



# 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

FLUTICASONA

## 2. VIA DE ADMINISTRACION

INHALATORIA ORAL

## 3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

**Grupo farmacoterapéutico:** Otros agentes contra padecimientos obstructivos de las vías respiratorias, inhalatorios, Glucocorticoides.

**Código ATC:** R03BA05.

### 3.1. Farmacodinamia

La fluticasona es un corticosteroide trifluorado sintético con potente acción glucocorticoide y débil actividad mineralocorticoide. Ejerce un marcado efecto antiinflamatorio a nivel bronquial a través de mecanismos aún no bien aclarados, pero que se presume involucran una acción inhibitoria sobre diversas células (mastocitos, eosinófilos, neutrófilos, macrófagos y linfocitos) y mediadores (histamina, eicosanoides, leucotrienos y citoquinas) que intervienen en el proceso inflamatorio y en la respuesta inmune.

La fluticasona se formula como sal propionato en suspensión para inhalación por vía oral mediante dispositivo manual dosificador.

### 3.2. Farmacocinética

#### Absorción y distribución.

Luego de su inhalación oral la fluticasona es depositada en los pulmones y absorbida después a la circulación sistémica. Según el dispositivo dosificador empleado la biodisponibilidad sistémica varía entre un 5 y un 26%. Aunque parte de la fluticasona suministrada por el dispositivo es deglutida y posteriormente absorbida en el tubo digestivo, su biodisponibilidad por esta vía es insignificante (< 1%) debido a su muy limitada absorción gástrica y a un intenso efecto metabólico de primer paso. De hecho, la experiencia clínica revela que la eficacia terapéutica del fármaco tras su inhalación es el resultado de su acción local en el tracto respiratorio y no dependiente de sus niveles séricos.

Produce una mejoría sintomática apreciable en 24 a 48 horas y un efecto terapéutico máximo a las 1 - 2 semanas de iniciado el tratamiento.

La fluticasona absorbida se une a proteínas plasmáticas en un 91% y exhibe un volumen de distribución de 4,2 L/kg.





## 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>

### **Biotransformación**

Se metaboliza en el hígado a través del citocromo P450 (isoenzima CYP3A4) transformándose en productos inactivos.

### **Eliminación**

Se excreta en aproximadamente un 95% por las heces (junto a fluticasona intacta) y menos de un 5% por la orina.

En animales de experimentación se excreta en pequeñas cantidades en la leche materna y atraviesa la barrera placentaria; sin embargo, se desconoce si ocurre lo mismo en humanos.

### **3.3. Información preclínica sobre seguridad**

Los estudios de carcinogenicidad en ratones expuestos por 78 semanas a dosis orales de fluticasona equivalentes a 2 veces la dosis máxima diaria por vía inhalatoria recomendada en humanos (DMDIRH) mostraron resultados negativos, al igual que las pruebas de mutagenicidad realizadas (ensayo *in vivo* de micronúcleos de rata y ensayos *in vitro* de mutación bacteriana de Ames, de células ováricas de hámster chino y de linfocitos periféricos humanos cultivados).

Los estudios de reproducción en ratones y ratas expuestos a dosis subcutáneas de fluticasona equivalentes a 1/10 y 1/2, respectivamente, la DMDIRH revelaron embriotoxicidad y teratogénesis (paladar hendido, onfalocele, osificación craneal retardada y retrasos del crecimiento embrionario). En conejos con dosis subcutáneas equivalentes a 1/25 la DMDIRH hubo evidencias de paladar hendido y bajo peso fetal. No se registraron trastornos o alteraciones de la fertilidad.

## **4. INDICACIONES**

Tratamiento de profiláctico del asma bronquial.

## **5. POSOLOGIA**

### **5.1. Dosis**

#### **Adultos**

Asma leve: 100 a 250 mcg dos veces al día. Asma moderada: 250 a 500 mcg dos veces al día. Asma severa: 500 a 1000 mcg dos veces al día.

#### **Niños y adolescentes**

Mayores de 4 - 15 años: 50 a 100 mcg dos veces al día.

