



1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO (DCI)

TERCONAZOL

2. VIA DE ADMINISTRACION

VIA VAGINAL

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Antiinfecciosos y antisépticos, excluyendo combinaciones con corticosteroides.

Código ATC: G01AG.02

3.1. Farmacodinamia

El terconazol es un antimicótico triazol-derivado sintético con actividad fungicida. 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 genera 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, provocando con ello la muerte del patógeno.

Ha demostrado actividad *in vitro* frente a *Candida spp.* (Incluyendo: *C. albicans*, *C. krusei*, *C. parapsilosis*, *C. tropicalis*, *C. pseudotropicalis* y *C. stellatoidea*), *Trichophyton spp.* (Incluyendo: *T. mentagrophytes*, *T. rubrum*, *T. tonsurans* y *T. verrucosum*), *Turulopsis glabrata*, *Epidermophyton floccosum* y *Cryptococcus neoformans*.

La experiencia clínica con terconazol ha demostrado su eficacia en presentaciones de administración vaginal (crema y óvulos) en el tratamiento de la candidiasis vulvovaginal.

3.2. Farmacocinética

Posterior a su administración intravaginal como óvulo o crema el terconazol se absorbe a la circulación sistémica en aproximadamente un 10% (rango: 5-15%) y genera concentraciones séricas pico en 5-10 horas.

Su distribución a los tejidos y fluidos corporales no ha sido bien establecida. Los ensayos *in vitro* indican que se une a proteínas plasmáticas en un 95% y en animales de experimentación (ratas) se ha evidenciado su excreción en la leche





materna. Se desconoce, sin embargo, si ocurre lo mismo en humanos o si atraviesa la placenta.

Tras su administración por vía oral en voluntarios sanos el terconazol exhibe una vida media de 6.9 horas y una extensa transformación metabólica seguida por eliminación vía renal (32-56%) y con las heces (47-52%).

3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

No se han desarrollado estudios para evaluar el potencial carcinogénico del terconazol. Las pruebas de mutagenicidad realizadas (test de Ames y ensayos *in vivo* de micronúcleos de ratón y de mutaciones letales dominantes en células germinales de ratón) resultaron negativas.

Los estudios de reproducción en ratas expuestas a dosis orales de terconazol entre 12 y 25 veces superiores a las usadas por vía intravaginal en humanos mostraron bajo peso fetal, retardos de osificación y disminución del número de crías por camada. Sin embargo no hubo evidencias de teratogenicidad, ni alteraciones o trastornos de la fertilidad.

4. INDICACIONES

Tratamiento de la Candidiasis vulvovaginal.

5. POSOLOGÍA

5.1. Dosis recomendada

- Crema intravaginal al 0.8%
Mujeres adultas: El contenido de un (1) tubo aplicador (aprox. 5 g) mediante administración intravaginal 1 vez al día durante 5-7 días continuos.
- Óvulos vaginales de 80 mg
Mujeres adultas: Un (1) óvulo vaginal diario durante 3 días continuos.

5.2. Dosis máxima diaria

Las dosis recomendadas. El uso de dosis superiores no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.





5.3. Dosis en pacientes especiales

Insuficiencia renal: No se requieren ajustes de dosificación

Insuficiencia hepática: No se requieren ajustes de dosificación.

Ancianos: No se requieren ajustes de dosificación.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Crema intravaginal

- Lavar bien las manos antes de la administración.
- Acostarse sobre la espalda y flexionar las rodillas.
- Luego de llenado el tubo aplicador introducirlo profundamente en la vagina y expulsar su contenido accionando suavemente el émbolo del dispositivo.
- Mantener la posición por algunos minutos.
- Desechar el aplicador después de usado y lavar bien las manos luego de la administración.
- Administrar preferiblemente en la noche (antes de dormir).

Óvulos

- Lavar bien las manos antes de la administración.
- Acostarse sobre la espalda y flexionar las rodillas.
- Con el dedo medio introducir profundamente el óvulo en la vagina.
- Mantener la posición por algunos minutos.
- Lavar bien las manos después de la administración.
- Administrar preferiblemente en la noche (antes de dormir).

6. REACCIONES ADVERSAS

Se han descrito con porcentajes de incidencia y severidad variables:

Trastornos del sistema nervioso: Cefalea, mareos.

Trastornos del aparato reproductor y de la mama: Ardor, irritación y/o prurito vulvovaginal, dismenorrea.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo: Erupción, prurito, urticaria, necrólisis epidérmica tóxica.





Trastornos del sistema inmunológico: Reacciones de hipersensibilidad, edema facial, anafilaxia.

