

ITRACONAZOL 100 MG

CÁPSULAS



COMPOSICIÓN:

Cada cápsula de gelatina dura contiene:

Itraconazol BP 100 mg.

VIA DE ADMINISTRACION

Oral.

PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: antimicóticos para uso sistémico.

Código ATC: J02AC.02 3.1.

Farmacodinamia

El itraconazol es un antimicótico triazol-derivado sintético con actividad fungistática. Aunque no se conoce con precisión su mecanismo de acción, se postula que en organismos susceptibles inhibe la enzima (esterol-14-alfa-desmetilasa) que convierte al lanosterol en ergosterol, constituyente esencial de la pared celular del hongo.

Dicha interferencia da lugar a una estructura inestable y altamente permeable que permite la salida o pérdida de elementos intracelulares vitales (como aminoácidos y potasio) e impide la entrada o captación de precursores de ADN, lo que compromete el metabolismo, crecimiento y multiplicación del patógeno.

El itraconazol ha demostrado actividad in vitro e in vivo frente a microorganismos como: *Aspergillus* spp. (*A. flavus*, *A. fumigatus*, *A. niger* y *A. terreus*), *Blastomyces dermatitidis*, *Candida* spp. (*C. albicans*, *C. krusei*, *C. parapsilosis* y *C. tropicalis*), *Cladosporium* spp., *Coccidioides immitis*, *Coccidioides posadasii*, *Cryptococcus neoformans*, *Cryptococcus gattii*, *Epidermophyton floccosum*, *Fonsecaea* spp., *Histoplasma capsulatum*, *Histoplasma duboisii*, *Microsporum* spp., *Paracoccidioides brasiliensis*, *Penicillium marneffeii*, *Sporothrix schenckii*, *Trichophyton mentagrophytes* y *Trichophyton rubrum*.

Farmacocinética

Administración por vía oral el itraconazol se absorbe en el tracto gastrointestinal y genera concentraciones séricas pico en 2-5 horas.

Su biodisponibilidad es máxima (55%) cuando se administra junto con las comidas. Se une a proteínas en un 99,8% y se distribuye ampliamente al organismo (Vd: >700 L) alcanzando en algunos tejidos como: pulmón, riñón, hígado, hueso, estómago, bazo y músculo, concentraciones 2 o 3 veces superiores a las plasmáticas. En piel pueden ser hasta 4 veces mayores.

Se excreta en la leche materna y (en animales de experimentación) atraviesa la placenta. Se metaboliza extensamente en el hígado mediante CYP3A4 dando lugar a productos diversos, de los cuales el más abundante (hidroxi-itraconazol) exhibe una actividad antifúngica similar a la de la molécula original y alcanza niveles séricos 2 veces más elevados.

Los demás metabolitos son inactivos. Un 35% de la dosis administrada es excretada como metabolitos inactivos en la orina (junto a 0,03% de itraconazol inalterado) y alrededor de un 54% con las heces (junto a un 3 - 18% de itraconazol intacto). Su vida media es de 64 horas y la del metabolito activo (hidroxi-itraconazol).

Información preclínica sobre seguridad

El itraconazol no resultó carcinogénico en ratones expuestos por 23 meses a dosis orales 10 veces superiores a las usadas en humanos. Sin embargo, en ratas machos con dosis 3 veces superiores a las usadas en humanos se registró un ligero incremento en la incidencia de sarcomas de tejido blando.

Se presume, no obstante, que dicha anomalía pudo ser debida al hipercolesterolemia resultante de la administración crónica del fármaco, que constituye una respuesta característica en las ratas, pero no en caninos ni en humanos. En otro estudio, la administración a ratas hembras de dosis

6.25 veces superiores a las usadas en humanos produjo un incremento, aunque no estadísticamente significativo, en la incidencia de carcinoma de células escamosas en pulmón. Los ensayos de mutagenicidad in vitro e in vivo realizados resultaron negativos. Los estudios de reproducción revelaron teratogenicidad en ratas (malformaciones esqueléticas) con dosis de itraconazol 5-20 veces superiores a las usadas en humanos y en ratones (encefalocele y macroglosia) con dosis 10 veces superiores.

Aunque no se evidenciaron alteraciones de la fertilidad en ratas hembras y machos con dosis 5 veces superiores a las usadas en humanos, al cuadruplicar la dosis hubo toxicidad materna, incluyendo muerte de los animales.

INDICACIONES

Tratamiento de las Dermatofitosis cutáneas: tiña corporis, tiña cruris, tiña pedis y tiña manum. Tratamiento de las pitiriasis versicolor. Tratamiento de las candidiasis vulvovaginal.