Mayores de 16 años: Asma leve: 100 a 250 mcg dos veces al día. Asma moderada: 250 a 500 mcg dos veces al día. Asma severa: 500 a 1000 mcg dos veces al día.





## 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>

### 5.2. Dosis máxima

Las dosis indicadas. El uso en exceso o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

### 5.3. Dosis en poblaciones especiales

#### **Insuficiencia renal y/o hepática, edad avanzada ( $\geq 65$ años)**

No se ha descrito la necesidad de ajustes de dosis.

#### **Edad pediátrica ( $\leq 18$ años)**

No se ha establecido la seguridad y eficacia de fluticasona en pacientes menores de 4 años.

### 5.4. Modo de empleo o forma de administración

Cada producto tiene información relativa al modo de uso de su dispositivo dosificador particular. Al respecto, se debe leer el prospecto interno. Para la mayoría, por lo general, aplican las siguientes recomendaciones:

Agitar durante algunos segundos el dispositivo dosificador para mezclar adecuadamente su contenido.

Cuando el inhalador sea nuevo o no se haya empleado por más de una semana se debe presionar o accionar el disparador una o dos veces al vacío antes de usarlo.

Expirar fuera del dispositivo, colocar la boquilla entre los dientes y apretar los labios. Presionar el disparador con firmeza para expeler el medicamento y al mismo tiempo inhalar de manera fuerte y profunda. Mantener la inhalación y retener el aliento por algunos segundos.

Retirar el inhalador de la boca y expirar lentamente.

Si está indicada otra dosis más, agitar el inhalador y repetir el procedimiento después de transcurridos 30 segundos de la administración anterior.

Finalizado el proceso, el paciente deberá enjuagarse bien la boca con agua, sin tragarla.

## 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 ( $\geq 1/1000$ ,  $< 1/100$ )
- 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)





## 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>

### **Infecciones e infestaciones**

Muy frecuentes: Candidiasis en la boca y la garganta.  
Frecuentes: Neumonía (en pacientes con EPOC).

### **Trastornos de la sangre y del sistema linfático**

Frecuencia no conocida: Leucopenia, trombocitopenia.

### **Trastornos del sistema inmunológico**

Poco frecuentes: Reacciones de hipersensibilidad cutánea.  
Muy raras: Angioedema, reacción anafiláctica.

### **Trastornos endocrinos**

Muy raras: Síndrome de Cushing, signos y síntomas cushingoides, supresión adrenal.

### **Trastornos del metabolismo y de la nutrición**

Muy raras: Hiperglicemia, retardo del crecimiento (en niños y adolescentes).

### **Trastornos psiquiátricos**

Muy raras: Ansiedad, trastornos del sueño, cambios en el comportamiento, incluidos hiperactividad e irritabilidad (predominantemente en niños).  
Frecuencia no conocida: Depresión, agresividad (predominantemente en niños).

### **Trastornos del sistema nervioso**

Frecuentes: Cefalea.  
Muy raras: Ansiedad, trastornos del sueño, cambios de conducta, hiperactividad, irritabilidad.  
Frecuencia no conocida: Depresión, agresividad.

### **Trastornos oculares**

Muy raras: Cataratas, glaucoma.  
Frecuencia no conocida: Visión borrosa, conjuntivitis, irritación ocular, resequeidad ocular.

### **Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos**

Frecuentes: Infecciones del tracto respiratorio superior, bronquitis, sinusitis, candidiasis laríngea, irritación de la garganta, tos, disfonía.  
Muy raras: Disnea, broncoespasmo paradójico.  
Frecuencia no conocida: Neumonía (en pacientes con EPOC), epistaxis.

### **Trastornos gastrointestinales**

Muy frecuentes: Candidiasis oral.  
Poco frecuentes: Náuseas, vómito.  
Raras: Candidiasis esofágica.





## 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>

Muy raras: Dispepsia.  
Frecuencia no conocida: Caries dental.

### **Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo**

Frecuentes: Contusiones.  
Frecuencia no conocida: Erupción, urticaria, prurito.

### **Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo**

Muy raras: Disminución de la densidad mineral ósea, artralgia.

