



Dejando huella en la  
Industria de la Salud Animal

# KONAVET

## ANTIMICÓTICO DE USO SISTÉMICO

Tabletas orales

Ketoconazol

Antimicótico de acción sistémica

**NUMERO DE REGISTRO Q- 7972-104**

### FÓRMULA

Cada tableta contiene:

Ketoconazol.....100 mg.

Excipiente c.b.p.....1 tableta.



**PRESENTACIÓN** caja con 30 tabletas

Antibiótico con amplio potencial terapéutico para el manejo de micosis superficiales y profundas. Inhibe la biosíntesis del ergosterol o de otros esteroides en los organismos sensibles, lo que daña la pared celular y altera su permeabilidad; esta acción da lugar a la pérdida de elementos celulares esenciales. También inhibe la síntesis de triglicéridos y fosfolípidos de los hongos y la actividad enzimática oxidativa y peroxidativa, acción que origina concentraciones tóxicas del peróxido de hidrógeno que puede destruir los organelos y produce necrosis tisular. *Cándida albicans* inhibe la biotransformación de las blastosporas a la forma micelial invasiva. Según su concentración, puede ser fungistático o fungicida. Es muy activo contra *Cándida albicans*, *Coccidioides immitis*, *Blastomyces dermatitidis*, *Histoplasma capsulatum*, *Paracoccidioides brasiliensis*, y diversos hongos superficiales: *Trichophyton*, *Epidermophyton* y *Microsporum*. También es activo contra estafilococos, estreptococos, *Bacillus anthracis* y *B. fragilis*. Se absorbe con rapidez a través de la mucosa gastrointestinal y se distribuye ampliamente en el organismo, alcanzando concentraciones terapéuticas en diversos tejidos y líquidos orgánicos, excepto en el líquido cefalorraquídeo, cuyas concentraciones son menores que 1% de su concentración plasmática. Esta última alcanza el máximo 1 a 4 h después de su administración, y su vida media tiene dos fases, una de 1.4 a 3.3 h y la segunda de 8 h. Sufre biotransformación en el hígado y se elimina en la bilis en forma de metabolitos inactivos; sólo un pequeño porcentaje aparece en la orina sin cambios metabólicos.

### INDICACIONES

**KONAVET** es un antimicótico imidazólico oral empleado contra hongos patógenos sistémicos incluyendo *Blastomyces*, *Coccidioides*, *Cryptococcus*, *Histoplasma*, *Microsporum* y *Trichophyton*. También se emplea como tratamiento alternativo del hiperadrenocorticismismo canino.

### CARACTERÍSTICAS FÍSICO-QUÍMICAS

FORMULA  $C_{26}H_{28}Cl_2N_4O_4$

MASA MOLAR 531.43 g/mol

PESO MOL 531.43 g/mol

VÍAS DE ADM Oral, Dérmica e Intravenosa (IV), Vía intravaginal

### MECANISMO DE ACCIÓN

Inhibe la biosíntesis del ergosterol o de otros esteroides en los organismos sensibles, lo que daña la pared celular y altera su permeabilidad; esta acción da lugar a la pérdida de elementos celulares esenciales. También inhibe la síntesis de triglicéridos y fosfolípidos de los hongos y la actividad enzimática oxidativa y peroxidativa, acción que origina concentraciones tóxicas del peróxido de hidrógeno que puede destruir los organelos y produce necrosis tisular



Dejando huella en la  
Industria de la Salud Animal

## KONAVET

### ANTIMICÓTICO DE USO SISTÉMICO

#### FARMACOCINETICA Y FARMACODINÁMIA

Tiene cierta actividad antiinflamatoria al inhibir 5-lipooxigenasa de algunos procesos inflamatorios. El fármaco puede suprimir el sistema inmune, probablemente por la supresión de la proliferación de linfocitos T. El ketoconazol también tiene efectos endocrinos como la síntesis de esteroides se inhibe directamente por el bloqueo de varios sistemas de enzimas P-450, que es necesaria para la conversión del lanosterol al ergosterol, un componente esencial de la membrana de los hongos, aunque vía oral en hombres se puede reducir la testosterona o la síntesis de cortisol esto pueden ocurrir a dosis utilizadas para la terapia antifúngica la cual se normaliza al suspender el tratamiento, pero las dosis más altas se requieren generalmente para reducir los niveles de testosterona o cortisol en tratamientos de carcinoma prostático o hiperadrenocorticismo. Los efectos sobre mineralocorticoides son insignificantes.

Otros mecanismos de acción de los antifúngicos imidazólicos incluyen la inhibición de la respiración endógena, la interacción con los fosfolípidos de la membrana y la inhibición de la transformación de los hongos en micelas. También parece ser que afectan a la captación de las purinas y alteran la síntesis de triglicéridos y fosfolípidos. In vitro el ketoconazol previene la formación de las pseudohifas de las Cándidas e incrementa la fagocitosis de los hongos.

