

# تراكون® كبسولات إتراكونازول

**التريـكـيب الـتـيـجـي والـكـمـي :**

**تراكون** هو مستحضر خـلق مـضاد للـفـطـريات واسـع المـجال مـتوفر فـي شـكل كـبـسـولـات كـل مـنـها يـتـنـوي عـلى 100 مـلـجـم إـتـراـكـونـازـول.

**الـخـواص الـدوائـية :**

**تأثير الدواء :**

إتراكونازول مشتق ثلاثي الأزلول له نشاط مضاد للعدوى بالفطريات الجلدية (تراكيفيتون، مايكروسبوروم، ايدروسفيتون فلوكوزم)، الحماز (كينيتوكوكس نيوفومانس، بيتروسبورم، كانديديا وتشمل كانديدبا اليكانس، جلارياتا وكروسي) اسبرجيلوس، هيستولامبا، باراكسيساس برازيلينسيس، سبوروتريكس شيكبي، فوسفيكي، كلادوسبوروم، بلاستوميسيس فيرما تيتيديس، وأنواع أخرى من الحماز والفطريات.

أوضحت الدراسات العملية أن إتراكونازول يوقف تخليق الإرجوستيرول في الخلايا الفطرية. يعتبر إرجوستيرول مركب حيوي للغشاء الخلوي في الفطر، ووقف تخليقه يؤدي إلى فمغول مضاد للفطريات.

**حركية الدواء :**

يكون التوافر الحيوي للإتراكونازول عن طريق الفم في أقصاه عند تناول الكبسولة مباشرة بعد وجبة كاملة. يتم الوصول إلى أقصى مستويات في البلازما بعد 3 إلى 4 ساعات من تناول جرعة عن طريق الفم. ينتهي من المرحلة على مرحلتين يتصف بعمر ناهي من يوم إلى يوم ونصف أثناء التناول المستمر، تتحدد مراحلة الثبات بعد أسبوع إلى أسبوعين. يصل تركيز الإتراكونازول في البلازما إلى المنتصف بعد 3 - 4 ساعات من تناول الدواء ويكون 0.4 ميكوجرام/مل (100 ملجعة مرة واحدة يوميا) و1.1 و1.9 ميكوجرام/مل (200 ملجعة مرة واحدة يوميا) و2 ميكوجرام/مل (200 ملجعة مرة يوميا).

ارتباط إتراكونازول بروتين البلازما هو 99.8%. تركيز إتراكونازول في الدم هو 60% من التركيز في البلازما. يصل الامتصاص في الأنسجة الكرياتينية خاصة الجلد إلى 4 مرات أقل من البلازما، وبمقارنة التركيز بالبلازما والتي تتصف غير موجودة خلال سبعة أيام من انتهاء العلاج نجد أن المستويات العلاجية تستمر في الجلد من أسبوعين إلى أربع أسابيع بعد انتهاء العلاج الذي استمر أربع أسابيع. مستويات من الإتراكونازول وجدت في كراتين الظفر ميكروا خلال أسبوع واحد من بداية العلاج وتستمر على الأقل لمدة ستة شهور بعد انتهاء العلاج برنامح علاجي لمدة ثلاثة شهور. يتواجد الإتراكونازول في الزهم ويحد أقل في العرق.

يتوزع إتراكونازول بشكل واسع أيضا في الأنسجة الأكثر عرضة للإصابة بالفطريات. تركيز الإتراكونازول في الرثة، الكلى، الكبد، العظم، المعدة، الطحال والعضلات وجد أنه أعلى مرتين إلى ثلاث مرات من التركيز في البلازما. تستمر المستويات العلاجية في أنسجة المهبل لمدة يومين آخرين بعد انتهاء العلاج لمدة ثلاثة أيام بجرعة 200 ملجعم يوميا، ولدة ثلاثة أيام بعد انتهاء برنامح علاجي لمدة يوم واحد بجرعة 200 ملجعم مرتين يوميا.