### **Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración**

Frecuencia no conocida: Condiciones eosinofílicas sistémicas (incluyendo vasculitis consistentes con síndrome de Churg-Strauss).

“Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita los profesionales de la salud y a la comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a su uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene “Rafael Rangel”, a través de la página web: <http://www.inhrr.gob.ve/ram1.php>”.

## **7. INTERACCIONES**

### **7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas**

Fármacos inhibidores de la isoenzima CYP3A4 (como: antimicóticos azoles, antibióticos macrólidos y antivirales inhibidores de la proteasa del VIH) pueden disminuir el metabolismo hepático de la fluticasona y, como resultado, aumentar sus concentraciones plasmáticas y la posibilidad de reacciones adversas (en especial supresión adrenal). En estudios con voluntarios sanos la administración conjunta de fluticasona (por vía intranasal) con ritonavir y de fluticasona (por vía inhalatoria) con ketoconazol produjo, en ambos casos, reducciones importantes de los niveles séricos de cortisol.

El uso concomitante de fluticasona inhalada y otros corticoesteroides (por cualquier otra vía de administración) aumenta el riesgo de hipercorticismos y supresión del eje hipotálamo-hipofisiario-adrenal.

### **7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio**

No se han descrito.





## 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>

### 8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

#### 8.1. Generales

La fluticasona por inhalación oral no debe usarse como tratamiento primario del estatus asmático u otros episodios agudos de asma o de enfermedad pulmonar obstructiva crónica, en los que son requeridas medidas intensivas.

El uso de corticosteroides inhalados, sobre todo en tratamientos con dosis elevadas y por tiempo prolongado, puede generar efectos sistémicos como: hipercorticismos y supresión adrenal, predisposición a infecciones virales, bacterianas y micóticas (o al agravamiento de las mismas) debidas a inmunosupresión, retardo del crecimiento en niños y adolescentes, disminución de la densidad mineral ósea, cataratas, aumentos de la presión intraocular y glaucoma. Por ello, durante el tratamiento con este medicamento se debe prestar particular atención a cualquier manifestación precoz que sugiera la posibilidad de alguna de tales anomalías a fin de establecer oportunamente las medidas clínicas pertinentes. Los pacientes (o sus familiares en el caso de niños) deben ser adecuadamente informados al respecto.

Una disminución rápida de la dosis de corticosteroides o la interrupción abrupta de un tratamiento prolongado puede dar lugar a una crisis suprarrenal aguda, así como a una exacerbación del cuadro asmático. Por ello, cuando esté justificada la suspensión o finalización de la terapia con fluticasona por vía inhalatoria, se deberá reducir gradualmente la dosificación.

Se debe advertir a los pacientes (o a sus familiares en el caso de niños) el riesgo que implica la suspensión o interrupción brusca del tratamiento.

Los pacientes que son transferidos de un tratamiento con corticosteroides por vía oral a corticosteroides por vía inhalatoria deben ser cuidadosamente evaluados ante la posibilidad un cuadro de insuficiencia adrenal. Se postula que el funcionamiento adrenal deficitario generado tras la suspensión del corticosteroide sistémico, y que por lo general requiere de varios meses para su recuperación plena, no logra ser eficientemente compensado por el corticosteroide inhalado debido a su menor biodisponibilidad sistémica. El riesgo es mayor en los pacientes que reciben dosis elevadas de corticosteroides sistémicos por tiempo prolongado. En tal sentido, se recomienda iniciar la terapia inhalatoria y, transcurridos 7 a 10 días, comenzar el retiro del corticosteroide sistémico de manera lenta y gradual con observación permanente de la condición del paciente y vigilancia del funcionamiento del eje hipotálamo-hipofisiario-adrenal.

Durante el período de transferencia se debe considerar la posibilidad de insuficiencia adrenal en pacientes expuestos a estrés fisiológico (trauma, cirugía, infecciones - especialmente gastroenteritis- u otras condiciones asociadas a la pérdida de







## 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>

electrolitos. En algunos casos podría ser necesario re-instituir temporalmente la terapia sistémica. Así mismo, se debe tener en cuenta la posibilidad de aparición de condiciones previamente suprimidas por el corticosteroide sistémico, como: rinitis alérgica, conjuntivitis, eczema y artritis, entre otras.

