

LABORATORIO CHILE S.A.
SANTIAGO - CHILE

SUBGERENCIA DE DESARROLLO
Y CONTROL DE CALIDAD

Fecha: Junio/04

Página: 1

Producto N° IMED-125

Versión: 01

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL

INSTITUTO DE SALUD PUBLICA
Departamento Control Nacional
Sección Registro

1.- DENOMINACIÓN:

Nombre : AZITROMICINA POLVO PARA SUSPENSIÓN ORAL 200 mg/5 mL

Principios Activos : Azitromicina Dihidrato

Forma Farmacéutica : Polvo para suspensión oral

INSTITUTO DE SALUD PUBLICA
Departamento de Control Nacional
Registro N° 14-262/04

2.- COMPOSICIÓN:

Azitromicina polvo para suspensión oral 200 mg/5 mL

Cada 5 mL de suspensión reconstituida contiene:

Azitromicina (dihidrato) 200 mg

Excipientes: Fosfato de sodio tribásico dodecahidrato, Benzoato de sodio, Aspartamo, Carmelosa sódica, Goma carragenina, Dióxido de silicio de alta densidad, Dióxido de silicio de baja densidad, Dióxido de silicio coloidal, Gelatina, Esencia de plátano polvo, Esencia almendra polvo, Esencia de cerezas polvo, Sacarosa.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.

3.- FÓRMULAS:

Fórmula Global : $C_{38}H_{72}N_2O_{12} \cdot H_2O$

P.M. : 785,03

DEPARTAMENTO CONTROL NACIONAL
N° Ref: 19.437/04
SECCIÓN REGISTRO

4.- CATEGORÍA:

Antibacteriano.

12 OCT 2004

5.- INDICACIONES:

Infecciones por gérmenes sensibles a la azitromicina demostrado por antibiograma.

Oralmente está indicada en el tratamiento de infecciones leves a moderadas del tracto respiratorio alto y bajo (ej. faringitis, tonsilitis) causadas por organismos susceptibles como Streptococcus Pyogenes Es una alternativa a la terapia de primera línea (ej. Penicilina natural) y generalmente es reservada para pacientes quiénes son intolerantes a dicha terapia. Es usada en el tratamiento de exacerbaciones bacterianas agudas en enfermedad pulmonar obstructiva crónica secundaria, ocasionadas por Branhamella catarrhalis. Haemophilus influenzae o Streptococcus pneumoneae y para casos leves de neumonía comunitaria adquirida causada por organismos susceptibles. En infecciones no complicadas de la piel y estructuras afines causadas por S. aureus, S. pyogenes o S. agalactiae.

Azitromicina o tetraciclinas son consideradas las drogas de elección en el tratamiento de infecciones no complicadas (ej. uretral, endocervical) causadas por Chlamydia trachomatis.

6.- POSOLOGÍA Y MÉTODO DE ADMINISTRACIÓN:

Azitromicina debe administrarse al menos 1 hora antes o 2 horas después de las comidas.

Adultos y adolescentes:

La dosis usual en adultos para el tratamiento de faringitis o tonsilitis (como terapia de segunda línea) leve a moderada, en exacerbaciones bacterianas agudas de enfermedades pulmonares obstructivas crónicas, neumonía comunitaria adquirida leve e infecciones no complicadas de piel y estructuras afines es 500 mg el primer día de tratamiento administrado en una dosis, seguido de 250 mg diarios por cuatro días ó 500 mg una vez al día por 3 días.

Para el tratamiento de infecciones no complicadas por Chlamidias, incluyendo cervicitis o uretritis gonococcal, la dosis usual es 1 g administrado como dosis única.

Niños mayores de 3 años:

En pacientes pediátricos la dosis oral es de 10 mg/Kg el primer día, seguido de 5 mg/Kg diarios por cuatro días consecutivos. Sin embargo, en niños con un peso mayor de 45 Kg, se deberá administrar la misma dosis que en adultos.

7.- FARMACOLOGÍA:

El efecto antibacteriano de Azitromicina, es similar al de los otros antimicrobianos macrólidos.

Inhibe la síntesis proteica en organismos susceptibles, mediante la unión reversible a la subunidad rebosomal 50S.

La azitromicina es usualmente bacteriostática, pero puede ser bactericida en altas concentraciones o sobre organismos altamente susceptibles.

Estructuralmente se relaciona a eritromicina, con un espectro antimicrobiano similar.

Sin embargo, azitromicina es menos activa in vitro sobre organismos gram-positivos que la eritromicina, pero, en contraste es más activa sobre muchos patógenos gram-negativos y otros organismos como Haemophilus influenzae, H. parainfluenzae, Moraxella catarrhalis, Neisseria gonorrhoeae, Ureaplasma urealytium y Borrelia burgdorferi. Al igual que la eritromicina y otros macrólidos, la actividad de azitromicina no es afectada por la producción de betalactamasa. Además, los organismos resistentes a eritromicina son también resistentes a azitromicina.

8.- FARMACOCINÉTICA:

Luego de la administración oral, azitromicina es rápidamente absorbida y ampliamente distribuida por todo el organismo.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO – CHILE		SUBGERENCIA DE DESARROLLO Y CONTROL DE CALIDAD	
Fecha: Junio/04	Página: 3	Producto N° IMED-125	Versión: 01

El perfil farmacocinético de azitromicina refleja una rápida y extensa recaptura desde la circulación hacia compartimentos intracelulares. Esto puede explicar el bajo peak de concentración plasmática detectado.

