

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA INVESTIGACION Y CONTROL DE CALIDAD	
DEPARTAMENTO DESARROLLO			
IBUPROFENO			
Fecha: Mayo 2008	Página: 1	Producto N° imed-122.C	Versión : 01

MONOGRAFIA FARMACOLOGICA

1.- Denominación:

Nombre	Ibuprofeno
Principio Activo	Ibuprofeno
Forma Farmacéutica	Comprimidos Recubiertos

2.- Composición:

Ibuprofeno comprimidos recubiertos 400 mg

Cada comprimido recubierto contiene:

Ibuprofeno 400 mg

Excipientes: Almidón pregelatinizado, colorante FD&C amarillo N°6, talco, colorante FD&C amarillo N°6 lacado 42%, sodio almidón glicolato, ácido esteárico, dióxido silícico coloidal, celulosa microcristalina, ácido metacrílico copolímero tipo A, poliacrilatos dispersión al 30%, magnesio estearato, titanio dióxido, macrogol 6000, colorante FD&C amarillo N°5 lacado 17%, hipromelosa 5 cps, simeticona 30%.

Ibuprofeno comprimidos recubiertos 600 mg

Cada comprimido recubierto contiene:

Ibuprofeno 600 mg

Excipientes: Almidón pregelatinizado, colorante FD&C amarillo N°6, talco, colorante FD&C amarillo N°6 lacado 42%, sodio almidón glicolato, ácido esteárico, dióxido silícico coloidal, celulosa microcristalina, ácido metacrílico copolímero tipo A, poliacrilatos dispersión al 30%, magnesio estearato, titanio dióxido, macrogol 6000, colorante FD&C amarillo N°5 lacado 17%, hipromelosa 5 cps, simeticona 30%.

3.- Fórmulas:

Ibuprofeno:

Fórmula Global	$C_{13}H_{18}O_2$
P.M.	206,27

4.- Categoría:

Antiinflamatorio no esterooidal. Analgésico, Antipirético.

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA INVESTIGACION Y CONTROL DE CALIDAD	
DEPARTAMENTO DESARROLLO			
IBUPROFENO			
Fecha: Mayo 2008	Página: 2	Producto N° imed-122.C	Versión : 01

5.- **Indicaciones:**

Ibuprofeno se usa como antiinflamatorio y analgésico en el tratamiento sintomático de la artritis reumatoídea crónica y aguda, osteoartritis y otros desórdenes músculo-esqueléticos. Al usarse en el tratamiento de artritis reumatoídea, el Ibuprofeno alivia el dolor y la rigidez, reduce la inflamación y mejora el movimiento de las articulaciones; sin embargo, la droga no altera el proceso reumatoide de base.

Se utiliza además, para el tratamiento de dolores leves a moderados del postoperatorio, dolores asociados al resfrío, dolores musculares, en el alivio de dismenorrea primaria, migraña y para reducir la fiebre en los niños.

6.- **Posología:**

El Ibuprofeno se administra oralmente, de preferencia, después de una comida.

La dosis usual de Ibuprofeno en el tratamiento sintomático de artritis reumatoídea crónica y aguda y en osteoartritis es 400 – 800 mg 3 ó 4 veces al día. La dosis debe ser ajustada de acuerdo a la respuesta y tolerancia del paciente. No exceder de los 3,2 g diarios.

Para el alivio del dolor leve a moderado, la dosis usual en adultos es de 400 mg cada 4 a 6 horas. También se usa en dismenorrea primaria con dosis de 400 mg cada 4 horas, para lo cual el tratamiento debe iniciarse con los primeros síntomas de dolor. Alternativamente, en la automedicación de la dismenorrea la dosis inicial en adultos es 200 mg cada 4 – 6 horas; la dosis puede incrementarse a 400 mg cada 4 – 6 horas si es necesario sin exceder los 1,2 g diarios.

Para la reducción de la fiebre o como analgésico en niños, 20 a 30 mg al día, repartidos en 3 o 4 dosis cada 4 o 6 hrs.

7.- **Farmacología:**

Ibuprofeno tiene acciones farmacológicas similares a las de otros agentes antiinflamatorios no esteroideos.

