

Ficha técnica de producto

Itraconazol

Descripción del producto:

Fórmula Molecular	C ₃₅ H ₃₈ Cl ₂ N ₈ O ₄
Peso molecular	705.6
Número CAS	84625-61-6

Datos Físico-Químicos:

Un polvo blanco o casi blanco.

Prácticamente insoluble en agua; muy ligeramente soluble en alcohol; fácilmente soluble en diclorometano; escasamente soluble en tetrahidrofurano.

Punto de fusión: 165-169 °C

Composición y/o INCI

Sustancia pura.

Propiedades.

Calidad	Cumple Farmacopea Europea
Uso	Farmacéutico

Indicaciones:

Acción antifúngica.

El itraconazol ejerce su efecto alterando la membrana celular del hongo. El itraconazol inhibe la síntesis del ergosterol interaccionando con la 14-alfa-desmetilasa, una enzima del citocromo P450 que es necesaria para la conversión del lanosterol a ergosterol, deteriorando la síntesis de ergosterol de la membrana celular de los hongos. Tiene un espectro de actividad ligeramente más amplio que el ketoconazol.

Es activo contra *Aspergillus* spp., *Blastomyces dermatitidis*, *Candida* spp., *Coccidioides immitis*, *Cryptococcus neoformans*, *Epidermophyton* spp., *Histoplasma capsulatum*, *Malassezia furfur*, *Microsporium* spp., *Paracoccidioides brasiliensis*, *Sporothrix schenckii* y *Trichophyton* spp.

El Itraconazol también tiene cierta actividad antiprotozoaria contra *Leishmania* spp.

Dosificación:

Vía oral en cápsulas o suspensión.

La dosis en candidiasis orofaríngea es de 100 mg (o 200 mg en pacientes con SIDA o neutropenia) al día durante 15 días.

La candidiasis vulvovaginal puede tratarse con itraconazol 200 mg dos veces al día durante 1 día.

La pitiriasis versicolor puede tratarse con itraconazol 200 mg al día durante 7 días.

Para dermatofitosis, la dosis es 100 mg al día durante 15 días o 200 mg al día durante 7 días en *Tinea corporis* o *Tinea cruris*. Las dosis son 100 mg al día durante 30 días o 200 mg dos veces al día durante 7 días en *tiña pedis* o *tiña manuum*.

Para infecciones de las uñas, la dosis es 200 mg diarios durante 3 meses o terapia de pulso con 200 mg dos veces al día durante 7 días, repetido una vez (para las uñas de las manos) o dos veces (para las uñas de los pies) después de intervalos sin medicamento de 21 días.

Para infecciones sistémicas, se administran cápsulas de itraconazol en dosis habituales de 100 a 200 mg una vez al día, aumentadas a 200 mg dos veces al día para infecciones invasivas o diseminadas, incluida la meningitis criptocócica. En infecciones potencialmente mortales, una dosis de carga de 200 mg, administrada tres veces al día durante 3 días. Se utiliza una dosis de 200 mg al día para profilaxis primaria o secundaria en pacientes

neutropénicos o con SIDA. La absorción puede verse alterada en estos pacientes y se recomienda el seguimiento de las concentraciones plasmáticas y aumentar la dosis a 200 mg dos veces al día si es necesario.

Efectos secundarios:

Los efectos adversos más comunes asociados con itraconazol incluyen dispepsia, dolor abdominal, náuseas, vómitos, estreñimiento, diarrea, dolor de cabeza y mareos. Otros efectos incluyen reacciones alérgicas como prurito, erupción cutánea, urticaria y angioedema.

Se han reportado casos aislados del síndrome de Stevens-Johnson asociados con itraconazol. También se ha observado un aumento en los valores de enzimas hepáticas en algunos pacientes, así como casos de hepatitis e ictericia colestásica, especialmente en aquellos tratados durante más de un mes. Ha habido casos raros de insuficiencia hepática y muerte.

