

ITRACONAZOL

DESCRIPCIÓN DEL PRODUCTO

Es un antifúngico triazólico sintético, emparentado químicamente con el ketoconazol, pero produce menos efectos indeseables. Es una molécula activa contra dermatofitos, cándida, histoplasma y otras especies de hongos; pero frente a *Aspergillus* es más activo que el ketoconazol y fluconazol.

COMPOSICIÓN

Itraconazol pellets, cada cápsula contiene 100 mg de Itraconazol base

FARMACODINÁMICA

Itraconazol al igual que otros antifúngicos, altera la estructura de la membrana celular del hongo. Mediante la inhibición de la enzima 14 alfa desmetilasa, impide la formación de ergosterol a partir de lanosterol y siendo el ergosterol un componente esencial de la membrana del hongo, un déficit del mismo provoca un aumento de la permeabilidad de la membrana, con pérdida del contenido intracelular. Asimismo, se conoce que los antifúngicos triazólicos tienen interacciones con los fosfolípidos de la membrana del hongo e inhibe la formación de micelas. No afecta a las enzimas humanas involucradas en la biosíntesis de colesterol.

INDICACIONES Y USO

Itraconazol está indicado en: Tratamiento de Aspergilosis en pacientes intolerantes o refractarios a la Anfotericina B. Tratamiento de blastomicosis pulmonar o extrapulmonar. Tratamiento de coccidiomicosis diseminada. Tratamiento de meningitis criptocócica en pacientes con sida. Tratamiento de histoplasmosis pulmonar sintomática grave. Tratamiento de histoplasmosis pulmonar crónica. Tratamiento de histoplasmosis diseminada en pacientes con sida. Tratamiento de onicomicosis debida a dermatofitos. Tratamiento de esporotricosis cutánea o sistémica. Tratamiento de otras micosis superficiales o sistémicas (queratitis fúngica, tinea capitis, tinea corporis, tinea cruris, tinea manuum, tinea pedis, etc.). Tratamiento de candidiasis esofágica u orofaríngea. Profilaxis de infecciones recurrentes de candidiasis en pacientes infectados por VIH. Profilaxis de histoplasmosis primaria en pacientes infectados con VIH

ADMINISTRACIÓN Y DOSIS RECOMENDADAS

Tratamiento de Aspergilosis en pacientes intolerantes o refractarios a la Anfotericina B: En adultos se recomienda administrar 200 – 400 mg diarios y en casos de infecciones potencialmente fatales se recomienda una dosis de 200 mg tres veces al día por 3 días. El tratamiento será por un tiempo mínimo de 3 meses o hasta que los exámenes de laboratorio demuestren la erradicación de los microorganismos. En niños de 3 a 16 años, 100 mg diarios en el tratamiento de micosis sistémica.

Tratamiento de blastomicosis pulmonar o extrapulmonar: En adultos se recomienda 200 – 400 mg en una sola dosis. En adolescentes y niños de 3 a 16 años, 100 mg en una sola dosis.

Tratamiento de coccidiomicosis diseminada: En adultos se

recomienda una dosis de 200 mg dos veces al día.

Tratamiento de meningitis criptocócica en pacientes con sida: En adultos se suele utilizar 600 mg diarios durante 3 días, seguido de 200 mg dos veces al día por 8 semanas.

Tratamiento de histoplasmosis pulmonar sintomática grave: En adultos se administra 200 – 400 mg una vez al día, durante 3 a 6 semanas; en infecciones graves se recomienda una dosis de 200 mg tres veces al día durante los 3 primeros días y luego dosis sucesivas de 200 – 400 mg / día.

Tratamiento de histoplasmosis pulmonar crónica: En adultos 200 – 400 mg / día durante 6 a 12 meses.

Tratamiento de histoplasmosis diseminada en pacientes con sida: En adultos 300 mg dos veces al día durante 3 días, seguido de 200 mg dos veces al día durante 12 semanas.

Tratamiento de onicomicosis debida a dermatofitos: En adultos 200 mg dos veces al día, seguido de un tiempo de descanso sin medicación de 3 semanas y luego una semana adicional con 200 mg dos veces al día. En caso de estar afectadas las uñas de las manos y los pies, se recomienda administrar 200 mg una vez al día durante 12 semanas. En adolescentes y niños se han utilizado dosis de 5 mg /kg/día en una sola dosis diaria durante una semana, seguida de 3 semanas de descanso, durante un total de 3 a 5 meses.

