en la pared intestinal. Aunque la información existente  
152 es limitada, parece ser que el zumo de pomelo aumenta los niveles plasmáticos de cafeína

153 Por otra parte, algunos alimentos contienen cantidades sustanciales de cafeína o teobromina, una  
154 metilxantina parecida a la cafeína, cuyos efectos pueden potenciar a los de esta produciendo  
155 náuseas o temblores. Se recomienda, por tanto, limitar el uso de estos alimentos durante un  
156 tratamiento terapéutico con cafeína

157

158

### 159 **La cafeína y el Parkinson**

160 Varios estudios han mostrado la toma de cafeína esta asociada con una reducción del riesgo de  
161 la enfermedad de Parkinson (PGDO) en hombres, pero en los estudios en mujeres han sido no  
162 concluyentes. El mecanismo por el cuál la cafeína afecta el PGDO es un misterio. En modelos  
163 animales, los investigadores han mostrado que la cafeína puede prevenir la pérdida de producción  
164 de dopamina en las células neuronas vistas en la Enfermedad de Parkinson, pero los  
165 investigadores todavía no saben cómo ocurre.

166

### 167 **Reacciones adversos:**

168 Los síntomas—posiblemente inclusive dolor de cabeza, la irritabilidad, una incapacidad para  
169 concentrar, la somnolencia, el insomnio y el dolor en el estómago, cuerpo superior, y  
170 articulaciones pueden parecen dentro 12 a 24 horas después de discontinuación de la toma de  
171 cafeína, el pico en aproximadamente 48 horas, y duran generalmente de uno a cinco días,  
172 representando el tiempo necesario para el número de receptores de adenosina en el cerebro para  
173 volver a niveles "normales", no influenciado por consumo de cafeína. Los analgésicos, como  
174 aspirina, pueden aliviar los síntomas de dolor, como puede una pequeña dosis de cafeína. Más  
175 efectivo es una combinación de un analgésico y una pequeña cantidad de cafeína.

176 Una sobredosis aguda de cafeína, generalmente por encima de acerca de 400 miligramos,  
177 dependiendo en el peso y el nivel de tolerancia de cafeína, puede tener como resultado un estado  
178 de sobre-estímulo de sistema nervioso central llamado **intoxicación por cafeína**, coloquialmente  
179 "inestabilidades de cafeína". Los síntomas de intoxicación de cafeína no son diferentes de  
180 sobredosis de otros estimulantes. Puede incluir la agitación, el nerviosismo, el entusiasmo, el  
181 insomnio, sudoración, micción aumentada, alboroto gastrointestinal, espasmos musculares,  
182 incoherencia entre el pensamiento y habla, irritabilidad, arritmia, y agitación psicomotriz. En  
183 casos sobredosis mucho más grande, manía, depresión, inestabilidad del juicio, desorientación,  
184 desinhibiciones, las alucinaciones y la psicosis pueden ocurrir, y rhabdomyolysis (avería de tejido  
185 esquelético de músculo) puede ser provocado.

186 En casos de sobredosis extrema, la muerte puede resultar. La mediana dosis mortal (LD50) dado  
187 oralmente, es 192 miligramos por kilogramo en ratas. El LD50 de cafeína en humanos es  
188 dependiente en el peso y la sensibilidad individual y se estima que puede estar entre 150 a 200

189 miligramos **por kilogramo** de masa de cuerpo, aproximadamente 80 a 100 cafés para un medio  
190 adulto tomado dentro de una brecha limitada que es dependiente en la vida media. Aunque  
191 logrando dosis mortal con cafeína sería excepcionalmente difícil con cafeína regular, se han  
192 reportado muertes por tomar dosis excesiva en píldoras de cafeína, con síntomas graves de  
193 sobredosis que requiere hospitalización de tan poco como **2 gramos** de cafeína. La Muerte ocurre  
194 típicamente debido a fibrilación ventricular producida por efectos de cafeína en el sistema  
195 cardiovascular.

196 El tratamiento para la intoxicación severa de cafeína es generalmente alterno, porque es un  
197 tratamiento que se lo proporciona para los síntomas inmediatos, pero si el paciente tiene niveles  
198 muy altos de suero de cafeína entonces la diálisis de peritoneal, la diálisis, o hemo -infiltración  
199 pueden ser requeridos.

200

201 **Dosis y Administración:** Adultos, hasta 3 capsulas por día sin exceder los 1000 mg, 1 capsula  
202 después del desayuno y de ser necesario 1 capsula después del almuerzo. Administración Oral.  
203 No administrar en menores de 13 años.

204

205 **Activos Principales** trimetilxantina

206  **Firstmed Pharma**

207

208 Firstmed Pharma Corporación  
209 Dothan Alabama USA

210

211 Distribuidor en Ecuador

212 Junín 203 y Panamá

213 Piso 2 – Of 3

214 Guayaquil – Ecuador

215 Tel. 5934-2560534

216 [www.firstmedpharma.com](http://www.firstmedpharma.com)

217