POSOLOGIA

Dosis Adultos y niños mayores de 12 años: dermatofitosis: - Tinea corporis y Tinea cruris: 100 mg 1 vez/día por 15 días. - Tinea manus y Tinea pedis: 100 mg 1 vez/día por 30 días. Pitiriasis versicolor: 200 mg 1 vez/día por 7 días. Candidiasis vulvovaginal: 200 mg 2 veces/día por 1 día. Dosis máxima diaria 400 mg/día. 5.3. Dosis en pacientes especiales Insuficiencia renal: No se ha descrito la necesidad de ajustar la dosis. Insuficiencia hepática: No se ha descrito la necesidad de ajustar la dosis. Edad avanzada (≥ 65 años): No se ha descrito la necesidad de ajustar la dosificación.

Modo de empleo o forma de administración: administrar por vía oral con agua, junto con las comidas y a las mismas horas del día durante todo el tratamiento.

REACCIONES ADVERSAS

Trastornos del sistema sanguíneo y linfático. Raras: leucopenia.

Frecuencia no conocida: neutropenia, trombocitopenia.

Trastornos gastrointestinales. Frecuentes: dolor abdominal, náuseas.

Poco frecuentes: vómitos, diarrea, gastritis, constipación, dispepsia, disgeusia, anorexia, flatulencia. Raras: Anorexia, pancreatitis.

Trastornos hepato biliares. Poco frecuentes: hiperbilirrubinemia, incrementos de transaminasas. Raras: aumento de las enzimas hepáticas. Frecuencia no conocida: Disfunción hepática, hepatitis, falla hepática aguda.

Trastornos del metabolismo y de la nutrición. Frecuencia no conocida: hipopotasemia, hipertrigliceridemia.

Trastornos renales y urinarios. Raras: polaquiuria. Frecuencia no conocida: Incontinencia urinaria.

Trastornos cardiovasculares. Poco frecuentes: edema. Raras: Hipertensión. Frecuencia no conocida: Insuficiencia cardíaca congestiva.

Trastornos del sistema nervioso. Poco frecuentes: cefalea, mareos, parestesia. Raras: hipoestesia, somnolencia, depresión. Frecuencia no conocida: neuropatía periférica.

Trastornos respiratorios. Raras: disnea. Frecuencia no conocida: rinitis, edema pulmonar, sinusitis, infección del tracto respiratorio superior.

Trastornos músculo-esqueléticos. Frecuencia no conocida: mialgia, artralgia.

Trastornos del sistema inmunológico. Poco frecuentes: hipersensibilidad. Frecuencia no conocida: reacciones anafilácticas, angioedema, enfermedad del suero.

Trastornos generales: Poco frecuentes: fatiga. Raras: fiebre.

INTERACCIONES

Con medicamentos, alimentos y bebidas Dado que el Itraconazol inhibe selectivamente a la isoenzima CYP3A4 del citocromo P-450, podría incrementar los niveles séricos y el consecuente riesgo de toxicidad de medicamentos cuyo metabolismo depende de esta enzima, entre los cuales cabe mencionar: antiarrítmicos (como: Quinidina y Disopiramida), antineoplásicos (como: alcaloides de la vinca y Busulfán), alcaloides del ergot (como: Ergotamina y Dihidroergotamina), benzodiazepinas (como: Alprazolam, Midazolam y Triazolam), bloqueantes de los canales de

calcio (como: Nifedipina y Verapamilo), glucocorticoides (como: Budesonida, Dexametasona y Metilprednisolona), hipoglicemiantes orales, inhibidores de la enzima HMG-CoA reductasa (como: Atorvastatina, Simvastatina y Lovastatina), inhibidores de la fosfodiesterasa-5 (como: Sildenafil, Vardenafilo y Tadalafilo), inhibidores de la proteasa del VIH (como: Indinavir, Ritonavir y Saquinavir), inmunosupresores (como: Ciclosporina, Tacrolimus y Sirolimus) y otros agentes también sustratos de la CYP3A4 (como: Alfentanilo, Astemizol, Buspirona, Carbamazepina, Cilostazol, Cisaprida, Fentanilo y Rifabutina).

**Pacientes menores de 18 años, a menos que el médico lo indique.
CON PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA**

Fabricado y envasado por:

GRACIOUS PHARMACEUTICALS PVT.LTD.

Plot No. 106 & 106, Sector-6A, IIE, SIDCUL. Haridwar-249403 (U.K) INDIA.

Exportado por:

PRAJ LIFESCIENCE LLP

DG 06, Gold City, Plot No. 11, Sector 19D, Vashi, Navi Mumbai: 400 703, INDIA.

Importado y distribuido por:

CASA DE REPRESENTACIÓN PHARMA COLINA C.A.

Anzoátegui - Venezuela.

RIF: J-50021699-8

Registro Nro. C/R-982

www.pharmacolina.com/

Permiso sanitario de importación Nro. 00003238