Se absorbe bien por vía oral, aunque su biodisponibilidad es variada puede ir del 4 al 89% se alcanzan niveles plasmáticos medios de 3.5 mg/ml en la primera o segunda hora post-administración oral de 200 mg vía oral, el pico más alto se da entre la primera hora a las 4.25 horas. La eliminación plasmática subsecuente es bifásica con vida media de 2 horas durante las primeras 10 horas y de 10 horas en adelante. La absorción de ketoconazol se mejora en un ambiente ácido y no se debe administrar (al mismo tiempo) con bloqueadores H2 o antiácidos. Se puede administrar en ayunas pero es irritante para perros y gatos por lo que se recomienda su administración con alimentos. Después de la absorción, ketoconazol se distribuye en la bilis, el cerumen, la saliva, orina, líquido sinovial y líquido cefalorraquídeo. Los niveles de LCR son generalmente menos de 10% de los que se encuentran en el suero, pero se pueden aumentar si se inflaman las meninges. Se pueden encontrar altos niveles en el hígado, las glándulas suprarrenales, y la glándula pituitaria, mientras que los niveles moderados se encuentran en los riñones, pulmones, vejiga, médula ósea, y el miocardio.

A dosis habituales (10 mg / kg), los niveles alcanzados son probablemente insuficiente en el cerebro, el testículo y los ojos para tratar la mayoría de las infecciones; se requieren dosis más altas. El ketoconazol se une del 84 - 99% a proteínas plasmáticas y atraviesa la placenta (al menos en ratas). El fármaco se encuentra en la leche de perra.

El ketoconazol se metaboliza extensamente por el hígado en varios metabolitos inactivos. Estos metabolitos se excretan principalmente en las heces a través de la bilis. Alrededor del 13% de una dosis administrada se excreta en la orina y sólo de 2 - 4% del fármaco se excreta sin cambios en la orina. La vida media en los perros es aproximadamente de 1 - 6 horas (2,7 horas promedio.).

#### EFFECTOS ADVERSOS

Signos gastrointestinales como anorexia, vómitos y/o diarrea son los efectos adversos más frecuentes observados en especial en gatos. La cual se disminuye dividiendo la dosis y administrándola con alimentos. El Ketoconazol tiene un efecto supresor dependiente de la dosis transitoria sobre la síntesis de esteroides.

No hay informes de toxicidad aguda asociada a la sobredosis. La DL50 oral en perros después de la administración oral es >500 mg/kg. En caso de sobredosis se recomienda el empleo de medidas de apoyo, incluyendo lavado gástrico con bicarbonato de sodio.

#### ADVERTENCIAS

El uso de ketoconazol en gatos es a criterio del Médico Veterinario Zootecnista. No utilizar en animales con enfermedad hepática o trombocitopenia. Se puede presentar inapetencia, vómito, prurito y alopecia. No utilizar en hembras gestantes. En machos puede provocar infertilidad por disminución en la síntesis de testosterona.



Dejando huella en la  
Industria de la Salud Animal

## KONAVET

### ANTIMICÓTICO DE USO SISTÉMICO

Mantenga en un lugar seco, fresco a no más de 30°C y protegido de la luz solar directa. No se deje al alcance de los niños, animales domésticos y personas discapacitadas. **Producto de uso exclusivo en Medicina Veterinaria.**

#### INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

Alcohol: Se puede producir una reacción de tipo disulfiram (vómitos)

Los antiácidos y Bloqueadores H2, omeprazol Puede reducir la absorción oral de ketoconazol; se recomienda administrarlo al menos 1 hora antes o 2 horas después

Corticosteroides Ketoconazol pueden inhibir el metabolismo de los corticosteroides; potencial para el aumento de los efectos adversos.

Puede aumentar los niveles de: digoxina, fentanilo, ciclosporina, Ivermectina: El ketoconazol puede aumentar el riesgo de neurotoxicidad Antibióticos macrólidos (eritromicina, claritromicina): Puede aumentar las concentraciones de Ketoconazol.

#### ESPECIES

Caninos y felinos.

#### DOSIS

1 tableta por cada 5-10 kg de peso (10-20 mg por kg de peso), cada 12-24 horas. Todas las micosis sistémicas deben tratarse por lo menos durante 4 semanas.

#### VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Oral.

#### SU VENTA REQUIERE RECETA MEDICA

#### CONSULTE AL MEDICO VETERINARIO

Literatura exclusiva para Médicos veterinarios. No se deje al alcance de los niños.

Responsables de contenido: Departamento Técnico. [farmacovigilancia@petspharma.com](mailto:farmacovigilancia@petspharma.com).

Hecho en México por

Pet's Pharma de México S.A. de C.V. Av. Sor Juana Inés de la Cruz # 580, Estado de México, CP 57000 Tel. 55 57433839, 55 5736-4742

Sitio Web: [www.petspharma.com.mx](http://www.petspharma.com.mx)

También encuéntranos en Facebook, Instagram, You Tube y LinkedIn