

CETOCONAZOL
(Ketoconazole)

NOME EM INGLÊS: Ketoconazole

PREPARAÇÕES COMERCIAIS: Arcolan®, Candicont®, Candiderm®, Candoral®, Cetoconazol®, Cetonax®, Nizora®, Novacort®, Ketocon®, Fungoral®, Noriderm®.

FÓRMULA MOLECULAR: C₁₅H₂₁NO₂

PESO MOLECULAR: 247,33

NOME QUÍMICO: 1-[4-(3-Hydroxyphenyl)-1-methyl-4-piperidyl]-1-propanone

CAS Nº: [469-79-4]

CARACTERÍSTICAS FÍSICAS: Pó branco e quase branco

PROPRIEDADES FÍSICAS

- **SOLUBILIDADE:** Praticamente insolúvel em água facilmente solúvel em diclorometano, solúvel em metanol e pouco solúvel em álcool.

DESCRIÇÃO

É um fungistático mas, dependendo de sua concentração pode ser considerado um fungicida. É derivado do imidazólico sintético, com eficácia comprovada em infecções causadas por dermatófitos, leveduras e outros fungos patogênicos.

AÇÕES

Possui um amplo aspecto de ação sistêmica e tópica, antiadrenal e antineoplásica. Tem atividade contra infecções clínicas causadas por Blastomyces dermatiridis, Cândida sp., Coccidioides immitis, Histoplasma capsulatum, Paracoccidioides brasiliensis, Phialophora sp., trichophyton sp., Epidermophyton sp. E Microsporum sp. É ativo também contra Pityrosporum orbiculare.

INDICAÇÕES

- Tratamento de infecções fúngicas da bexiga e do trato urinário;
- Tratamento de blastomicose pulmonar e disseminada, candidíase mucocutânea crônica, candidíase cutânea, candidíase disseminada, candidíase orofaríngea, candidíase vulvovaginal, candidúria, carcinoma prostático, coccidioidomicose, cromomicose, dermatite seborréica, esporotricose disseminada, histoplasmose, onicomicose, paracoccidioidomicose, paroníquia, pneumonia fúngica, septicemia fúngica, síndrome de Cushing, tinea barbae, tinea capitis, tinea corporis, tinea cruris, tinea pedis e tinea versicolor;
- Profilaxia de micose em pacientes imunodeprimidos.

POSOLOGIA

- ADULTO:

Candidíase vaginal:

2 comprimidos (400 mg) em dose única diária, durante 5 dias.

Infecções graves ou resposta clínica insuficiente dentro do prazo previsto:

2 comprimidos (400 mg) em dose única diária.

Pacientes imunodeprimidos:

2 comprimidos (400 mg), uma vez ao dia.

Demais indicações: 1 comprimido (200 mg) ao dia, até pelo menos uma semana após o desaparecimento dos sintomas ou até o resultado negativo dos exames micológicos.

ASSOCIAÇÕES

Candicort [cetoconazol + betametasona] (Aché), Novacort [cetoconazol + betametasona + sulfato de neomicina] (Aché), Cetocort [cetoconazol + betametasona] (Teuto Brasileiro).

CONTRA-INDICAÇÕES

- Hipersensibilidade aos antifúngicos imidazólicos;
- Gravidez;
- Lactação;
- Acloridria ou hipocloridria;
- Alcoolismo
- Insuficiência hepática.

PROPRIEDADES FARMACODINÂMICAS

Inibe a biossíntese do ergosterol, ou outros estróis, o cetoconazol também inibe a biossíntese de triglicerídios e fosfolípidios por parte dos fungos; ademais, inibe a atividade enzimática oxidativa e peroxidativa, o que resulta na formação intracelular de concentrações tóxicas de peróxido de hidrogênio, o que pode contribuir para a deterioração das organelas subcelulares e necrose celular. Na *Candida albicans*, inibe a transformação dos blastóforos na forma micelial invasiva.

