



RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	LOZARTIL® (Intraconazol)
Forma farmacéutica:	Cápsula
Fortaleza:	10 mg
Presentación:	Estuche por 3 blísteres de PVC color verde/AL con 5 cápsulas cada uno.
Titular del Registro Sanitario, país:	NOVAG INFANCIA, S.A. DE C.V., Ciudad de México, México.
Fabricante, país:	NOVAG INFANCIA, S.A. DE C.V., Ciudad de México, México.
Número de Registro Sanitario:	034-19D3
Fecha de Inscripción:	25 de abril 2019
Composición:	
Cada cápsula contiene:	
Intraconazol	100,0 mg
Sacarosa	234,0 mg
Plazo de validez:	24 meses.
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30° C. Protéjase de la luz y la humedad.

Indicaciones terapéuticas:

Esquemas fijos de tratamiento: itraconazol está indicado en dermatomicosis (dermatofitosis, candidiasis superficial), onicomicosis, pitiriasis versicolor, queratitis micótica y candidiasis oral.

Contraindicaciones:

Itraconazol está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad conocida al compuesto o a sus excipientes. Itraconazol cápsulas sólo deberá administrarse a mujeres embarazadas en los casos en que la vida está en peligro y en aquellos en que el beneficio potencial es mayor que el daño potencial al feto. Se deben tomar las adecuadas medidas anticonceptivas para las mujeres con potencial de concebir y tomen itraconazol cápsulas hasta el siguiente

periodo menstrual después de finalizar la terapia. Está contraindicada la administración de itraconazol cápsulas con los siguientes medicamentos: terfenadina, astemizol, quinidina, cisaprida, pimozide, inhibidores de la HMG-CoA reductasa metabolizada por el CYP3A4 como simvastatina y lovastatina, triazolam y midazolam oral.

Precauciones.

Uso durante el embarazo y la lactancia: itraconazol tiene un potencial para interacciones medicamentosas importantes clínicamente.

Disminución en la acidez gástrica: La absorción de itraconazol cápsulas se altera cuando la acidez gástrica es disminuida. En pacientes que también reciben medicamentos para reducir la acidez (por ejemplo, hidróxido de aluminio) éste debe ser administrado por lo menos 2 horas antes de la administración. En pacientes con aclorhidria, como ciertos pacientes con SIDA y pacientes con supresores de la secreción ácida (por ejemplo, antagonistas H₂, inhibidores de la bomba de protones) es aconsejable administrar itraconazol cápsulas con bebidas de cola.

Uso pediátrico: debido a que los datos clínicos del uso de itraconazol en pacientes pediátricos es limitada, itraconazol no debe ser utilizado en estos pacientes; no ha sido estudiado en niños, por lo tanto, deberá evitarse el uso en pacientes pediátricos, a menos que los beneficios potenciales sobrepasen los riesgos potenciales. Es recomendable monitorear el funcionamiento hepático en pacientes que reciben tratamiento continuo por más de un mes y rápidamente en pacientes que desarrollen síntomas sugestivos de hepatitis como anorexia, náusea, vómito, fatiga, dolor abdominal, orina oscura. Si las pruebas funcionales hepáticas son anormales, el tratamiento deberá ser suspendido.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

En pacientes con elevaciones de las enzimas hepáticas o con enfermedad hepática activa o en quienes han experimentado toxicidad hepática con otros medicamentos, el tratamiento no deberá iniciarse a menos que los beneficios superen el riesgo de lesión hepática. En estos casos es necesario el monitoreo de las enzimas hepáticas.

Insuficiencia hepática: itraconazol se metaboliza principalmente en el hígado. La vida media terminal de itraconazol en pacientes cirróticos es algo prolongada. La biodisponibilidad oral de itraconazol en pacientes cirróticos, se ve disminuida. Un ajuste en la dosis debe ser considerado.

Insuficiencia renal: la biodisponibilidad oral de itraconazol disminuye en pacientes con insuficiencia renal. Un ajuste en la dosis debe ser considerado. Si ocurre neuropatía que puede ser atribuible a itraconazol, el tratamiento debe ser suspendido. No existe información referente a hipersensibilidad cruzada entre itraconazol y otros agentes antimicóticos azólicos. Debe tenerse precaución al prescribir itraconazol en pacientes con hipersensibilidad a otros azoles.

Efectos indeseables.

Por lo menos 5% de los pacientes tratados con itraconazol pudieron reportar náuseas, pirosis, cefalea y vértigo, dichos efectos secundarios han sido de naturaleza leve y transitoria.

Posología y modo de administración.