Tras la administración de fluticasona se pueden presentar episodios de broncoespasmo paradójico con aumento de las sibilancias y dificultad para respirar. Se debe advertir a los pacientes sobre tal posibilidad e instruirlos a suspender el uso de inmediato y notificar al médico si ello llegara a ocurrir. El paciente deberá ser evaluado y, en caso necesario, tratado con una terapia alterna.

Debido al efecto de los corticosteroides sobre la densidad mineral ósea, se recomienda precaución y vigilancia periódica en los pacientes con factores de riesgo de osteoporosis, en especial si reciben tratamiento prolongado con dosis elevadas.

El uso prolongado de fluticasona por vía inhalatoria oral se ha asociado con el desarrollo de infecciones en boca y garganta por *Cándida albicans* debidas a la deposición del fármaco. Por ello, se recomienda evaluación periódica de los pacientes ante dicha posibilidad y, así mismo, informarles la importancia de enjuagarse la boca con agua después de cada dosificación a objeto de minimizar el riesgo.

Los pacientes que reciben corticosteroides son más susceptibles que los individuos sanos a la posibilidad de infecciones. En pacientes que no han tenido varicela o sarampión, o que no han sido inmunizados, el desarrollo de estas infecciones podría resultar en casos graves y potencialmente fatales, por lo que debe evitarse en lo posible su contacto o proximidad con personas que las padecen. El producto no debe ser usado en pacientes con infecciones bacterianas, micóticas y/o virales sistémicas o localizadas que no estén adecuadamente controladas con fármacos antiinfecciosos.

Se debe instruir a los pacientes (o a sus familiares en el caso de niños) a informar de inmediato la ocurrencia de cualquier reacción o síntoma inusual durante el tratamiento; en especial: aumentos de peso, alteraciones de conducta, infecciones, trastornos visuales, empeoramiento de la condición clínica o manifestaciones alérgicas.

Se debe tener en cuenta que como la fluticasona absorbida se elimina a través de metabolismo hepático, en pacientes con disfunción hepática podría ocurrir algún grado de acumulación plasmática.

Usar con precaución en pacientes con insuficiencia hepática, historia de presión intraocular elevada, cataratas, en niños y en ancianos.





## 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>

### 8.2. Embarazo

Dado que en los ensayos experimentales con fluticasona por vía sistémica se ha evidenciado daño fetal y no hay estudios clínicos adecuados que demuestren la seguridad de su administración por vía inhalatoria en mujeres embarazadas, su uso durante la gestación debe limitarse a situaciones de estricta necesidad en las que los beneficios esperados del tratamiento a la madre superen claramente los riesgos potenciales sobre el feto. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que a criterio médico el balance beneficio/riesgo sea favorable.

### 8.3. Lactancia

Dado que no se conoce si la fluticasona se excreta en la leche materna tras su administración por vía inhalatoria, su uso durante la lactancia dependerá de la valoración del balance beneficio/riesgo. No se administre durante la lactancia a menos que el médico lo indique.

### 8.4. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

La influencia de fluticasona sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas es nula o insignificante.

## 9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.  
Infecciones bacterianas, fúngicas y/o virales sistémicas o localizadas no tratadas.  
Niños menores de 4 años.

## 10. SOBREDOSIS

### 10.1. Signos y síntomas

Con la sobredosis aguda de fluticasona por vía inhalatoria no cabe esperar que se produzcan reacciones o problemas clínicos de consideración. La sobredosificación crónica, por el contrario, puede conducir a hipercorticismismo y supresión adrenal.

### 10.2. Tratamiento

Tratamiento sintomático y de soporte, según necesidad.

## 11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

VIA DE ADMINISTRACION: Inhalatoria oral.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

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



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>

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, ni suspenda o interrumpa el tratamiento sin el consentimiento del médico

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

AGITE ANTES DE USAR

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula

Niños menores de 4 años.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

## 12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Agosto de 2022



Gobierno **Bolivariano**  
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular  
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene  
"Rafael Rangel"