Raramente, se han informado casos de insuficiencia cardíaca y edema pulmonar. También se han reportado eventos cardiovasculares graves, como arritmias y muerte súbita, asociada a interacciones medicamentosas en pacientes que reciben itraconazol.

Otros efectos descritos incluyen alopecia, edema e hipopotasemia asociados con el uso prolongado. En algunos pacientes, se han informado desórdenes menstruales y neuropatía periférica.

Precauciones:

Itraconazol está contraindicado en el embarazo.

Se debe evitar el itraconazol en pacientes con problemas hepáticos.

Se debe controlar la función hepática si el tratamiento dura más de un mes o si hay síntomas sugestivos de hepatitis. El tratamiento debe ser suspendido si se detecta una función hepática anormal.

Las concentraciones plasmáticas de itraconazol se deben controlar en pacientes con enfermedad hepática activa y ajustar la dosis si es necesario.

También pueden ser necesarios ajustes de dosis en algunos pacientes con insuficiencia renal.

Se debe suspender el itraconazol si se desarrolla neuropatía.

El Itraconazol no debe usarse para el tratamiento de infecciones fúngicas menos graves, como la onicomycosis en pacientes con evidencia o antecedentes de disfunción ventricular como la insuficiencia cardíaca.

En la hipoclorhidria, presente en pacientes con SIDA, puede reducir la absorción de itraconazol. En este caso, la absorción puede mejorarse administrando itraconazol con una bebida ácida, como una bebida de cola.

Interacciones:

Los medicamentos que reducen la acidez del estómago, como antimuscarínicos, antiácidos, inhibidores de la bomba de protones y antagonistas de los receptores H₂, pueden reducir la absorción de itraconazol. Al igual que otros antifúngicos triazoles, el itraconazol es un potente inhibidor del citocromo P450 isoenzima CYP3A4, aumentando la concentración plasmática de otros medicamentos que dependen de esta enzima, lo que incrementa el riesgo de efectos adversos.

Cuando los fármacos metabolizados a través de CYP3A4 también prolongan el intervalo QT, hay riesgo de efectos cardiovasculares graves como torsades de pointes. Estas combinaciones deberían evitarse; incluyen astemizol, cisaprida, dofetilida, levacetilmetadol, pimozida, quinidina, sertindol y terfenadina. Se debe tener cuidado con los bloqueadores de los canales de calcio debido al riesgo de insuficiencia cardíaca congestiva, siendo nisoldipina particularmente contraindicado. El uso de itraconazol con estatinas también debe evitarse debido al riesgo de daño muscular.

Condiciones de conservación:

Conservar a temperatura ambiente (25±2°C), en un lugar fresco y seco, alejado de la luz solar, en un recipiente bien cerrado. Proteger de la luz.

Ejemplos de formulación:

Formulaciones más habituales:

Itraconazol suspensión oral 20mg/ml

Itraconazol.....2g

Excipiente acofar suspensión oral.....50ml

Excipiente acofar jarabe.....c.s.p100ml

Modus operandi:

mezclar 50% de Excipiente Acofar Jarbe o Jarabe sin azúcar y un 50% de Excipiente Acofar Suspensión Oral (donde se dispensará el Itraconazol).

Caducidad: 2 meses

Conservación: en recipiente bien cerrado. Proteger de la luz. Conservar en nevera.

Bibliografía: *International Journal of Pharmaceutical Compounding, INC. (2024).*

Bibliografía:

- *Martindale, Guía completa de consulta farmacoterapéutica, 1ª ed. (2003).*
- *The Merck Index, 13ª ed. (2001).*
- *Monografías de la SEFH.*
- *Trissel's Stability of Compounded Formulations (5th edition). Lawrence A. Trissel.*
- *International Journal of Pharmaceutical Compounding, INC. (2024).*
- *Documentación técnica proveedores.*

Última actualización: 08/2024