

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

CAFEÍNA

Sinónimos: 1,3,7-Trimetilxantina. Metilteobromina. 7-Metilteofilina. Teína. Guaranina.

INCI: Caffeine.

Datos Físico-Químicos: **Cafeína anhidra:**

Polvo cristalino o cristales sedosos, blancos o casi blancos. Soluble en soluciones concentradas benzoatos/salicilatos alcalinos, bastante soluble en agua, fácilmente soluble en agua a ebullición, poco soluble en etanol al 96%. Punto de fusión: 238°C.

Formula Molecular: $C_8H_{10}N_4O_2$
Peso Molecular: 194,19

Cafeína citrato:

Polvo cristalino blanco. Soluble en agua, prácticamente soluble en etanol. Punto de fusión: 145 – 162°C.

Formula Molecular: $C_8H_{10}N_4O_2 \cdot C_6H_8O_7$
Peso Molecular: 386,3

Propiedades y usos:

La cafeína se absorbe rápidamente por vía oral y se distribuye por todo el organismo. También se absorbe a través de la piel, pero por vía rectal la absorción es lenta y variable. Es metabolizada en el hígado casi en su totalidad vía oxidación, desmetilación y acetilación, excretándose por la orina como metabolitos, y en muy pequeña proporción (<1 %) inalterada. Atraviesa la barrera placentaria y pasa a la leche materna.

Por vía oral, rectal, o intramuscular se trata de un alcaloide del grupo de las bases xánticas (metilxantinas) con mayor poder estimulante del SNC, actuando en primer lugar sobre la corteza cerebral, luego sobre el bulbo, y finalmente sobre la médula espinal. El mecanismo de acción consiste en la inhibición de una fosfodiesterasa y aumento del AMPc, aunque a dosis bajas actúa como antagonista de los receptores de adenosina.

Produce estimulación cardíaca con reducción de la resistencia periférica arteriolar, vasoconstricción cerebral (acción antimigrañosa), estimula el músculo esquelético y el control de la respiración, e incrementa la secreción ácida gástrica y la diuresis.

Se usa en estados depresivos, astenia, fatiga mental, asma bronquial, insuficiencia cardíaca, cefaleas, y apnea neonatal.

Por vía tópica tiene una acción local sin efecto sistémico, actuando sobre la lipólisis del tejido adiposo por inhibición de una fosfodiesterasa.

La cafeína citrato suele ser una mezcla de cafeína y ácido cítrico a partes iguales que se humedecen con agua y se dejan secar.

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Dosificación: Por vía tópica, al 3 – 10 % para el tratamiento de las celulitis, y hasta el 30 % para el tratamiento de las dermatitis atópicas.
Por vía oral las dosis usuales son de 30 a 300 mg de cafeína anhidra, o de 120 – 600 mg de cafeína citrato.

Efectos secundarios: Son, en general, frecuentes, aunque leves y transitorios. En la mayor parte de los casos, las reacciones adversas son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al SNC. Efectos frecuentes son el insomnio, agitación y excitación. Efectos ocasionales son las náuseas, vómitos, diarrea, gastralgia, cefalea, tinnitus, desorientación, extrasístoles, palpitaciones, taquicardia, arritmia cardíaca, sofocos, irritabilidad, taquipnea, y poliúria. Con dosis elevadas cuadros de neurosis y ansiedad.
El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de mareos o palpitaciones.
La interrupción brusca de la administración regular de dosis superiores a 600 mg / día puede producir cefalea, ansiedad y espasmo muscular.

Contraindicaciones: Alergia a las bases xánticas.
Pacientes con alteraciones cardiovasculares graves, úlcera gastroduodenal, insomnio, embarazo, lactancia y niños menores de 12 años.

Precauciones: En caso de preparados orales, se aconseja el empleo de la última toma diaria antes de las cinco de la tarde, a fin de reducir la incidencia de insomnio.

Interacciones: Entre otras, su efecto se ve aumentado con el etinilestradiol y el mestranol, y su efecto y toxicidad aumenta con la cimetidina.

Incompatibilidades: Taninos, yodo y yoduros, sales de plata, y soluciones alcalinas.

Conservación: En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Crema anticelulítica

Aminofilina 2 %
Cafeína 3 %
Crema para masaje c.s.p. 100 g

Crema o loción para dermatitis atópica y eccemas

Hidrocortisona acetato 0,5 %
Cafeína 30 %
Crema o loción Lanette c.s.p. 100 g

Ungüento hidrófilo para dermatitis y psoriasis

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Hidrocortisona base	0,5 %
Cafeína	30 %
Ungüento hidrófilo c.s.p.	50 g

Modus operandi:

Preparar el ungüento añadiendo la cafeína en la fase acuosa caliente. Humectar la hidrocortisona con unas gotas de propilenglicol, e incorporar la mezcla anterior homogeneizando bien.

Gel de cafeína base (“gel de percutalín”)

Cafeína	5 %
Gel c.s.p.	100 g

Modus operandi:

Disolver la cafeína en el agua hirviendo. Se puede gelificar con un 3% de Jaguar HP8 y unas gotas de ácido láctico para finalmente añadir un 1% de glicerina, o bien con Carbopol y unas gotas de trietanolamina hasta pH=7.

Gel de cafeína citrato

Cafeína citrato	3 g
Gel de hidroxietilcelulosa c.s.p.	100 g

Bibliografía:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).
- *Formulación magistral de medicamentos*, COF de Vizkaia, 5ª ed. (2004).
- *Monografías Farmacéuticas*, C.O.F. de Alicante (1998).
- *Formulario básico de medicamentos magistrales*, M.ª José Llopis Clavijo y Vicent Baixauli Comes (2007).
- *Formulario Magistral del C.O.F. de Murcia* (1997).
- *Formulario médico farmacéutico*, PharmaBooks, 2010.