



ZOOVET.
● ○ ●

ITRACONAZOL COMPRIMIDOS

ELABORADO BAJO NORMAS GMP

Itraconazol 100 mg

ITRACONAZOL ZOOVET

PRESENTACIÓN DEL PRINCIPIO ACTIVO

El Itraconazol, químicamente es un derivado triazólico de última generación, utilizado en medicina por sus excelentes propiedades anti fúngicas **locales, sistémicas, superficiales y profundas**.



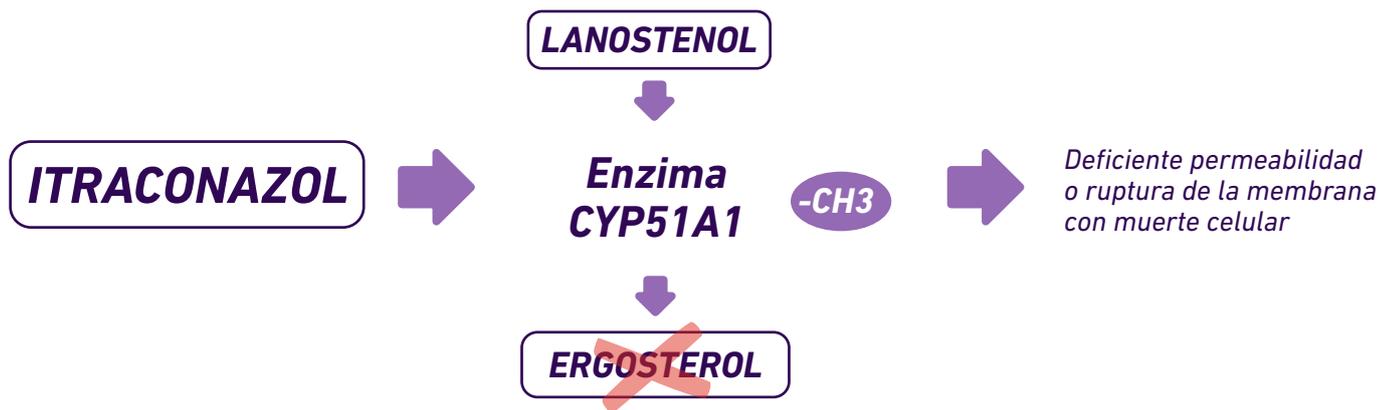
MECANISMO DE ACCIÓN (FARMACODINAMIA)

LA PRIMERA CLAVE DE LA EFICACIA

• Los hongos se caracterizan por tener en su estructura de la pared celular el ergosterol, similar al colesterol, y que se obtiene por la desmetilación del lanosterol. Esta reacción está catalizada por la enzima CYP51A1, específica de los hongos y ausente en los seres superiores como los mamíferos. El Itraconazol inhibe la enzima impidiendo la formación de este sillar de la pared fúngica. Este hecho produce una permeabilidad alterada de la membrana celular, con escape de los

contenidos celulares y deterioro en la captación de los precursores purina y pirimidina. Otros autores también informan que por el mismo proceso ocurre acumulación intracelular de agua oxigenada en los hongos.

• También se lo considera inhibidor de la glucoproteína P (GpP1), que es una glucoproteína del ácido nucleico de algunas especies de hongos tales como *Candida albicans*.



MEJOR TOLERANCIA EN MAMÍFEROS SUPERIORES

Las células de mamíferos superiores presentan colesterol en su pared celular, pero no contienen ergosterol, eso determina una menor toxicidad del Itraconazol sobre estos seres.

FÓRMULA

Cada comprimido ranurado contiene:
Itraconazol 100 mg; Excipientes c.s.p. 200 mg.

DIFERENCIA Y VENTAJA EN REFERENCIA A LOS OTROS DERIVADOS AZÓLICOS

La selectividad de la inhibición antes mencionada está determinada por el alto grado de lipofilia del extremo azólico que posee esta molécula en especial, lo que origina enlaces fármaco-citocromo muy estables únicamente en hongos. Esto explica la mayor especificidad de acción sobre hongos y mayor eficacia antimicótica de este fármaco.

co comparado con otros antimicóticos azólicos (ketoconazol y fluconazol). Este hecho que caracteriza la molécula hace que el Itraconazol tenga una menor generación de reacciones colaterales y por tanto lo hace más seguro y confiable a la hora de la elección como terapia combinada con Anfotericina.

¿CÓMO SE DISTRIBUYE? (FARMACOCINÉTICA) LA SEGUNDA CLAVE DE LA EFICACIA

Itraconazol Zoovet es muy efectivo por vía oral. Por ser una base débil se absorbe excelentemente bien (casi en un 100 %) por el pH bajo del estómago, sobre todo durante la administración de la dieta. A través de una gran afinidad a las proteínas séricas (99 %) se distribuye por todo el organismo, especialmente en tejidos ricos en grasas. Esto se debe a la lipofilia antes mencionada, por lo cual se observan muy altas concentraciones en piel, sebo, aparato reproductor femenino y pus. A pesar de que no se observan buenas concentraciones

en líquido cefalorraquídeo, orina, humor acuoso, y saliva, se puede tener éxito en el tratamiento de micosis de SNC, ojo y próstata. Una vez que se estabilizan los niveles plasmáticos, posee una vida muy prolongada, lo que asegura una uniformidad terapéutica en los humores séricos, contribuyendo también a una mayor eficacia. Se metaboliza en hígado y algunos de los metabolitos también tienen actividad antifúngica. Se elimina un 98 % por saturación en bilis y el resto por orina.

