

NASONEX®
(Furoato de Mometasona)
SPRAY NASAL ACUOSO

LPI-OG0887-NS-082017

1. DESCRIPCION DEL PRODUCTO

NASONEX® es una suspensión acuosa de Furoato de Mometasona, sin alcohol y sin olor, para administración tópica nasal, con un sistema de bomba manual atomizadora, de dosis exacta. Cada aplicación de NASONEX® suministra aproximadamente 100 mg de una suspensión de Furoato de Mometasona, equivalente a 50 µg de Furoato de Mometasona.

2. FARMACOLOGÍA PRECLÍNICA

2.1. PROPIEDADES FARMACODINÁMICAS

El Furoato de Mometasona es un glucocorticosteroide tópico con propiedades antiinflamatorias locales, a dosis que no son activas sistémicamente.

El mecanismo de acción preciso es desconocido, pero es probable que gran parte del mecanismo de los efectos anti-alérgicos y anti-inflamatorios del furoato de mometasona resida en su capacidad de inhibir la liberación de mediadores de reacciones alérgicas.

El furoato de mometasona inhibe significativamente la liberación de leucotrienos de los leucocitos en pacientes alérgicos. En cultivos celulares, el furoato de mometasona demostró alta potencia en la inhibición de la síntesis y liberación de IL-1, IL-5, IL-6 y TNF α ; también es un inhibidor potente de la producción de citoquinas TH₂, IL-4 e IL-5, de las células T CD4+ humanas. En leucocitos mezclados de pacientes atópicos, el furoato de mometasona fue un inhibidor más potente de la producción de leucotrienos que la BDP (beclometasona dipropionato).

En un modelo preclínico, el furoato de mometasona ha mostrado reducir marcadamente la acumulación de eosinófilos en el sitio de una reacción alérgica. Adicionalmente, el furoato de mometasona reduce el número de linfocitos y los niveles de ARN mensajero para las citoquinas proalérgicas IL-4 e IL-5.

2.2. FARMACOCINÉTICA PRECLÍNICA Y METABOLISMO

Muchos estudios fueron conducidos para investigar la absorción, distribución, metabolismo y excreción del furoato de mometasona siguiendo diferentes rutas de administración y en diferentes especies. El furoato de mometasona y/o sus metabolitos son distribuidos rápida y extensivamente en las ratas. El furoato de mometasona sufre un extenso metabolismo de primer paso y se excreta principalmente en forma de metabolitos a través de la bilis, y en un grado limitado en la orina.

NASONEX®
(Furoato de Mometasona)
SPRAY NASAL ACUOSO

LPI-OG0887-NS-082017

3. FARMACOLOGÍA CLÍNICA

3.1. PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS

El furoato de mometasona monohidrato, administrado como spray nasal acuoso, tiene una biodisponibilidad sistémica <1% en el plasma, usando un ensayo sensible con un límite de cuantificación inferior (LLOQ) de 0,25 pg/mL. La suspensión de furoato de mometasona se absorbe muy pobremente en el tracto gastrointestinal, y la pequeña cantidad que puede ser ingerida y absorbida sufre un extenso metabolismo de primer paso hepático antes de su excreción en la orina y en la bilis.

3.2. PROPIEDADES FARMACODINÁMICAS

En los estudios que utilizan la exposición al antígeno nasal, el furoato de mometasona en suspensión acuosa para administración tópica nasal ha demostrado actividad anti-inflamatoria en las respuestas alérgicas de fases temprana y tardía. Esto ha sido demostrado por la disminución (frente a placebo) en la actividad de la histamina y de eosinófilos y reducciones (vs basal) en eosinófilos, neutrófilos y proteínas epiteliales de adhesión celular. Debido a la baja disponibilidad sistémica del furoato de mometasona después de la administración intranasal, cualquier correlación farmacodinámica tiene que basarse en índices sensibles de la posible exposición sistémica en lugar de los niveles medidos de furoato de mometasona. La actividad sistémica de los corticoesteroides exógenos es comúnmente expresada por la evaluación de la actividad del eje hipotalámico-pituitario-suprarrenal (HPA).