Trastornos generales: Dolor abdominal, astenia, síndrome gripe-similar, fiebre, escalofríos.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

No se han descrito.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

- Si durante el tratamiento se presentan ardor o irritación vaginal severa o reacciones sistémicas sugestivas de hipersensibilidad se debe suspender de inmediato la medicación. Las pacientes deben ser informadas al respecto.
- Si la infección no mejora o se agrava con el uso del producto, se debe suspender el tratamiento e informar al médico.
- Se debe advertir a los pacientes la importancia de no alterar la dosificación ni interrumpir el tratamiento antes del tiempo previsto, aunque hayan desaparecido los síntomas de la infección.
- Durante el tratamiento se recomienda evitar las relaciones sexuales.
- Se ha descrito que la crema vaginal y los óvulos de terconazol contienen en su formulación bases oleaginosas que podrían debilitar los preservativos y diafragmas de látex y, como resultado, disminuir la eficacia anticonceptiva de éstos. Las pacientes deben ser informadas al respecto a objeto de tomar previsiones.

8.2. Embarazo

Aunque no se ha evidenciado teratogenicidad en los ensayos experimentales con terconazol, no existen estudios clínicos adecuados que demuestren su seguridad en mujeres embarazadas. Por lo tanto, su empleo durante la gestación





debe limitarse a situaciones de estricta necesidad en las que el balance riesgo/beneficio, a criterio médico, sea favorable.

TEXTO DE PROSPECTO: No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que, a criterio médico, el balance riesgo/beneficio sea favorable.

8.3. Lactancia

Dado que no se conoce si el terconazol se distribuye en la leche materna tras la administración vaginal, ni se dispone de información sobre su seguridad durante la lactancia, se debe evitar su empleo en ese período. TEXTO DE PROSPECTO: No se administre durante la lactancia a menos que el médico lo indique.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al terconazol o a los excipientes de la fórmula.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

No se han reportado casos de sobredosificación por administración vaginal de terconazol. La escasa absorción sistémica del fármaco y su baja concentración en los productos (óvulos y crema) hacen poco probable que se produzca algún signo o síntoma de consideración. Localmente puede ocurrir ardor o irritación.

10.2. Tratamiento

Tratamiento sintomático y de soporte, según necesidad.

11. TEXTOS DE EMPAQUE Y ETIQUETA

11.1 CREMA INTRAVAGINAL AL 0.8%

VIA DE ADMINISTRACION: Vaginal.

INDICACIONES: Tratamiento de la Candidiasis vulvovaginal.

POSOLOGIA (Dosis recomendada):

Mujeres adultas: El contenido de un (1) tubo aplicador (aproximadamente 5 g) mediante administración intravaginal 1 vez al día durante 5-7 días continuos.

ADVERTENCIAS:

Si es la primera vez que presenta síntomas de infección vaginal, consulte al médico antes de usar este producto.

Si está embarazada o en período de lactancia, consulte al médico antes de usar este producto.

Si los síntomas persisten y no se observa mejoría después de 3-4 días, consulte al médico.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Este producto puede reducir la eficacia anticonceptiva de los condones y diafragmas vaginales a base de látex. Se deben tomar precauciones.

Si durante el tratamiento presenta ardor, irritación o picazón en el sitio de aplicación o síntomas de alergia, suspéndalo y consulte al médico.

No exceda la dosis prescrita ni interrumpa el tratamiento antes del tiempo previsto, aunque hayan desaparecido los síntomas de la infección.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

SIN PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA

11.2 OVULOS VAGINALES DE 80 mg

VIA DE ADMINISTRACIÓN: Vaginal.

INDICACIONES: Tratamiento de la Candidiasis vulvovaginal.

POSOLOGIA (Dosis recomendada):

Mujeres adultas: Un (1) óvulo vaginal diario durante 3 días continuos.

ADVERTENCIAS:

Si es la primera vez que presenta síntomas de infección vaginal, consulte al médico antes de usar este producto.

Si está embarazada o en período de lactancia, consulte al médico antes de usar este producto.

Si los síntomas persisten y no se observa mejoría después de 3-4 días, consulte al médico.

Este producto puede reducir la eficacia anticonceptiva de los condones y diafragmas vaginales a base de látex. Se deben tomar precauciones.

Si durante el tratamiento presenta ardor, irritación o picazón en el sitio de aplicación o síntomas de alergia, suspéndalo y consulte al médico.

No exceda la dosis prescrita ni interrumpa el tratamiento antes del tiempo previsto, aunque hayan desaparecido los síntomas de la infección.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

Contraindicaciones: Alergia a los componentes de la fórmula.

SIN PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