ITRACONAZOL COMPRIMIDOS

COMPARATIVO CON OTRO ANTIMICÓTICO

ÍTEM EVALUADO	KETOCONAZOL	ITRACONAZOL
Dosis bibliográfica sugerida en caninos (1)	5-20 mg /kg de peso	5-10 mg /kg de peso
Dosis bibliográfica sugerida en felinos (1)	5-10 mg /kg de peso	5-10 mg /kg de peso
Tiempo de interdosis en caninos y felinos (1)	12 hs	24 s
Reacciones colaterales	Algunas	Mínimas
Eficacia comparativa a triazoles (2)	Menor	Buena (es un triazol)
Vida media comparada a triazoles bajo trat.(2)	Menor	Prolongada
Vida media (4)	2,7 hs	21-64 hs
Eficacia en micosis dérmicas y ungulares (5)	Normal	Superior
Toxicidad comparativa (3)	Puede desencadenar toxicidad hepática y renal	Raras presentaciones de toxicidad
Distribución en tejidos blandos	Igual a plasma	3 veces la plasmática

(1) Madison, Jill; Page, Steven; Church, David. Farmacología Clínica en Pequeños Animales; Intermédica Argentina 2011. (2) Antimicótico triazólicos: Itraconazol y Fluconazol. (3) Jansen Cilag. (4) Plumb, Donald; Manual de farmacología veterinaria. Intermédica Argentina 2006. (5) Ver intervalo entre dosis.

TRATAMIENTO POR PULSOS

Administrar 2 días consecutivos, suspender por 5 días.

Repetir el tratamiento durante no menos de 4 semanas, o hasta la remisión del cuadro.



SEGURIDAD EN EL TRATAMIENTO

Se trata de un medicamento seguro en referencia al índice tóxico terapéutico.

VÍA Y ESPECIE	DOSIS LETAL 50	DOSIS TERAPÉUTICA
Oral rata	320 mg/Kg de peso	5-10 mg/kg de peso
Oral ratón	320 mg/Kg de peso	5-10 mg/kg de peso
Oral cobayo	160 mg/kg de peso	5-10 mg/kg de peso

DERMATOMICOSIS (TIÑAS) EN CANINOS Y FELINOS (MICROSPORUM TRICOPHYTON)



- Efecto más prolongado
- Menor dosis
- Menos tóxico
- Mayor intervalo entre dosis

INDICACIONES

Está indicado en micosis superficiales y profundas. Se emplea en el tratamiento de infecciones por hongos que afectan los pulmones, las uñas, boca, garganta, tiñas causadas por dermatofitos, enfermedades sistémicas.

Como profiláctico en pacientes inmunodeprimidos.

ESPECIES SUSCEPTIBLES

Su espectro implica:

Microsporum canis (90 % de las micosis cutáneas)

Trichophyton mentagrophytes

Microsporum gypseum

De elección en Blastomicosis canina y felina (*Blastomyces spp*) y la histoplasmosis felina (*Histoplasma spp*).

Muy eficaz contra *Candida albicans* y *Cryptococcus spp*.

Posee actividad contra *Aspergillus spp*.

Otros géneros en los que se puede utilizar con éxito son: *Malassezia*, *Coccidioides*.

DOSIS

1 comprimido cada 10 a 20 kg p.v. (Equivalentes a 5 a 10 mg/kg de Itraconazol).

Intervalo entre dosis y duración del tratamiento: Se administra cada 24 horas. Se puede dividir la dosis diaria en 2 tomas.

La duración es muy variable dependiendo del tratamiento de la etiología de la micosis a tratar, por eso es que requiere del criterio del profesional actuante.

Protocolo para infecciones por *Malassezia dérmica*: **Administrar 2 días consecutivos, suspender por 5 días. Repetir el tratamiento durante no menos de 4 semanas, o hasta la remisión del cuadro.** (Tratamiento por pulsos)

ESPECIES DE DESTINO TERAPÉUTICO

Caninos y felinos.



CONTRAINDICACIONES Y ADVERTENCIAS

No administrar en animales hipersensibles al principio activo o a otros azoles.

No utilizar en hembras en gestación o lactancia.

No utilizar conjuntamente con antiácidos.

No utilizar en pacientes con insuficiencia hepática.

RECOMENDACIONES

Se recomienda que el fármaco se tome con la dieta, en cuya situación se absorbe un 30% más.

Se pueden usar dosis de ataque de 10 mg/Kg de peso hasta estabilizar la concentración plasmática lo cual se logra en unos 4 a 6 días, y luego reducir a 5 mg/Kg de peso.

En el caso de uso en cachorros, se deberá llevar un control clínico.

PRESENTACIÓN

10 comprimidos de 100 mg de principio activo, monoranurados en flow pack. Cajas genéricas por 30 flow packs y caja individual con 1 flow pack.