En dos estudios con 1954 pacientes de 12 años de edad y mayores, NASONEX® 200 mcg dos veces al día fue efectivo en mejorar significativamente los síntomas de rinosinusitis en comparación con placebo como fue evaluado por el conjunto de síntomas (dolor facial/presión/sensibilidad, dolor de cabeza sinusal, rinorrea, goteo post nasal, y congestión nasal/mala ventilación) en el MSS (Major Symptom Score) durante el período de 15 días de tratamiento (P02683 $p < 0.001$; P02692 $p = 0.038$). Un grupo de amoxicilina 500 mg tres veces al día no fue significativamente diferente del placebo en la reducción de los síntomas de rinosinusitis como fue evaluado por el MSS. Una menor cantidad de sujetos tratados con NASONEX® 200 mcg dos veces al día fueron considerados por el médico tratante por ser fallas del tratamiento que aquellos tratados con placebo ($p = 0.0074$). En adición, durante el período de seguimiento post-tratamiento, el número de recurrencias vistas con NASONEX® fue menor y comparable con los grupos de tratamiento de amoxicilina y placebo. Una duración del tratamiento superior a 15 días no fue evaluada en rinosinusitis aguda.

NASONEX®
(Furoato de Mometasona)
SPRAY NASAL ACUOSO

LPI-OG0887-NS-082017

En estudios clínicos con poliposis nasal, NASONEX® mostró una mejoría significativa en comparación con el placebo en los puntos finales clínicamente relevantes para congestión, tamaño del pólipo nasal y pérdida del olfato.

4. INDICACIONES Y USO

4.1. INDICACIONES TERAPÉUTICAS

NASONEX® está indicado en el tratamiento de los síntomas de rinitis alérgica estacional o perenne, en adultos, adolescentes y niños mayores de 2 años de edad.

NASONEX® también está indicado para el tratamiento de pólipos nasales y los síntomas asociados incluyendo congestión y pérdida del olfato, en pacientes adultos mayores de 18 años de edad.

NASONEX® está indicado para el tratamiento de los síntomas asociados con rinosinusitis aguda sin síntomas de infección bacteriana severa en pacientes mayores de 12 años de edad.

NASONEX® también está indicado en adultos y niños mayores de 12 años, como terapia coadyuvante a la antibioticoterapia en episodios agudos de sinusitis.

5. INFORMACIÓN DE SEGURIDAD

5.1 CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a cualquiera de los componentes de NASONEX®. Niños menores de 2 años. Enfermedades micóticas, micobacterianas y virales no tratadas.

5.2 ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

NASONEX® debe usarse con precaución, si se utiliza, en pacientes con infecciones tuberculosas activas o latentes del tracto respiratorio, o en infecciones micóticas, bacterianas, virales sistémicas sin tratamiento o en herpes simple ocular.

Después de 12 meses de tratamiento con NASONEX® Spray nasal acuoso, no se ha observado evidencia de atrofia de la mucosa nasal; adicionalmente, el Furoato de Mometasona tiende a revertir la mucosa nasal alterada hacia un fenotipo histológico normal. Pacientes que usan NASONEX® Spray nasal acuoso durante varios meses o mayor tiempo, se deben examinar en busca de posibles cambios de la mucosa nasal, incluyendo el desarrollo de ulceraciones nasales. Si

NASONEX®
(Furoato de Mometasona)
SPRAY NASAL ACUOSO

LPI-OG0887-NS-082017

se desarrolla una infección micótica localizada en la nariz o faringe, se debe suspender el tratamiento con NASONEX® y se debe instaurar un tratamiento apropiado.

No existe evidencia de una supresión del eje hipotálamo-hipófisis-adrenal (HHA) después del tratamiento prolongado con NASONEX®. Sin embargo, los pacientes que se cambian de una terapia de administración a largo plazo con corticoesteroides activos sistémicamente a NASONEX® necesitan una vigilancia cuidadosa. El retiro de los corticoesteroides sistémicos en estos pacientes puede producir una insuficiencia adrenal. Si estos pacientes presentan signos y síntomas de insuficiencia adrenal o síntomas de abstinencia (por ejemplo, dolor articular y/o muscular, laxitud y depresión inicial), se deben adoptar medidas apropiadas.

Se debe advertir a los pacientes, que estén potencialmente inmunosuprimidos por la terapia de corticoesteroides, del riesgo de exposición a ciertas infecciones (por ejemplo, varicela, sarampión, etc.) y de la importancia de obtener un consejo médico si ocurre esta exposición.

Después del uso de corticoesteroides por vía intranasal, raramente se han reportado casos de perforación del tabique nasal, aumento de la presión intraocular y cataratas.

Los corticoesteroides pueden causar una disminución en la velocidad del crecimiento, cuando se administran a pacientes pediátricos, se debe monitorear continuamente el crecimiento de pacientes pediátricos que estén recibiendo NASONEX®. Para minimizar los efectos sistémicos de los corticoesteroides intranasales incluyendo NASONEX®, se debe valorar la dosis de cada paciente a la dosis más baja que controle efectivamente los síntomas.