يتأبض إتراكونازول بشمول في الكبد إلى عدد كبير من نواتج الأيض. أحد المواد الناتجة عن الأيض هو هيدروكسي إتراكونازول، والذي توجد له خصائص مضادة للفطريات مقارنة معمليا بالإتراكونازول. يتراوح إخراج العقار الأصيل في البراز بين 3 - 18% من الجرعة. الإخراج الكلوي للمعقار الأصيل أقل من 60.0% من الجرعة. حوالي 35% من الجرعة تفرز كنواتج أيض فعالة في البول خلال أسبوع واحد.

**الخصائص السريرية :**

**دواعي الاستعمال العلاجية :**

تستعمل كبسولات **تراكون** في علاج الحالات الآتية :

● الإصابة الفطرية المتعلقة بالأمراض التناسلية : التهابات الكانديدا للفرج والمهبل.

● الإصابة الفطرية للجلد / العين.

● التينيا المرمشة، الفطريات الجلدية، التهاب الفطري للقرنية، التهابات الكانديدا للفم.

● الإصابة الفطرية للأظفار بسبب الميرميا،فانوس / أو الحماز.

● الإصابة الفطرية للأعضاء الداخلية.

● إصابة الأعضاء الداخلية بالاسبرجيلس، الكانديدا، كريتوكوكوسيس (وتشمل التهاب السحايا بسبب الكريتوكوكي، هيستوبلازموسيس، سبوروتريكوسيس، باراكوكسيدوميكوسيس، بلاستوميكوسيس وكذلك في بعض الحالات النادرة الحدوث من الإصابة الفطرية الاستوائية وإصابات الأعضاء الداخلية.

**موانع الاستعمال :**

● لا يتم وصف كبسولات **تراكون** للمرضي ذوي الحساسية المفرطة للعقار أو إضافاته.

● يتم وصف كبسولات **تراكون** للسيدات الحوامل فقط في حالة وجود خطر يهدد حياتهن وعندما يكون النفع المتوقع أكبر من الضرر المحتمل للجنين. يجب استخدام وسائل منع حل مناسبة عند استعمال كبسولات **تراكون** وذلك حين حدوث أول دورة بعد وقف استعمال **تراكون**.

● لا يجب استخدام **تراكون** مع سيسابريد، تيرفنادين، وميزولاستين، ودوفينيلاد، وكوبينيد، وميوزايد، ليفانيسيل ميثادول، المضيق CYP3A4 HMG-CoA،ريدونكتيز أمبيتورز مثل سيفمسانتان وفلاستاتين، تريازولام وميدازولام عن طريق الفم.

**تحذيرات خاصة واحتياطات خاصة بالنسبة للاستعمال :**

● أظهر إتراكونازول تأثيرا خطي للمفعول سلبي وقد تم الربط بين إتراكونازول وتقارير عن حدوث قصور القلب الاحتقاني، وهذا لا يجب استخدام **تراكون** في علاج داء الأظافر الفطري في حالات مرضى قصور القلب الاحتقاني أو ذوي تاريخ لقصور القلب الاحتقاني إلا في حالة زيادة نسبة الفائدة المتوقعة عن المخاطر المحتملة. وعند تقييم هذه النسبة بين الفوائد/المخاطر لكل حالة يجب أخذ مجموعة من العوامل في الاعتبار مثل شدة الإصابة، وجدول الجرعات، والعوامل المهددة بحدوث قصور القلب الاحتقاني لكل حالة على حدة. هذه العوامل تتضمن أمراض القلب، مثل الإصابة بأمراض قديم الفم المرضعي الاحتشائي والصمامات، والأمراض الرئوية الحاصلة مثل مرض الاحتشائس الرئوي المزمن، والفشل الكلوي والمشاكل الدوائية الأخرى. فيجب إخبار هؤلاء المرضى

**الجرعة وطريقة الاستعمال :**

للحصول على أقصى امتصاص يجب أن يؤخذ **تراكون** مباشرة بعد وجبة كاملة، ويجب أن تؤخذ الكبسولة كاملة.

