



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

CLENBUTEROL

2. VIA DE ADMINISTRACION

VIA ORAL

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Agonistas selectivos de receptores beta-2 adrenérgicos.

Código ATC: R03AC14

3.1. Farmacodinamia

El clenbuterol, es un fenilaminoetanol con propiedades adrenérgicas, agonista selectivo por los receptores beta-2, que origina una rápida broncodilatación, independientemente del calibre bronquial y del estímulo que cause la broncoconstricción. La unión al receptor adrenérgico beta-2 da lugar a la estimulación de la adenilato-ciclasa, incrementando la producción del segundo mensajero AMPc, que inhibe la fosforilación de la miosina y disminuye los niveles intracelulares de calcio, con la consiguiente relajación muscular.

Además de sus efectos directos sobre el músculo liso bronquial, el clenbuterol parece oponerse a la liberación de mediadores espasmogénicos e inflamatorios, tales como histamina, leucotrienos y PGD4 desde los mastocitos, y acetilcolina desde las terminaciones nerviosas colinérgicas. También parece estimular el aclaramiento mucociliar. Sin embargo, se desconoce la importancia clínica de estos efectos en pacientes asmáticos.

Al igual que otros agonistas beta-2 adrenérgicos, el clenbuterol no inhibe la actividad de macrófagos y eosinófilos pulmonares, por lo que sólo es activo en la fase inicial de la crisis asmática, siendo muy limitada su eficacia en la fase tardía, caracterizada más por inflamación e hiperreactividad bronquial.

3.2. Farmacocinética

La absorción de clenbuterol por vía oral es rápida y casi completa entre 15 y 45 minutos, alcanza niveles máximos en plasma a las 2 horas, tiene una biodisponibilidad del 70-80%, se une intensamente a los tejidos, liberándose muy lentamente, lo que hace que presente unos efectos anabolizantes importantes.

Su eliminación se realiza en forma bifásica. La fase de eliminación corta (curva alfa) muestra una vida media de 1 hora y la fase prolongada (curva beta) rebasa la fase corta con una vida media de 3 a 6 horas. La





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>

eliminación se realiza predominantemente por vía renal (30%). Su vida media de eliminación es de 25-35 horas.

3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

No se ha establecido el potencial de efectos en el ser humano.

4. INDICACIONES

Tratamiento del broncoespasmo de diferentes etiologías.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos: 0,01 a 0,02 mg cada 12 horas (10 a 20 mcg cada 12 horas).

Niños: 0,0012 mg/kg de peso/ día dividida en dos o tres dosis.

5.2. Modo de empleo o forma de administración

La dosis terapéutica media es de 20 mcg en adultos, dosis de 30 a 40 mcg aumentan su efecto broncodilatador proporcionalmente, pero dosis superiores a 40 mcg no tienen mayor acción terapéutica. Puede administrarse cada 8 horas, dependiendo de la respuesta individual de cada paciente.

La duración del tratamiento depende de la respuesta y del criterio médico.

En procesos agudos la duración del tratamiento recomendado es de 5 días, y en crónicos puede administrarse durante meses inclusive.

Los comprimidos de clenbuterol se ingerirán con ayuda de un vaso de agua, y con o sin las comidas. El jarabe puede tomarse directamente con la cucharilla dosificadora o diluirse en agua, zumos de frutas o cualquier otro líquido.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes (>1/10)
- Frecuentes (>1/100, <1/10)
- Poco frecuentes (>1/1000, <1/100)
- Raras (>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 gastrointestinales

Frecuentes: Nauseas, vómitos, sequedad de boca, trastornos del gusto, dispepsia, hiperacidez gástrica y diarrea.





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 metabolismo y de la nutrición

Raras: Hiperglicemia, hipopotasemia.

Trastornos cardiovasculares

Frecuentes: Palpitaciones, taquicardia.

Raras: Hipertensión o hipotensión arterial, síndrome de QT prolongado, arritmias, fibrilación auricular, taquicardia supraventricular, extrasístole, angina de pecho.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Cefalea, temblor ligero.

Raras: Nerviosismo, mareo, vértigo, insomnio.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Muy raras: Espasmo bronquial paradójico, exacerbación del asma.

Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo

Raras: Calambres musculares, mialgias.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Poco frecuentes: Urticaria, prurito, erupción exantemática, angioedema.

Trastornos del sistema inmunológico

Muy raras: Reacción anafiláctica.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Frecuentes: Exceso de sudoración.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Los Anestésicos halogenados pueden aumentar la sensibilidad del miocardio por los agonistas beta-adrenérgicos, con un mayor riesgo de arritmias cardíacas.

Los Antidepresivos tricíclicos e IMAO, podrían incrementar los efectos cardiotoxicos de los agonistas beta-2, por lo que se recomienda evitar la asociación y no administrar clenbuterol hasta pasados 14 días del tratamiento con un antidepresivo.

Los Betabloqueantes (antagonistas adrenérgicos), incluso en forma de colirio, podría disminuir e incluso antagonizar los efectos del clenbuterol, pudiendo aparecer broncoespasmo y agravamiento del asma. Se recomienda evitar la asociación, siempre y cuando sea posible, o utilizar antagonistas cardioselectivos, aunque tampoco se puede descartar esta interacción para estos fármacos.

El clenbuterol podría potenciar la toxicidad por digoxina.