REAÇÕES ADVERSAS

- Náusea, vômito, dor abdominal, diarreia, hepatotoxicidade;
- Cefaléia, tontura, sonolência, fotofobia;
- Exantema, prurido, erupção cutânea;
- Icterícia, elevação das transaminases, alteração das provas de função hepática, geralmente nos tratamentos prolongados;

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Pode aumentar os efeitos dos anticoagulantes cumarínicos ou indandiônicos;
- Aumenta as concentrações plasmáticas da ciclosporina, o que resulta em nefrotoxicidade e aumento da concentração de creatina sérica;

- Inibe a disposição e prolonga os efeitos da supressão renal da metilprednisolona;
- Álcool ou outros medicamentos hepatotóxicos podem aumentar a incidência de hepatotoxicidade;
- Álcool pode reagir com cetoconazol e causar reação semelhante á do dissulfiram;
- Antiácidos, anticolinérgicos ou antagonistas do receptor H2 podem aumentar o pH gastrointestinal e resultar em redução acentuada na absorção do cetoconazol;
- Fenitoína pode resultar em alterações da biotransformação do cetoconazol ou de ambos os fármacos;
- Agentes hipoglicemiantes podem causar hipoglicemia grave;
- Isoniazida ou rifampicina podem diminuir significativamente suas concentrações séricas.

PREPARAÇÕES PARA FARMÁCIA MAGISTRAL ¹

ANTIMICÓTICOS ORAIS

Cetoconazol.....	200-400 mg
Fluconazol.....	100-200 mg
Griseofulvina.....	100-500 mg
Itraconazol.....	100-200 mg
Nistatina.....	400.000-2.000.000 UI
Terbinafina.....	125-250 mg

ANTIMICÓTICOS

Vaselina Salicilada com Cetoconazol

Ácido Salicílico.....	20%
Uréia.....	20%
Cetoconazol.....	2%
Vaselina Sólida qsp.....	50 g

Formulações com Cetoconazol

Cetoconazol.....	2%
Creme, loção cremosa ou xampu qsp.....	50 g

ANTI-SEBORRÉICOS

Xamou com Cetoconazol

Cetoconazol.....	2%
Alantoína.....	0,5%
Xampu qsp.....	100 ml



DERMATITE ATÓPICA

Ácido Láctico.....	10%
Cafeína.....	30%
Cetoconazol.....	2%
Cloridrato de Papaverina.....	1%
Cromoglicato Dissódico.....	4-10%
Cloridrato de Doxepina.....	5%

ANTIFÚNGICOS

Anfotericina B.....	0,25-1%
Cetoconazol.....	1-5%
Clotrimazol.....	1%
Flucitosina.....	1%
Fluconazol.....	0,1-0,2%
Nistatina.....	50.000-100.000 UI/g
Nitrato de Econazol.....	1%
Nitrato de Miconazol.....	1%
Pimaricina (Natamicina).....	1-5%
Propionato de sódio.....	5%
Thiabenbdazol.....	4-10%

Cetoconazol Colírio

Cetoconazol.....	1-5%
Veículo qsp.....	10ml

PRODUTOS PARA BLEFARITES

Cetoconazol.....	2%
Dehyton.....	1,5%
Miranol.....	1,5%
Sulfacetamida Sódica.....	10%
Sulfeto de Selênio.....	0,5%

Xampu com Cetoconazol e Miranol

Cetoconazol.....	2%
Miranol.....	1,5%
Xampu qsp.....	50 ml

CORTICOSTERÓIDES POTENTES

Betametasona(valerato), Cetoconazol e Gentamicina

Betamestasona (como dipropionato).....	0,1%
Cetoconazol.....	2%
Gentamicina (como sulfato).....	0,1%
Creme ou pomada qsp	

REFERÊNCIA BIBLIOGRÁFICAS

1. Batistuzzo J. A O, Itaya M, Eto Y. **Formulário Médico Farmacêutico**. São Paulo: ed. Tecnopress, 2002, 2º edição. 129,176,177,202,203,252,253,260,270,405. p.
2. Korolkovas, A. **Dicionário Terapêutico Guanabara**. São Paulo: ed Guanabara Koogan, edição 200/2001. 18.17 p.
3. Disponível em <http://www.bulario-online.com.br> acessado dia 21/05/03
4. **The Merck Index**. Whitehouse Station, NJ, USA: Ed 13º, 2001. 5319 p. ISBN 0911910-13-1