بعلامات وأعراض قصور القلب الاحتقاني، ويجب الإحياط عند علاجهم ب**تراكون**، ويجب مراقبة أية علامات أو أعراض لقصور القلب الاحتقاني أثناء العلاج، فإذا لوحظ وجود أي من الأعراض

يجب وقف العلاج ب**تراكون**.

قد يكون لمغلفات قنوات الكالسيوم تأثير عضلي المفعول سلبي مما قد يضيف تلك التي يسببها إتراكونازول ويمكن أن يبطئ إتراكونازول أيضا مغلفات قنوات الكالسيوم، ولهذا يجب الإحياط عند الجمع بين تعاطي إتراكونازول ومشبطات قنوات الكالسيوم.

● **تراكون** لديه قابلية للتفاعلات المتداخلة مع العقاقير الأخرى. (أنظر التفاعلات مع عقاقير أخرى وأشكال أخرى من الفم).

● انخفاض حسية المعدة : ابتصاص **تراكون** يقل عند انخفاض حسية المعدة. في المرضى الذين يتناولون عقاقير معادلة لحمضية المعدة (مثل هيدروكسيد الألمونيوم) يجب أن تتناول تلك العقاقير بعد ساعتين على الأقل من تناول كبسولات **تراكون**. في المرضى الذين يوجد لديهم كلوروهيدرا

لمدة بعض حالات مرضي نقص المناعة المكتسبة والمرضى الذين يتناولون أدوية تمنع إفراز الحمض في المعدة (مثل موانع مستقبلات الهستامين، مشبطات عمل مضخة البروتين) يتصح بتعاطي كبسولات **تراكون** مع مشروب غازي.

● **الإستخدام في الأطفال :** حيث أن المعلومات الإكلينيكية لإستعمال كبسولات إتراكونازول عند الأطفال محدودة، فلا يجب إستخدام كبسولات **تراكون** للأطفال إلا في حالة زيادة الفائدة المتوقعة عن المخاطر المحتملة.

● حدثت بعض الحالات النادرة جداً من التسمم الكبدي متضمنة بعض حالات القصور الكبدي الحادالمؤدي إلى الوفاة عند إستخدام إتراكونازول، ومعظم هؤلاء المرضى المصين كانوا مصابين من قبل بأمراض الكبد لكن بعد علاجهم من أمراض عامة غير موضوعية معينة أو/ أو يعانون من حالات مرضية معينة أخرى أو/ أو كانوا يتناولون عقاقير أخرى مسببة للتسمم الكبدي.

● التليف الكبدي : يتأبض غالبية الإتراكونازول في الكبد. في حالة مرضي التليف الكبدي يستغرق تصف عمر إتراكونازول وقتا أطول بعض الشيء. التوافر الحيوي عن طريق الفم في مرضي التليف الكبدي يكون أقل، لذلك يجب تعديل الجرعة.

● في حالة قصور وظائف الكلى : التوافر الحيوي عن طريق الفم يكون أقل، فنصح بتعديل الجرعة.

● في حالة حدوث التهاب بالأعصاب والذي يمتثل بنسبه إلى كبسولات **تراكون**، عندها يجب وقف العلاج.

● ليست هناك معلومات كافية عن وجود حساسية مفرطة عند تزامن إستخدام إتراكونازول مع مضادات أخرى للفطريات الأولية، فيجب الحرص عند وصف كبسولات **تراكون** للمرضي الذين يعانون من حساسية مفرطة من الأولزلات الأخرى.

