



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

ALBENDAZOL

2. VÍA DE ADMINISTRACIÓN

ORAL

3. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Productos antiparasitarios, insecticidas y repelentes. Antinemátodos. Derivados del benzimidazol.

Código ATC: P02CA03.

3.1. Farmacodinamia

El albendazol es un agente derivado de benzimidazol con actividad antihelmíntica (ovicida, larvicida y vermífida). Como mecanismo de acción se postula que provoca una degeneración selectiva de los microtúbulos citoplasmáticos en las células intestinales del parásito que conduce a trastornos en la captación de glucosa y a depleción de los depósitos de glucógeno. Como resultado se produce un déficit en la producción intracelular de energía (ATP) que provoca la inmovilización y subsecuente muerte del helminto.

Ha demostrado eficacia clínica frente a parásitos intestinales como: *Enterobius vermicularis*, *Ascaris lumbricoides*, *Cysticercus cellulosae* (forma larval de la *Taenia solium*), *Ancylostoma duodenale*, *Necator americanus*, *Strongyloides stercoralis*, *Trichuris trichiura*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Clonorchis sinensis*, *Toxocara canis*, *Toxocara cati*, *Mansonella perstans*, *Gnathostoma spinigerum*, *Encephalitozoon hellem*, *Encephalitozoon intestinalis*, *Encephalitozoon cuniculi*, *Brachiola vesicularum*, *Trachipleistophora* spp., *Pleistophora* spp., *Vittaforma corneae* y *Giardia lamblia*.

3.2. Farmacocinética

Absorción / Distribución

Tras su administración por vía oral el albendazol es pobremente absorbido (< 5%) en el tracto gastrointestinal debido a su escasa solubilidad acuosa. Durante la absorción es rápidamente convertido por efecto metabólico de primer paso en albendazol sulfóxido, metabolito al que se atribuye la acción antihelmíntica y que alcanza concentraciones séricas pico en 2 - 5 horas. La administración simultánea con alimentos grasos incrementa hasta 5 veces su biodisponibilidad.

Se une a proteínas plasmáticas en un 70% y se distribuye ampliamente en el organismo, incluyendo al líquido cefalorraquídeo. En animales difunde a la leche materna, pero se desconoce si ocurre lo mismo en humanos.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Biotransformación / Eliminación

El albendazol sulfóxido es posteriormente degradado en el hígado a productos inactivos que se excretan por la bilis y en pequeña proporción por la orina. Su vida media de eliminación oscila entre 8 y 12 horas.

Insuficiencia renal

No se ha estudiado la farmacocinética en pacientes con disfunción renal.

Insuficiencia hepática

En pacientes con obstrucción extrahepática sus niveles plasmáticos aumentan en forma considerable y su vida media puede elevarse hasta 31,7 horas.

3.3. Información preclínica sobre seguridad

El albendazol no resultó carcinogénico en ratas y ratones expuestos por tiempo prolongado a dosis orales equivalentes a 0,2 y 2 veces, respectivamente, la dosis usual diaria recomendada en humanos (DRH).

Las pruebas de mutagenicidad resultaron negativas para el ensayo *in vivo* de micronúcleos de ratón, ensayo *in vitro* de anomalía cromosómica en células ováricas de hámster chino, prueba de Ames para *Salmonella* y ensayo *in vitro* de transformación de células BALB/3T3 sin activación microsomal. Sin embargo, en este último el resultado fue positivo en presencia de activación microsomal.

Los estudios de reproducción en ratas y conejas sometidas durante la gestación a dosis de albendazol 0,1 y 0,6 veces, respectivamente, la DRH revelaron teratogenicidad (malformaciones esqueléticas) y embriotoxicidad. En ratones, sin embargo, no se evidenció la teratogénesis con dosis 0,16 veces la DRH. Tampoco se observaron trastornos de la fertilidad en ratas con dosis equivalentes a 0,32 veces la DRH.

4. INDICACIONES

Parasitosis intestinales simples y mixtas causadas por patógenos sensibles.

5. POSOLOGÍA

5.1. Dosis

Adultos y niños mayores de 2 años

Ascariasis (*Ascaris lumbricoides*)

Dosis única de 400 mg.

Anquilostomiasis (*Ancylostoma duodenale* y *Necator americanus*)

Dosis única de 400 mg.

Himenolepiasis

400 mg/día por 3 días continuos.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Enterobiasis (*Enterobius vermicularis*)

Dosis inicial de 400 mg, seguida por una dosis adicional de 400 mg después de 2 semanas.

Tricocefalosis (*Trichuris trichiura*)

400 mg/día por 3 días continuos.

Teniasis (*Taenia solium*)

400 mg/día por 3 días continuos.

Estrongiloidiasis (*Strongyloides stercoralis*)

400 mg/día por 3 días continuos.

Niños de 2 a 11 años

Giardiasis (*Giardia lamblia*)

400 mg/día por 5 días continuos.

5.2. Dosis máxima

La descrita en posología. El uso en exceso o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal

No se ha descrito la necesidad de ajustar la dosis.

Insuficiencia hepática

No se ha descrito la necesidad de ajustar la dosis.

Edad avanzada (≥ 65 años)

No se ha descrito la necesidad de ajustar la dosis.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Tabletas y comprimidos

Administrar por vía oral con agua.

Tabletas o comprimidos masticables

Administrar por vía oral. Masticar completamente la tableta o comprimido antes de tragarlo y tomar $\frac{1}{4}$ o $\frac{1}{2}$ vaso de agua después de cada administración.

Suspensión

Agitar antes de usar para homogeneizar la suspensión y administrar por vía oral, acompañado con $\frac{1}{4}$ o $\frac{1}{2}$ vaso de agua después de cada administración.