La alteración visual puede ser reportada con uso sistémico y tópico (incluyendo, intranasal, inhalado e intraocular) de corticosteroides. Si un paciente presenta síntomas como visión borrosa u otras alteraciones visuales, se debe considerar al paciente para ser remitido a un oftalmólogo para evaluar posibles causas de trastornos visuales que pueden incluir cataratas, glaucoma o enfermedades raras como la coriorretinopatía serosa central (CSCR, por sus siglas en inglés) que han sido reportados después del uso de corticosteroides sistémicos y tópicos.

Debido al efecto inhibitorio de los corticoesteroides sobre la cicatrización de las heridas, los pacientes que han sido sometidos a cirugía nasal reciente o han presentado un trauma nasal, no deben usar corticoesteroides nasales hasta que se presente la cicatrización.

Rara vez, pueden ocurrir reacciones de hipersensibilidad inmediata después de la administración intranasal de furoato de mometasona monohidrato. Muy rara vez,

NASONEX®
(Furoato de Mometasona)
SPRAY NASAL ACUOSO

LPI-OG0887-NS-082017

se han reportado anafilaxis y angioedema por NASONEX®. Muy rara vez han sido reportadas alteraciones en el gusto y olfato.

Rinosinusitis Aguda

Si se observan signos o síntomas de infección bacteriana severa (como fiebre, dolor facial/dental severo, persistente, unilateral, edema orbitario o periorbitario o si los síntomas empeoran después de haber mejorado inicialmente), se debe aconsejar al paciente que consulte inmediatamente a su médico.

No ha sido estudiada la eficacia ni la seguridad de NASONEX®, en el tratamiento de los síntomas de rinosinusitis en niños menores de 12 años.

No ha sido estudiada la eficacia ni la seguridad de NASONEX®, en el tratamiento de la poliposis nasal en niños y adolescentes menores de 18 años.

5.3 INTERACCIONES FARMACOLOGICAS

NASONEX® administrado conjuntamente con loratadina no presenta efecto alguno sobre las concentraciones plasmáticas de loratadina o sus metabolitos principales. En estudios, las concentraciones plasmáticas del Furoato de Mometasona fueron indetectables, al emplear la valoración con un nivel mínimo detectable de 50 pg/mL. La combinación de la terapia fue bien tolerada.

Mometasona Furoato es metabolizada por CYP3A4

La coadministración con inhibidores potentes del CYP3A4 (por ejemplo, ketoconazol, itraconazol, claritromicina, ritonavir, productos que contienen cobicistat) puede conducir a un aumento de la exposición a los corticosteroides y, por lo tanto, al aumento del riesgo potencial de efectos secundarios de los corticosteroides sistémicos. Considere el beneficio de la coadministración versus el riesgo potencial de efectos sistémicos de corticosteroides, en cuyo caso los pacientes deben ser monitoreados por los efectos secundarios de los corticosteroides sistémicos.

5.4 EMBARAZO Y LACTANCIA

No existen estudios adecuados o bien controlados en mujeres embarazadas. Al igual que con las otras preparaciones de corticoesteroides nasales, sólo se debe usar NASONEX® en mujeres embarazadas o madres en período de lactancia si los beneficios potenciales justifican los riesgos potenciales para la madre, el feto o el lactante. Se deben examinar cuidadosamente los recién nacidos de madres que recibieron corticoesteroides durante el embarazo en busca de signos de hipoadrenalismo.

NASONEX®
(Furoato de Mometasona)
SPRAY NASAL ACUOSO

LPI-OG0887-NS-082017

5.5 EVENTOS ADVERSOS

Experiencia en Ensayos Clínicos

Rinitis alérgica estacional o perenne: Los eventos adversos locales, relacionados con el tratamiento, reportados en estudios clínicos incluyen: cefalea (8%), epistaxis (que consiste en sangrado franco, rinorrea mucosanguinolenta o trazas de sangre) (8%), faringitis (4%), ardor nasal (2%), irritación nasal (2%) y ulceración nasal (1%). Estos efectos se observan típicamente con el uso de corticoesteroides nasales en spray. La epistaxis fue en general autolimitada y leve, y ocurrió con mayor incidencia comparada con placebo (5%), pero tuvo una incidencia más baja o comparable a los corticoesteroides nasales de control (hasta el 15%).

La incidencia de todos los otros efectos fue comparable con los del placebo.

Poliposis Nasal: En pacientes tratados para poliposis nasal, la incidencia global de eventos adversos fue comparable a placebo y similar a la observada en pacientes con rinitis alérgica.

Rinosinusitis Aguda: En pacientes tratados para rinosinusitis aguda, la incidencia global de eventos adversos fue comparable a placebo y similar a la observada en pacientes con rinitis alérgica.

Experiencia post-mercado

La siguiente reacción adversa adicional se ha notificado en el uso posterior a la comercialización con NASONEX®: visión borrosa.