**التفاعلات مع الأدوية الأخرى والأنواع الأخرى من التفاعلات :**

● **الأدوية التي تؤثر في أيض إتراكونازول :**

تمت دراسة التفاعلات مع ريفاميسين، وريفابوتين وفيتوبين. حيث أن التوافر الحيوي لإتراكونازول وهيدروكسي إتراكونازول قد قل في هذه الدراسات بدرجة قلت معها فاعلية الدواء بدرجة كبيرة، فلا نتصح مزج إتراكونازول مع أي من مخفزات الإنزيمات سابقة الذكر. ليست هناك أية معلومات مؤكدة من دراسات رسمية عن مخفزات الإنزيمات الأخرى مثل كاربامازين، وفينوباريتال وأيزوتريازيد ولكن يمكن توقع وجود نفس التأثير لها. حيث أن أيض إتراكونازول يتم بصفة أساسية بواسطة CYP3A4. فإن المشطات المحملة لهذا الإنزيم قد تزيد التوافر الحيوي

● **تأثير إتراكونازول على أيض العقاقير الأخرى :**

● **سيب إتراكونازول أيض الأدوية التي يتم تأبضها عن طريق عائلة إنزيم سيتوكروم A3.** مما يؤدي إلى زيادة و/ أو إطالة تأثير هذه الأدوية وآثارها الجانبية. بعد وقف العلاج تقل معدلات إتراكونازول في البلازما تدريجيا، حسب الجرعة التي تم تناولها ومدة العلاج (أنظر حركية الدواء).

● يجب أخذ هذه المعلومة في الإعتبار عند قياس التأثير المشط لإتراكونازول عند تناومه مع عقاقير أخرى.

**أشئلة على ذلك :**

**العقاقير التي لا يجب تناولها مع إتراكونازول :**

● تيرفنادين، ميزولاستين، تريازولام، ميدازولام التي تتناول عن طريق الفم،دوفينيلاد، كوبينيد، ميوزايد، CYP3A4 المضيق HMGCoA، رادكتيز أمبيتورز مثل سيفمسانتان، ولوفامستان.

● يمكن أن يكون لمغلفات قنوات الكالسيوم تأثير عضلي المفعول سلبي مما قد يضيف على تأثير إتراكونازول. ويمكن أن يبطئ إتراكونازول أيض مغلفات قنوات الكالسيوم، ولهذا يجب الإحياط عند الجمع بين تعاطي إتراكونازول ومغلفات قنوات الكالسيوم.

● العقاقير التي يجب مراقبة مستواها في البلازما أو تأثيراتها أو أعراضها الجانبية مع إتراكونازول، فيجب تقليل جرعاتها عند الضرورة عند إستخدامها مع إتراكونازول.

● مضادات التجلط عن طريق الفم :

● مشبطات بروتياز فيرومات نقص المناعة المكتسبة مثل ريتونافير، إندينافير، وساكوينافير.

● بعض المواد المضادة لنمو الأولام مثل الكالويد فيكا، وبامفاسين (ويعرف أيضا وترامبركسيت.

● CYP3A4 للمضيق لمغلفات قنوات الكالسيوم مثل ديبايدروبيريدين وفراباميل.

● بعض العقاقير المشطة للمناعة : سيكلوسبورين، تاكروليموس، ورياباميسين (ويعرف أيضا بسيرولوس).

● لا يوجد تداخل بين إتراكونازول وAZT (زيدوفودين) وفلاستاتين.

● لا يوجد تأثير مخفر للإتراكونازول على تأبض التيلين أسترادول وتورايتشيترون.

**الحمل والرضاعة :**

● ليس هناك دراسات على تأثير إتراكونازول على الحوامل، ولهذا يجب إستخدام كبسولات **تراكون** فقط في حالات الإصابة الفطرية العميقة المهددة للحياة وعندما تكون الفوائد الناتجة أكبر من الضرر المتوقع.

● كمية قليلة من إتراكونازول تفرز في حليب الأم، ولهذا يجب تقدير الفائدة مقابل احتمالية مضار الرضاعة، أما في حالة عدم التأكد فيجب على المرضة عدم إرضاع الطفل طبيعياً.