Con cualquiera de las formas de dosificación, administrar siempre junto con los alimentos (preferiblemente grasos) y a las mismas horas del día durante todo el tratamiento (cuando corresponda).

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia según Diccionario Médico para Actividades Regulatorias (MedDRA) en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Trastornos de la sangre y del sistema linfático

Poco frecuentes: Leucopenia.

Frecuencia no conocida: Supresión de la médula ósea, granulocitopenia, anemia aplásica, trombocitopenia, agranulocitosis, pancitopenia.

Trastornos del sistema inmunológico

Poco frecuentes: Erupción, prurito, urticaria.

Trastornos del sistema nervioso

Muy frecuentes: Cefalea.

Frecuentes: Mareo, signos de irritación meníngea y aumentos de la presión intracraneal (en pacientes con neurocisticercosis).

Frecuencia no conocida: Convulsiones.

Trastornos oculares

Frecuencia no conocida: Visión borrosa.

Trastornos del oído y del laberinto

Frecuentes: Vértigo.

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Náuseas, vómitos, dolor abdominal.

Frecuencia no conocida: Diarrea.

Trastornos hepatobiliares

Muy frecuentes: Elevación de las enzimas hepáticas.

Frecuencia no conocida: Falla hepática aguda.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Frecuentes: Alopecia reversible.

Muy raras: Eritema multiforme, síndrome de Stevens-Johnson.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Trastornos renales y urinarios

Frecuencia no conocida: Falla renal aguda.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Frecuentes: Fiebre.

Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita a los profesionales de la salud y a la comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a su uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel", a través de la página web: <https://inhrr.gob.ve>.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

En pacientes con neurocisticercosis tratados con albendazol se ha evidenciado que anticonvulsivantes como la carbamazepina, el fenobarbital y la fenitoína reducen significativamente las concentraciones plasmáticas del albendazol sulfóxido.

Ritonavir, fenitoína, carbamacepina y fenobarbital pueden reducir las concentraciones plasmáticas del metabolito activo de albendazol, sulfóxido de albendazol. Se desconoce la relevancia clínica de esto, pero puede conllevar una disminución de la eficacia, principalmente en el tratamiento de infecciones helmínticas sistémicas

Se ha reportado que la cimetidina, dexametasona y el praziquantel aumentan hasta en un 50% las concentraciones séricas del metabolito activo albendazol sulfóxido.

La coadministración de albendazol con alimentos ricos en grasas aumenta hasta 5 veces su biodisponibilidad.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Con el uso del albendazol se han reportado reacciones hematológicas graves y potencialmente fatales como: supresión de la médula ósea, anemia aplásica, granulocitopenia y pancitopenia. Por tal razón, cuando se usa por tiempo prolongado se debe realizar un conteo sanguíneo completo al inicio del tratamiento y cada 2 semanas durante el mismo; si se observa alguna alteración importante en los valores, suspender de inmediato la terapia. Los pacientes con enfermedad hepática resultan

Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

más susceptibles a la posibilidad de la mielosupresión, por lo cual requieren vigilancia continua.

En pacientes tratados con albendazol por tiempo prolongado se han descrito elevación de transaminasas, insuficiencia hepática aguda y hepatitis. Debido a ello, se recomienda realizar pruebas de la función hepática antes de comenzar el tratamiento y periódicamente (cada 2 semanas) durante el mismo. De llegar a ocurrir un aumento de las enzimas a más del doble de su nivel normal, se debe suspender la medicación. La posibilidad de reiniciar la terapia tras la normalización de las enzimas dependerá de la situación clínica y de la valoración del balance beneficio/riesgo.

Previo al inicio de un tratamiento con albendazol en mujeres con edad reproductiva y vida sexual activa se debe descartar la posibilidad de un embarazo inadvertido. Así mismo, se debe recomendar a estas pacientes el empleo de medidas anticonceptivas durante el tratamiento y hasta 1 mes después de su finalización.

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 parasitosis.

Informar a los pacientes que el medicamento debe administrarse siempre con los alimentos para incrementar su biodisponibilidad.

8.2. Embarazo

Dado que en los ensayos experimentales con albendazol se ha evidenciado teratogenicidad y embriotoxicidad con dosis inclusive inferiores a las equivalentes usadas en humanos y no existen estudios clínicos adecuados que demuestren su seguridad en mujeres embarazadas, se debe evitar su empleo durante este periodo. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche de su existencia.

8.3. Lactancia

Dado que el albendazol se excreta en la leche materna y no se conoce la seguridad de su administración durante la lactancia, se recomienda evitar su empleo en ese período.

En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, se deberá suspender la lactancia mientras dure el tratamiento.

8.4. Fertilidad

No se dispone de datos sobre los efectos en la fertilidad humana.

Los estudios en animales son insuficientes en lo que respecta a la fertilidad.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

8.5. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No se han llevado a cabo estudios para determinar la influencia de albendazol sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas. No obstante, se debe tener en cuenta que puede esperarse mareo tras el uso de albendazol.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al albendazol o a los excipientes de la formulación.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

No se han descrito casos graves de sobredosificación con albendazol. En principio, no cabe esperar manifestaciones distintas a las reportadas como reacciones adversas con el uso de dosis terapéuticas, aunque probablemente de mayor severidad.

10.2. Tratamiento

Tratamiento sintomático y de soporte.

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

VÍA DE ADMINISTRACIÓN: Oral.

INDICACIONES Y POSOLOGÍA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo vigilancia médica.

En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, se deberá suspender la lactancia mientras dure el tratamiento.

Este producto debe administrarse acompañado siempre con algún alimento.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

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

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia.

CON PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACIÓN DEL TEXTO

Febrero de 2022