Oral. Para las micosis de la piel y sus anexos causadas por diversos hongos levaduriformes o mohos y para el tratamiento de pitiriasis versicolor, se recomienda utilizar la presentación de itraconazol a razón de una cápsula al día por 15 días. En tiña del pie y palmar se recomienda continuar el tratamiento por 15 días más. Para onicomycosis y micosis profundas, no se ha logrado establecer esquemas fijos de tratamiento. En estos casos, la

dosis es de una cápsula al día y la duración del tratamiento dependerá de la respuesta del paciente. Para las micosis vaginales agudas, crónicas y recurrentes se sugiere utilizar itraconazol a razón de dos cápsulas al día por tres días (micosis vaginales agudas), o por los días recomendados por el médico tratante (crónico y recurrente). En todos los casos, la toma debe hacerse junto con un alimento, de otra manera la absorción de itraconazol puede verse disminuida.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Hasta el momento, las interacciones conocidas del itraconazol son con la rifampicina y fenitoína, ya que pueden reducir los niveles plasmáticos del primero. Por esta razón se recomienda a los pacientes que lo reciben en forma concomitante, distanciar la toma por lo menos dos horas.

Alteraciones en los resultados de pruebas de laboratorio: Hasta el momento no se han reportado alteraciones en las constantes bioquímicas o hematológicas.

Precauciones en relación con efectos de carcinogénesis, mutagénesis, teratogénesis y sobre la fertilidad: La biodisponibilidad oral de itraconazol en pacientes cirróticos, se eleva, por lo que se recomienda reducir la dosis en este tipo de pacientes. En insuficiencia renal, la biodisponibilidad disminuye, por lo que se recomienda ajustar la dosis. Itraconazol no produce efectos sobre carcinogénesis.

Uso en Embarazo y lactancia.

Itraconazol sólo deberá administrarse en los casos en los que hay peligro para la vida por micosis sistémicas donde los beneficios potenciales superan el daño potencial al feto.

Una pequeña cantidad de itraconazol es excretada en la leche humana. Los beneficios esperados de la terapia con itraconazol deben ser ponderados contra el riesgo potencial de la alimentación del pecho. En caso de duda, la paciente no debe dar alimentación del pecho.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No se han realizado estudios.

Sobredosis.

Medidas generales.

Propiedades farmacodinámicas.

ATC. J02AC02 Derivados triazólicos. Antimicóticos para uso sistémico.

Itraconazol es un derivado triazólico, activo contra infecciones por dermatófitos (*Trichophyton*spp, *Microsporum*spp, *Epidermophyton floccosum*), levaduras (*Candida*spp, *Cryptococcus neoformans*, *Pityrosporon*spp), *Aspergillus*spp, *Histoplasma*spp, *Paracoccidioides brasiliensis*, *Sporothrix schenckii*, *Fonsecaea*spp, *Cladosporium*spp, *Blastomyces dermatitidis* y otros varios hongos y levaduras. Los estudios *in vitro* han demostrado que itraconazol inhibe la síntesis de ergosterol en la célula fúngica. El ergosterol es un componente fundamental en la membrana celular del hongo. Esta acción da como resultado el efecto antimicótico.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

La biodisponibilidad oral de itraconazol es máxima cuando se administra inmediatamente después del alimento principal. Los niveles plasmáticos máximos se alcanzan de 3 a 4 horas después de una toma de 100 mg. La eliminación del plasma es bifásica con una vida media terminal de 1 a 1.5 días. Durante la administración crónica de 100 mg de itraconazol, los niveles constantes se alcanzan después de 1-2 semanas. Las concentraciones plasmáticas

constantes, 3-4 horas después de la administración son: 0.4 µg/ml (100 mg o.d.), 1.1 µg/ml (200 mg o.d.) y 2.0 µg/ml (200 mg b.i.d.). Itraconazol se une a proteínas plasmáticas en un 99.8%. La concentración en sangre es 60% superior a la concentración en plasma. La captación por tejidos queratinizados, especialmente la piel, es 4 veces superior a la concentración en plasma, estando su eliminación relacionada con la regeneración de la epidermis. En contraste con los niveles plasmáticos, los cuales son indetectables dentro de los 7 días siguientes a la suspensión de la terapia, los niveles terapéuticos en la piel persisten de 2 a 4 semanas después de finalizado el tratamiento de 4 semanas. Niveles de itraconazol han sido detectados en la uña queratinizada tan tempranamente como una semana después de iniciado el tratamiento y persisten por al menos 6 meses después de finalizar la terapia de 3 meses. Itraconazol se encuentra presente en sebo y en menor cantidad en el sudor. Itraconazol también se distribuye ampliamente en tejidos susceptibles a la infección por hongos. La concentración en hígado, riñón, hueso, estómago, vesícula y músculo es entre 2 y 3 veces mayor que la del plasma. Los niveles terapéuticos en tejido vaginal se mantienen por otros 2 días después de terminar el tratamiento de 3 días con 200 mg al día, y por otros 3 días después de suspender el tratamiento con 200 mg dos veces al día por un día. Itraconazol se metaboliza en el hígado, dando lugar a un gran número de metabolitos. Uno de los metabolitos es el hidroxitraconazol, el cual tiene una actividad *in vitro* comparable con el itraconazol. Los niveles de itraconazol medidos por bioensayo fueron 3 veces superiores a los obtenidos por HPLC. La excreción de itraconazol en heces es de 3 a 18% de la dosis y la excreción renal es del 0.03% de la dosis. Aproximadamente 35% de la dosis se excreta en forma de metabolitos a través de la orina en una semana.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto

No procede.

Fecha de aprobación/revisión del texto: 25 de abril 2019.