**التأثير على قيادة السيارات واستعمال الآلات :**

● لا يلحظ وجود أي تأثير.

| مدة العلاج                  | الجرعة                                                    | دواعي الاستعمال                                                                                                                                                                                                             |
|-----------------------------|-----------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| يوم واحد<br>ثلاثة أيام      | 200 ملجم مرتين يومياً<br>أو 200 ملجم مرة واحدة يومياً     | الإصابات الفطرية المتعلقة بالأمراض التناسلية<br>التهابات الكانديدا للفرج والمهبل.                                                                                                                                           |
| سبعة أيام                   | 200 ملجم مرة واحدة يومياً                                 | الإصابات الفطرية للجلد / العين                                                                                                                                                                                              |
| سبعة أيام<br>خمسة عشر يوماً | 200 ملجم مرة واحدة يومياً<br>أو 100 ملجم مرة واحدة يومياً | التينيا المرمشة<br>إصابات الجلد الفطرية                                                                                                                                                                                     |
|                             | 100 ملجم مرة واحدة يومياً                                 | في المناطق عالية الكيراتين كما في التينيا التي تصيب باطن القدم وكف اليد تتطلب 200 ملجم مرتين يومياً لمدة سبعة أيام أو 100 ملجم يومياً لمدة ثلاثون يوماً.                                                                    |
|                             | 100 ملجم مرة واحدة يومياً                                 | التهابات الكانديدا للفم                                                                                                                                                                                                     |
|                             | 200 ملجم مرة واحدة يومياً                                 | في بعض المرضى والذي يوجد لديهم نقص في المناعة مثل حالات نقص عدد كرات الدم البيضاء (نيتروبينيا) مرضي نقص المناعة المكتسبة أو في حالة نقل الأعضاء. التوافر الحيوي لإتراكونازول عن طريق الفم قد يقل لهذا قد يتم مضاعفة الجرعة. |
|                             | 200 ملجم مرة واحدة يومياً                                 | الالتهابات الفطرية للقرنية                                                                                                                                                                                                  |

**الإصابات الفطرية للأظافر :**

● علاج الأسبوع الواحد يتكون من 2 كبسولة (200 ملجم) مرتين يومياً لمدة أسبوع. وفي حالة الإصابة الفطرية لأظافر القدم يكون العلاج لمدة ثلاث أسابيع. في حالة علاج الأسبوع الواحد يتم فصل فترات العلاج بفترة خالية من الدواء لمدة ثلاث أسابيع. يظهر التأثير العلاجي عند إعادة نمو الأظافر بعد انتهاء العلاج.

|                                                            |             |             |                        |                        |             |             |                        |                        |             |
|------------------------------------------------------------|-------------|-------------|------------------------|------------------------|-------------|-------------|------------------------|------------------------|-------------|
| مكان الإصابة الفطرية للأظافر                               | أسبوع 1     | أسبوع 2     | أسبوع 3                | أسبوع 4                | أسبوع 5     | أسبوع 6     | أسبوع 7                | أسبوع 8                | أسبوع 9     |
| الإصابة الفطرية لأظافر القدم مع إصابة أظافر اليد أو بدونها | جرعة تراكون | جرعة تراكون | أسابيع خالية من العلاج | أسابيع خالية من العلاج | جرعة تراكون | جرعة تراكون | أسابيع خالية من العلاج | أسابيع خالية من العلاج | جرعة تراكون |
| الإصابة الفطرية لأظافر اليد                                | جرعة تراكون | جرعة تراكون | أسابيع خالية من العلاج | أسابيع خالية من العلاج | جرعة تراكون | جرعة تراكون | أسابيع خالية من العلاج | أسابيع خالية من العلاج | جرعة تراكون |

**أو العلاج المتصل :**

2 كبسولة يومياً (200 ملجم مرة واحدة يومياً) لمدة ثلاثة شهور.