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>

Antiarrítmicos de clase I y III, antihistamínicos H1 como terfenadina, ebastina o mizolastina, bepridil, cisaprida, esparfloxacino, halofantrina, litio, neurolépticos, pentamidina, probucol, trimetoprim (Fármacos prolongadores del intervalo QT), pueden producir una potenciación de los efectos cardiotoxicos, por lo que se recomienda evitar la asociación.

Fármacos que inducen hipokalemia como: corticoides, diuréticos no ahorradores de potasio, teofilina, pueden potenciar el riesgo de la pérdida de potasio, con la consiguiente aparición de fenómenos de cardiotoxicidad, se recomienda controlar la kalemia periódicamente, sobre todo si el paciente recibe además teofilina.

La administración de clenbuterol junto con otros fármacos agonistas adrenérgicos podría potenciar la toxicidad cardíaca. Este efecto es especialmente importante si el fármaco no es selectivo por los receptores beta-2, recomendándose en este caso evitar la asociación.

La utilización de clenbuterol junto con fármacos como el formoterol o el salmeterol, agonistas selectivos de receptores beta-2 de acción prolongada, se ha mostrado eficaz a la hora de tratar las exacerbaciones en pacientes con asma moderado o grave, sin un aumento significativo del riesgo de toxicidad cardíaca.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Algunos pacientes pueden presentar un ligero temblor en las manos o signos de leve inquietud que deben conllevar a una reducción de la dosis prescrita. El clenbuterol produce una estimulación de la glucogenolisis al actuar sobre receptores beta-2, por lo que puede dar lugar a hiperglucemia. Se recomienda determinar los niveles de glucemia periódicamente.

Se recomienda precaución en pacientes con alteración del funcionalismo renal, insuficiencia cardíaca, hipertensión arterial, arritmia cardíaca, infarto agudo de miocardio, insuficiencia coronaria o en situaciones que predispongan a ellas, como hipertiroidismo. Tratamiento concomitante con simpaticomiméticos.

El clenbuterol podría dar lugar a una estimulación nerviosa, disminuyendo el umbral de convulsiones, por lo que se recomienda precaución en pacientes con epilepsia.

8.2. Embarazo

No se recomienda el empleo durante el embarazo. No se han realizado estudios adecuados y bien controlados en humanos. Los agonistas adrenérgicos administrados por vía oral o parenteral podrían dar lugar a relajación de la musculatura uterina e inhibición del parto por acción sobre receptores beta-2. La utilización de clenbuterol por vía oral para el tratamiento del asma en pacientes embarazadas, debe restringirse sólo a aquellas situaciones en las que no existiendo otra alternativa terapéutica





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>

más segura, los beneficios superen los riesgos potenciales. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia, a menos que a criterio médico el balance riesgo/beneficio sea favorable.

8.3. Lactancia

No se ha establecido, hasta la fecha seguridad durante la lactancia. Se desconoce si el clenbuterol se excreta con la leche materna y sus posibles efectos para el lactante, por lo que se recomienda evitar su administración o suspender la lactancia materna. No se administre durante la lactancia a menos que el médico lo indique.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.
Hipertiroidismo
Feocromocitoma
Insuficiencia renal.
Hipertensión arterial
Extrasístoles ventriculares.
Infarto agudo de miocardio.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

Se han dado casos de intoxicaciones, normalmente por ingestión de carnes procedentes de animales engordados fraudulentamente con clenbuterol. La sobredosis por clenbuterol suele dar lugar a síntomas propios de la intoxicación por fármacos simpaticomiméticos. Los síntomas más comunes son náuseas, vómitos, sequedad de boca, aparición de nerviosismo, insomnio, vértigo, temblores y convulsiones, cefalea, fatiga y malestar general y fenómenos cardiovasculares, con arritmias cardíacas, hipertensión o hipotensión. En los casos más graves puede aparecer angina de pecho, taquicardia con valores superiores a 200 latidos por minuto e hipokalemia. Se han descrito algunos casos de reacciones psicóticas.

10.2. Tratamiento

En caso de sobredosis se recomienda lo siguiente:

- Suspender inmediatamente la administración del fármaco y proceder a las medidas habituales de eliminación con: lavado gástrico, administración de carbón activado y laxantes para favorecer la eliminación del fármaco no absorbido.





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>

- Mantener al paciente vigilado, controlando especialmente la presión arterial, el electrocardiograma y los niveles plasmáticos de glucosa y potasio.
- El tratamiento para instaurar será sintomático.
- En caso de sobredosis importante con estimulación cardíaca significativa, se valorará la necesidad de administrar betabloqueantes cardioselectivos, como atenolol o metoprolol, vigilando al paciente por si apareciese broncoconstricción. (Evitar la administración de estos fármacos en pacientes con antecedentes de broncoespasmo).
- Si aparece hipotensión marcada, se procederá a administrar expansores plasmáticos.
- Si se produce hipopotasemia, se recomienda administrar suplementos parenterales de potasio, siempre y cuando sea necesario.
- La diálisis no se ha mostrado efectiva.

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

11.1 TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA (USO PEDIATRICO)

VIA DE ADMINISTRACION: Oral.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

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

Manténgase fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis prescrita.

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA.

Colocar Banda amarilla correspondiente a los productos de "uso pediátrico".

11.1 TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA (USO ADULTO)

VIA DE ADMINISTRACION: Oral

INDICACIONES Y POSOLOGÍA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

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

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia ni durante la lactancia, a menos que el médico lo indique.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis prescrita.

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.



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>

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA.



Gobierno **Bolivariano**
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