Ibuprofeno ha mostrado tener actividad antiinflamatoria, antipirética y analgésica, tanto en animales como en seres humanos. Para los efectos antiinflamatorios se requieren dosis más altas que para los efectos analgésicos. No se conoce aún el mecanismo de acción exacto, pero la acción antiinflamatoria del Ibuprofeno se puede deber a la inhibición de la biosíntesis de prostanglandinas, debido a la inhibición de las ciclooxigenasas (COX-1 y COX-2). Probablemente, produce antipiresis al actuar sobre el centro termorregulador del hipotálamo, aumentando la disipación del calor, como resultado de la vasodilatación y el incremento del flujo sanguíneo periférico. Los estudios en animales indican que el Ibuprofeno es un analgésico que actúa periféricamente y no centralmente.

El Ibuprofeno puede causar en el hombre, aunque menos que la aspirina o indometacina a dosis terapéuticas, algunas anormalidades mucogástricas, incluyendo edema, eritema y hemorragia de las submucosas con petequias y erosión. El Ibuprofeno inhibe la agregación

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA INVESTIGACION Y CONTROL DE CALIDAD	
DEPARTAMENTO DESARROLLO			
IBUPROFENO			
Fecha: Mayo 2008	Página: 3	Producto N° imed-122.C	Versión : 01

de plaquetas y prolonga el tiempo de sangría, pero no afecta el tiempo de protrombina o de coagulación total.

8.- **Farmacocinética:**

Aproximadamente el 80% de la dosis oral de Ibuprofeno es absorbida desde el tracto gastrointestinal.

Al administrarse con los alimentos, su velocidad de absorción disminuye y se reducen los niveles plasmáticos, pero la cuantía de la absorción total no es afectada; lo mismo ocurre con los antiácidos.

Luego de la administración oral, la concentración plasmática peak se alcanza después de 2 horas.

Aproximadamente el 90% al 99% de una dosis circula unida a las proteínas del plasma.

Los estudios en animales señalan que la distribución de Ibuprofeno varía de acuerdo a la especie; no se han publicado aún, datos de la distribución en el ser humano. El Vd se ha calculado en 0,12-0,2 L/kg en el adulto. El Ibuprofeno y sus metabolitos atraviesan la barrera placentaria en ratas y conejos. En estudios preliminares, Ibuprofeno no ha sido detectado en la leche de mujeres en período de lactancia.

La vida media plasmática de la droga es de 2 a 4 horas. Los niveles sanguíneos declinan rápidamente, tanto después de dosis múltiples, como de dosis simples.

El Ibuprofeno se metaboliza vía oxidación a 2 metabolitos inactivos. Alrededor del 50 al 60% de una dosis oral se excreta en la orina como metabolitos y conjugados glucurónidos, dentro de las 24 horas. Menos del 10% de la droga se excreta intacta a través de la orina. La excreción del Ibuprofeno se completa especialmente dentro de las 24 horas siguientes a su administración oral.

9.- **Información para su prescripción:**

Precauciones y Advertencias:

Si se produce intolerancia gastrointestinal, debe administrarse el Ibuprofeno con los alimentos, con leche o con antiácidos; de no ser así, debe disminuirse la dosis.

Se han producido algunos casos de ulceración gastrointestinal con perforación y hemorragia. Se ha informado que los efectos secundarios gastrointestinales, ocasionados por la terapia con Ibuprofeno, ocurren con menor frecuencia que los debidos a la terapia con salicilatos o indometacina; no obstante, esto se puede deber a que en muchos casos la dosis del Ibuprofeno no excede de 1,2 gramos diarios.

Se debe advertir a los pacientes sobre la posibilidad de sufrir efectos adversos graves como úlcera péptica, perforación o hemorragia gastrointestinal, insuficiencia renal, hipertensión, compromiso de la función cardíaca. Esto es más frecuente en los tratamientos prolongados, en ancianos, pacientes de úlcera y bebedores.

Se debe advertir a los pacientes de informar oportunamente al médico de cualquier disturbio gastrointestinal, manifestaciones oculares-visuales o rash que pueda producirse durante la

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA INVESTIGACION Y CONTROL DE CALIDAD	
DEPARTAMENTO DESARROLLO			
IBUPROFENO			
Fecha: Mayo 2008	Página: 4	Producto N° imed-122.C	Versión : 01

terapia con Ibuprofeno, o si después de 10 días, el dolor persiste.

Aunque los estudios de reproducción en animales no han demostrado efectos teratogénicos, aún no se ha establecido la seguridad de la administración de Ibuprofeno durante el embarazo. El Ibuprofeno inhibe la síntesis y liberación de las prostaglandinas, lo que podría afectar el parto. Por estas razones, no se recomienda el uso de Ibuprofeno en mujeres embarazadas.