5.6 SOBREDOSIS

Debido a que la biodisponibilidad sistémica de NASONEX® es < 1% (con una sensibilidad de valoración de límite inferior 0.25 pg/mL), es improbable que ocurra una sobredosis que necesite cualquier terapia más que la observación, seguido de la iniciación de una dosis de prescripción apropiada.

6. DOSIS Y ADMINISTRACION

Después de la preparación inicial de la bomba de NASONEX® (10 activaciones hasta que se observe una atomización uniforme), cada activación suministra aproximadamente 100 mg de una suspensión de Furoato de Mometasona, equivalente a 50 µg de Furoato de Mometasona. Si no se ha usado la bomba durante 14 días o más, se debe preparar nuevamente con 2 activaciones hasta

NASONEX®
(Furoato de Mometasona)
SPRAY NASAL ACUOSO

LPI-OG0887-NS-082017

que se observe una atomización uniforme, antes de usarse la siguiente dosis. Agite el frasco bien antes de cada uso.

Rinitis alérgica estacional o perenne: Adultos (incluyendo pacientes geriátricos) y adolescentes: La dosis usual recomendada para el tratamiento y profilaxis es dos aplicaciones (50 µg /activación) en cada fosa nasal, una vez al día (dosis total de 200 µg /día). Una vez que se controlan los síntomas, para el tratamiento de mantenimiento puede ser efectiva una dosis de una aplicación en cada fosa nasal (dosis total de 100 µg).

Si no se controlan adecuadamente los síntomas, se puede aumentar la dosis diaria hasta máximo cuatro aplicaciones en cada fosa nasal (un total de 400 µg). Se recomienda la disminución de la dosis después de que se controlen los síntomas. El inicio de acción, clínicamente significativo, ocurre a las 7 horas posteriores a la primera dosis.

En pacientes que tienen una historia de síntomas de rinitis alérgica estacional de moderada a severa, se recomienda el tratamiento profiláctico con NASONEX® durante dos a cuatro semanas antes de que inicie la estación de polen.

Niños de 2 a 11 años de edad: La dosis usual recomendada para el tratamiento y profilaxis es una aplicación (50 µg/activación) en cada fosa nasal, una vez al día (dosis total de 100 µg/día). La dosis en niños debe ser administrada por un adulto.

Poliposis Nasal: Adultos (incluyendo pacientes geriátricos) y adolescentes de 18 años de edad y mayores: la dosis usual recomendada para poliposis es dos aplicaciones en cada fosa nasal (50 µg/activación), dos veces al día (dosis total de 400 µg/día). Una vez se han controlado adecuadamente los síntomas, una reducción a dos aplicaciones en cada fosa nasal (dosis total de 200 µg al día) es recomendada.

Rinosinusitis Aguda: Adultos (incluyendo pacientes geriátricos) y adolescentes de 12 años de edad y mayores: La dosis usual recomendada para la rinosinusitis aguda es dos aplicaciones (50 µg/activación) en cada fosa nasal dos veces al día (dosis total de 400 µg/día). Si los síntomas persisten durante el tratamiento, el paciente debe consultar con su médico.

Terapia coadyuvante en episodios agudos de sinusitis. Adultos (incluyendo pacientes geriátricos) y adolescentes de 12 años de edad y mayores: la dosis usual recomendada es dos aplicaciones en cada fosa nasal (50 µg/activación), dos veces al día (dosis total de 400 µg/día). Si no se controlan adecuadamente los síntomas, se puede aumentar la dosis hasta máximo cuatro aplicaciones (50 µg/activación) en cada fosa nasal, dos veces al día (dosis total de 800 µg).

NASONEX®
(Furoato de Mometasona)
SPRAY NASAL ACUOSO

LPI-OG0887-NS-082017

5. PRESENTACION

NASONEX® (Furoato de Mometasona/spray nasal acuoso):

Frasco de 18 g, con válvula dosificadora especial, que contiene suspensión acuosa de Furoato de Mometasona, para 140 aplicaciones, cada aplicación equivale a 50 µg.

Frasco de 10 g, con válvula dosificadora especial, que contiene suspensión acuosa de Furoato de Mometasona, para 60 aplicaciones, cada aplicación equivale a 50 µg.

Caja por 2 Frascos de 18 g c/u con válvula dosificadora especial, que contiene suspensión acuosa de Furoato de Mometasona para 280 aplicaciones, cada aplicación equivale a 50 µg.

(Reg. San No. INVIMA 2020M-006560-R2).

6. ALMACENAMIENTO

Almacenar a temperatura inferior a 30°C.

FECHA DE ACTUALIZACIÓN DEL TEXTO

Este texto fue revisado en Enero de 2023.