



Literatura técnica

Cetoconazol

Uso: Interno/Externo

CAS: 65277-42-1

Sumário

Introdução	pág. 4
Mecanismo de ação	pág. 4
Ficha técnica	pág. 5
Referência bibliográficas	pág. 7

Indicação: O cetoconazol em formulações orais está indicado no tratamento de infecções fúngicas sistêmicas específicas, incluindo blastomicose, coccidioidomicose, histoplasmose, cromomicose e paracoccidioidomicose em pacientes que não toleram ou não respondem a outras terapias antifúngicas. Devido à sua baixa penetração no líquido cerebrospinal, não é recomendado para tratamento de meningite fúngica. Produtos de uso tópicos contendo cetoconazol, como xampus e cremes são indicados para infecções cutâneas causadas por fungos e leveduras, incluindo dermatite seborreica e outras micoses superficiais.

Posologia e modo de usar: Para formulações orais, doses usuais para tratamento de infecções sistêmicas variam tipicamente entre 200–400 mg uma vez ao dia, ajustadas conforme peso e gravidade da infecção, sendo indicado em pacientes com mais de 2 anos de idade. A duração e regime exatos dependem da avaliação clínica e resposta ao tratamento, sendo a dosagem máxima diária de cetoconazol de 1g.

Para uso tópico, xampus de cetoconazol costumam ser aplicados nas áreas afetadas, deixando agir por alguns minutos antes de enxaguar, com frequência de 2 vezes por semana por algumas semanas para dermatite seborreica; cremes podem ser aplicados em camada fina sobre a área de micoses, geralmente 1–2 vezes ao dia conforme orientação médica, com concentração típica de 1 a 2% de cetoconazol.

Contraindicações: O uso de cetoconazol está contraindicado em pacientes com hipersensibilidade conhecida ao cetoconazol ou a qualquer componente da formulação. A administração oral é contraindicada em indivíduos com doença hepática aguda ou crônica devido ao risco de hepatotoxicidade grave. Coadministração com certos substratos de CYP3A4, como dofetilida, quinidina, cisaprida, pimozida, alguns benzodiazepínicos e outros, é potencialmente perigosa devido ao aumento de concentrações plasmáticas e risco de efeitos adversos sérios, incluindo prolongamento do intervalo QT. Como o cetoconazol é excretado no leite, mulheres que estão sob tratamento não devem amamentar. O uso do cetoconazol por gestantes e crianças também é contraindicado amenos que os benefícios compensem os potenciais riscos.

Advertências: Antes de iniciar o tratamento com cetoconazol oral, avaliações clínicas e laboratoriais adequadas devem ser realizadas, incluindo função hepática, dado o risco de hepatotoxicidade. O uso em gestantes e lactantes deve ser considerado apenas se os benefícios superarem os riscos potenciais ao feto e ao bebê. Devido ao risco de efeitos adversos hepáticos graves, o tratamento com cetoconazol sistêmico deve ser reservado para situações em que alternativas terapêuticas mais seguras não são adequadas. Monitoramento da função hepática durante o tratamento é essencial. Pacientes com histórico de insuficiência adrenal também devem ser avaliados cuidadosamente antes de receber cetoconazol devido à potencial inibição da função adrenocortical em doses elevadas. O consumo de álcool durante o tratamento com cetoconazol deve ser evitado devido ao risco de lesão hepática. O consumo de íons multivalentes pode diminuir as concentrações de cetoconazol, por isso o uso concomitante deve ser evitado.

Em formulações tópicas, evitar contato com olhos e áreas extensas de pele lesionada para minimizar absorção sistêmica.

Interações medicamentosas: O cetoconazol inibe enzimas do citocromo P450, particularmente CYP3A4, o que pode levar ao aumento da concentração plasmática de numerosos medicamentos metabolizados por essa via, incluindo benzodiazepínicos, certos antiarrítmicos e estatinas, entre outros, potencializando efeitos e toxicidade. O uso concomitante com álcool pode aumentar o risco de lesão hepática.

Reações Adversas: As reações adversas mais frequentemente associadas ao cetoconazol oral incluem efeitos gastrointestinais como náuseas e vômitos, além de hepatotoxicidade, que pode ser grave. Efeitos raros relatados incluem ginecomastia e distúrbios endócrinos devido à inibição da síntese hormonal. Em uso tópico, podem ocorrer irritação local, coceira ou vermelhidão.

Introdução

O cetoconazol é um antifúngico da classe dos azóis utilizado no tratamento de infecções fúngicas sistêmicas e tópicas. Quimicamente, trata-se de um composto imidazólico que atua interferindo na síntese de componentes essenciais da membrana celular fúngica, levando à inibição de crescimento ou morte dos fungos. Tem sido amplamente estudado e utilizado em formulações sistêmicas (comprimidos) e tópicas (cremes, xampus) devido ao seu espectro de ação contra uma variedade de microrganismos fúngicos e leveduras.

Mecanismo de Ação

O cetoconazol age inibindo a enzima 14- α -esterol desmetilase, dependente de CYP450, crítica para a biossíntese do ergosterol, um componente essencial da membrana celular dos fungos. A inibição dessa via leva à redução de ergosterol, aumentando a permeabilidade da membrana e acumulando metabólitos tóxicos no interior da célula fúngica, resultando em efeito fungistático ou fungicida dependendo da concentração e espécie de fungo.

Ficha técnica

Uso recomendado

INTERNO

Características do ativo

Aspecto: Pó

Cor: Branco a quase branco

Densidade: 0,4667 g/mL

Solubilidade: Praticamente insolúvel em água

Recomendações farmacotécnicas

Advertências e restrições de uso

USO INTERNO E EXTERNO. Evitar contato com os olhos. Não aplicar sobre feridas e lesões. Em caso de irritação, suspenda o uso e procure orientação médica. Em caso de contato com os olhos, enxágue abundantemente com água. Mantenha fora do alcance de crianças.

Recomendações de armazenamento e transporte:

Mantenha o recipiente devidamente fechado em ambiente seco e bem ventilado. Armazenar em temperatura ambiente e proteger contra incidência solar direta.

Lote e validade

Vide embalagem.

Referências bibliográficas

- AGÊNCIA NACIONAL DE VIGILÂNCIA SANITÁRIA – ANVISA. Consultas – Bulário eletrônico: Cetoconazol. Disponível em: <https://consultas.anvisa.gov.br/#/bulario/q/?nomeProduto=cetoconazol>. Acesso em: 19 fev. 2026.
- DRUGBANK Online — Database for Drug and Drug Target Info. Ketoconazole: Uses, Interactions, Mechanism of Action. Disponível em: <go.drugbank.com/drugs/DB01026>. Acesso em: 19 fev. 2026.
- DRUGS.COM. Ketoconazole Cream and Shampoo. Disponível em: <https://www.drugs.com/ketoconazole-cream-and-shampoo.html>. Acesso em: 19 fev. 2026.
- Van Tyle, J H. Ketoconazole. Mechanism of action, spectrum of activity, pharmacokinetics, drug interactions, adverse reactions and therapeutic use. *Pharmacotherapy* vol. 4,6 (1984): 343-73. DOI:10.1002/j.1875-9114.1984.tb03398.x. Disponível em: <https://pubmed.ncbi.nlm.nih.gov/6151171/>. Acesso em: 19 de fev. de 2026.

Literatura técnica

Cetoconazol

**SIGA-NOS NAS
REDES SOCIAIS**

@irialmag

Irial  **Mag**

+55 11 4671-9200 | 0800 940 3210
contato@irialmag.com.br

www.irialmag.com.br