La posibilidad de que el efecto antipirético y antiinflamatorio del Ibuprofeno pueda enmascarar signos y síntomas de una infección u otra enfermedad, debe ser considerado.

La función hepática y renal debe ser monitoreada durante el tratamiento con Ibuprofeno cuando son terapias prolongadas y/o administradas a pacientes de alto riesgo.

Contraindicaciones:

El Ibuprofeno no debe ser administrado en pacientes que previamente hayan presentado hipersensibilidad a él, o en individuos con síndrome de pólipos nasales, angioedema o reactividad broncoespástica precipitados por aspirina u otros agentes antiinflamatorios no esteroideos.

No se recomienda su uso en mujeres embarazadas o en período de lactancia.

Interacciones:

Ibuprofeno ha mostrado interacciones importantes con otros fármacos:

En un estudio clínico, el Ibuprofeno no tuvo ningún efecto sobre el tiempo de protrombina en pacientes que recibían anticoagulantes orales; sin embargo, la posibilidad de hemorragias debiera tenerse presente y usarse con máxima precaución en pacientes que reciban dichos anticoagulantes.

Litio: Aumenta las concentraciones de litio en la sangre y disminuye la excreción renal.

La administración conjunta de Ibuprofeno con salicilatos, fenilbutazona, indometacina o corticosteroides, podría potenciar los efectos ulcerogénicos entre estas drogas.

Inhibidores ACE y de los antagonistas de receptores de Angiotensina II, disminuyen su efecto antihipertensivo y pueden deteriorar la función renal

Diuréticos tiazídicos y furosemda: reducción del efecto natriurético

10.- Reacciones Adversas:

Las reacciones adversas más frecuentes que se presentan con Ibuprofeno son las gastrointestinales como; dispepsia, pirosis, náuseas, vómitos, anorexia, diarrea, constipación, estomatitis, flatulencia, dolor epigástrico y abdominal.

Menos frecuentes: úlcera péptica y/o hemorragia gastrointestinal o perforación graves.

Efectos adversos en el SNC incluyen: desvanecimiento, cefalea y nerviosismo. También se han registrado: fatiga, somnolencia, ansiedad, confusión y depresión mental.

Pacientes que reciben Ibuprofeno, pueden experimentar tinnitus, urticaria, eritema

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA INVESTIGACION Y CONTROL DE CALIDAD	
DEPARTAMENTO DESARROLLO			
IBUPROFENO			
Fecha: Mayo 2008	Página: 5	Producto N° imed-122.C	Versión : 01

multiforme y rash eritematoso macular.

Raramente se han registrado reacciones hepáticas severas o insuficiencia renal aguda.

Pueden presentarse efectos hematológicos que incluyen: neutropenia, agranulocitosis, anemia aplásica, anemia hemolítica y trombocitopenia.

11.- **Información Toxicológica:**

Síntomas en caso de sobredosis:

Los síntomas varían de un caso a otro; se ha tolerado sin dejar secuelas en casos de niños que han ingerido dosis de 120 mg/kg aunque con síntomas de diferente intensidad

Serios síntomas de toxicidad han sido descritos con niveles plasmáticos de 360 mcg/ml

Los más frecuentes han sido: Dolor abdominal, náuseas, vómitos, letargia y somnolencia son los síntomas reportados con mayor frecuencia.

Raramente pueden ocurrir hipotensión, bradicardia o taquicardia, insuficiencia renal aguda, apnea, acidosis metabólica y coma.

Tratamiento en caso de sobredosis:

Las medidas son esencialmente sintomáticas y de soporte

Inmediatamente a la ingestión aguda, evitar la absorción de la droga mediante emesis y administración de carbón activado y catárticos.

Monitorear signos vitales especialmente, pulso, respiración y presión sanguínea.

Diuresis alcalina es aconsejable para la eliminación del fármaco

Si se presenta hipotensión, administrar fluidos I.V. Si no responde administrar dopamina o norepinefrina.

Administrar sodio bicarbonato si el paciente presenta acidosis.

12.- **Bibliografía:**

- **AHFS DRUG INFORMATION 2007**
- **PHYSICIAN DESK REFERENCE PDR. 2007**
- **BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA, Goodman y Gilman.**
- **THE EXTRA PHARMACOPOEIA MARTINDALE. - 29**

Rev.04.08/rsd.