المتخلص من إتراكونازول من الجلد ونسج الأظافر أعلى منه في البلازما. ولهذا تصل التأثيرات الإكلينيكية والعملية المثل من 2 إلى 4 أسابيع بعد إنتهاء علاج إصابات الجلد. و 6 - 9 شهور بعد إنتهاء علاج إصابات الأظافر.

**الإصابات الفطرية للأعضاء الداخلية :**

| دواعي الاستعمال              | الجرعة                                            | متوسط مدة العلاج       | ملاحظات                                                                |
|------------------------------|---------------------------------------------------|------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| اسبرجيلوسيس                  | 200 ملجم مسرة واحدة يومياً                        | 5 - 2 شهور             | ملاحظة<br>ضخام الجرعة إلى 200 ملجم مرتين يومياً في حالة انتشار الإصابة |
| كانديوزس                     | 100 - 200 ملجم مرة واحدة يومياً                   | 3 أسابيع إلى سبعة شهور |                                                                        |
| الكريتوكوكوزيس               | 200 ملجم مرة واحدة يومياً                         | من شهرين إلى سنة       |                                                                        |
| التهاب السحائي بالكريبتوكوكس | 200 ملجم مرتين يوميا                              |                        |                                                                        |
| هستوبلازموزيس                | 200 ملجم مرة واحدة يومياً / 200 ملجم مرتين يومياً | 8 شهور                 |                                                                        |
| سبوروتريكوزيس                | 100 ملجم مرة واحدة يومياً                         | 3 شهور                 |                                                                        |
| باراكوكسيدوميكوزيس           | 100 ملجم مرة واحدة يومياً                         | 6 شهور                 |                                                                        |
| كروموميكوزيس                 | 200 - 100 ملجم مسرة واحدة يومياً                  | 6 شهور                 |                                                                        |
| بلاستوميكوزيس                | 100 ملجم مرة واحدة يومياً / 200 ملجم مرتين يومياً | 6 شهور                 |                                                                        |

**التأثيرات الغير مرغوبة :**

أكثر الأعراض الجانبية المرتبطة بالعلاج ب**تراكون** كانت متعلقة بالجهاز الهضمي المعوي، كعسر الهضم، والغثاين، والقيء، والإسهال، وآلام البطن، والإسالك. بعض الأعراض الأخرى تتضمن الصداع، زيادة في أنزيمات الكبد القابلة للعلاج، التهاب الكبد، اضطراب الطمث، دوار وأعراض حساسية (كالحكة، والطفح الجلدي، والارتيكاريا، وأدمة الأوعية الدموية) والالتهاب العصبي الطرفي، وحالة سبتينز - جونسون، والصلع، وتدني بوتاسيوم الدم، والأدمة، وقصور القلب الاحتقاني، وأدمة الجهاز التنفسي.

**الجرعة المفرطة :**

في حالة حدوث زيادة عرضية في الجرعة يجب اللجوء للإجراءات المساندة خلال ساعة من تناول **تراكون**. يمكن سحب غسيل معوي، ويمكن إعطاء فحم نشط إذا كان مناسباً. لا يمكن إزالة إتراكونازول بواسطة غسيل الدم (هيموداليسيس). لا يتوافر علاج مضاد لتراكون.

**الخصائص الصيدلانية :**

قائمة السوغات: هيدروكسي بروبييل ميثيل سيلولوز، كرات السكر، كلوريد الميثيلين، كحول الأيزوبروبيل وكبسولة جليلاتية.

**التخزين :**

يحفظ في درجة حرارة أقل من 30° م.

**العبوة التوفرية :**

يتوفر **تراكون** على هيئة كبسولات تحتوي على 100 ملجم إتراكونازول.

إنتاج الدوائية

مصنع الأدوية بالفصيم

الشركة السعودية للمصناعات الدوائية والمستلزمات الطبية

الملكة العربية السعودية.

علامه تجارية

مجلس وزراء الصحة العرب

وتحاد الصاددة العرب

تاريخ تحديث المعلومات : نوفمبر 2009.

تراكون : علامة تجارية

34TR421