FARMACOCINÉTICA

Después de la administración oral en forma de cápsulas, la absorción del medicamento requiere de un medio ácido y la biodisponibilidad del Itraconazol, va a diferir si se administra con estómago vacío o lleno; si se administra con estómago vacío, la biodisponibilidad es del 40 al 55 %, pero si es administrado con estómago lleno o con una bebida de cola, la biodisponibilidad puede ser del 90 al 100 %; por esta razón se recomienda administrar las cápsulas de itraconazol junto con los alimentos. Luego de la absorción intestinal, el itraconazol se distribuye en forma amplia, pero especialmente a nivel de tejidos lipofílicos; se acumula a nivel del estrato córneo de la piel, especialmente después de la administración de varias dosis. Tiene una vida media de aproximadamente 21 horas, se une a las proteínas plasmáticas en un 99.8 % y es eliminado por la leche materna. El Itraconazol es metabolizado extensamente en el hígado a nivel de CYP3A4 y se han detectado numerosos metabolitos, pero el más importante es el hidroxiiitraconazol, el cual muestra actividad fungicida. Un 3 al 18 % de medicamento inalterado es eliminado por las heces y en alrededor del 0.03 % por la orina; sin embargo, alrededor de un 40 % de metabolitos inactivos se eliminan por la orina.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al itraconazol y cualquiera de los componentes del producto. Administración concomitante con terfenadina, astemizol, cisaprida, triazolam y midazolam. No se debe utilizar Itraconazol para el tratamiento de onicomicosis en pacientes con evidencia de disfunción ventricular, como insuficiencia cardiaca congestiva.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

INFORMACIÓN PARA PRESCRIBIR

El Itraconazol debe ser usado con precaución en pacientes con enfermedades hepáticas, por lo tanto, los pacientes con enfermedades hepáticas previas deben ser monitorizados durante el tratamiento con Itraconazol. Se debe utilizar con precaución en pacientes con hipersensibilidad a los antifúngicos imidazólicos, ya que puede producirse una hipersensibilidad cruzada entre el itraconazol, ketoconazol, fluconazol, miconazol o clotrimazol.

Embarazo: Itraconazol pertenece a la categoría C; se han comprobado efectos teratogénicos en animales de experimentación, con malformación esquelética en los fetos, encefalocele y macroglosia. El uso de itraconazol en el tratamiento sistémico de infecciones micóticas durante el embarazo, solo está indicado si los beneficios para la madre superan los posibles riesgos para el feto y no se debe utilizar este medicamento para el tratamiento de onicomicosis durante el embarazo. **Lactancia:** debido a que Itraconazol se elimina a través de la leche materna, el uso del medicamento en madres en periodo de lactancia, dependerá de un análisis riesgo-beneficio. **Pediatría:** no se ha establecido la seguridad del itraconazol en menores de 16 años. **Geriatría:** no se han detectado diferencias significativas con adultos de menor edad.

INTERACCIONES

La administración concomitante de Itraconazol y algunos medicamentos que utilizan para su metabolismo a la enzima CYP3A4, puede provocar incremento en la concentración plasmática de estos medicamentos, lo cual podría producir efectos adversos graves e inclusive mortales; entre los medicamentos que están contraindicados son: cisaprida, midazolam, nisoldipina, felodipina, primozida, quinidina, dofetilida, triazolam, metadona y levacetilmetadol. Asimismo, los inhibidores de la HMG-CoA reductasa que son metabolizados en la enzima CYP3A4, como la atorvastatina, lovastatina y simvastatina, también están contraindicados. Los alcaloides de la ergotamina, como la dihidroergotamina, ergometrina (ergonovina), ergotamina y meti ergometrina (metilergonovina) están contraindicados.

EFFECTOS INDESEABLES

El efecto indeseable que más frecuentemente se ha reportado es la náusea; con menor frecuencia suelen presentarse otros efectos secundarios, como: vómito, diarrea, dolor abdominal e hipokalemia. En algunas ocasiones se han reportado alteraciones dermatológicas como rash inespecífico, que suele presentarse sobre todo en pacientes inmunodeprimidos, además de prurito, urticaria y Síndrome Steven-Johnson. Otros efectos indeseables son: mareo, cefalea, angioedema, en algunos casos anafilaxia, fatiga e hipertensión. En raras ocasiones se han presentado, alopecia, hipertrigliceridemia, neutropenia y neuropatías, elevación de las enzimas hepáticas, hepatotoxicidad y hepatitis reversible, especialmente en pacientes tratados con varios fármacos.

PRESENTACIÓN COMERCIAL

Itraconazol de 100 mg, caja por 14 cápsulas



Cápsulas de 100 mg