La biodisponibilidad oral de una dosis simple de 500 mg de azitromicina, en adultos sanos y en ayuno, es de un 37%. Concentraciones plasmáticas peak de 0,4 – 0,45 mg/L se obtienen aproximadamente 2,5 horas después de la administración oral de 500 mg de azitromicina.

El volumen de distribución es de 23 – 31 L/Kg.

Azitromicina es rápida y altamente concentrada en un sinnúmero de células tipo, incluyendo leucocitos polimorfonucleares, monocitos, macrófagos alveolares y fibroblastos y posteriormente baja la liberación desde estas células.

Se distribuye en tejido ginecológico, fluido peritoneal, pulmón, próstata, tejido urológico, amígdalas, huesos, tejido adiposo, mucosa gástrica y músculos.

La unión a proteínas plasmáticas es de un 50% con una concentración de 0,02 – 0,05 mg/L reduciéndose a un 7% con concentraciones de 1 mg/L. Esto indica que a altas concentraciones, la azitromicina libre está más disponible para la distribución a sitios de infección.

La azitromicina es principalmente excretada sin alteración por las heces y en menor grado por la orina. La excreción transintestinal puede ser el mecanismo de eliminación primario para droga inalterada.

La vida media de eliminación va en un rango de 10 – 57 horas dependiendo del régimen de dosificación e intervalos de muestreo.

La farmacocinética no se altera significativamente en pacientes geriátricos con insuficiencia renal leve, tampoco en pacientes con insuficiencia hepática leve a moderada.

9.- Información para su prescripción:

Precauciones:

- Administrar con precaución a pacientes con deterioro de la función hepática y/o renal.
- Advertir a los pacientes que la administración de Azitromicina debe realizarse al menos una hora antes o dos horas después de las comidas. Este medicamento no se debe administrar en conjunto con alimentos y/o antiácidos que contengan magnesio y aluminio.
- Informar al paciente de discontinuar inmediatamente la terapia con Azitromicina si presenta algún signo alérgico.
- Seguridad y eficacia en niños o adolescentes menores de 16 años no ha sido establecida al no haber estudios suficientes que relacionen los efectos con la edad. Sin embargo, está aprobado su uso en mayores de 3 años como suspensión oral.
- Evitar su uso en embarazo y lactancia. Se desconoce si la azitromicina se distribuye hacia la leche materna.

Advertencias:

En tanto no se tenga una casuística suficiente que garantice la seguridad del producto en niños menores no es aconsejable su uso en menores de 3 años.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.

Contraindicaciones:

Está contraindicado en pacientes con conocida hipersensibilidad a eritromicina, azitromicina a algún otro antibiótico macrólido, o a algún componente de la formulación.

Interacciones con otros fármacos:

La administración concomitante con antiácidos de aluminio y magnesio reduce la concentración sérica peak, pero no el grado de absorción total de Azitromicina.

La administración concomitante con digoxina puede elevar los niveles plasmáticos de digoxina.

Azitromicina administrada en conjunto con ergotamina o dihidroergotamina puede ocasionar una toxicidad aguda por ergotamina, caracterizado por severos vasoespasmos periféricos y disestesia.

10.- REACCIONES ADVERSAS:

Los efectos adversos más comunes son a nivel gastrointestinal (9,6%), seguido por alteraciones en el sistema nervioso central y periférico (193%).

La mayoría de los efectos adversos son leves a moderados, con sólo un 6% de alteraciones severas, que son predominantemente disturbios gastrointestinales, (diarrea, náuseas, vómitos y dolor abdominal), vértigo, cefalea, fatiga y alteraciones cutáneas.

El tratamiento debe ser discontinuado en un 0,7 % de los pacientes.

Efectos adversos que ocurren en un 1 % de los pacientes o menos son: Palpitaciones, ictericia colestásica, vaginitis, nefritis, somnolencia, angioedema y reacciones de fotosensibilidad.

11.- INFORMACIÓN TOXICOLÓGICA:

En general, los antibióticos del grupo de los macrólidos son considerados por poseer una menor toxicidad que otros antimicrobianos.

El efecto tóxico más común de los macrólidos incluye irritación gastrointestinal, colestasis, ototoxicidad, tromboflebitis y arritmias ventriculares. Estos efectos son usualmente reversibles una vez discontinuado el medicamento.

Embarazo: No existen estudios que avalen su seguridad y eficacia en este estadio.

Lactancia: Se ha detectado azitromicina en leche materna. No se recomienda su uso.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.

Tratamiento de sobredosis:

- a) Emesis: Puede ser indicada en una ingestión reciente. Es más efectiva dentro de los primeros 30 minutos.
- b) Lavado gástrico: Puede ser indicado, si se realiza poco después de la ingestión, o en pacientes comatosos o que presentan riesgo de convulsión. Proteger las vías aéreas, por la posición de Trendenbure y posición decúbito lateral izquierdo o por intubación endotraqueal. El lavado gástrico se realiza una vez que se hallan controlado las crisis convulsivas.
- c) Carbón activado/catárticos.
- d) Toxicidad aguda luego de una sobredosis es poco común. Comida, leche o antiácidos pueden ser administrados para malestares gastrointestinales.
- e) Los efectos tóxicos de antibióticos macrólidos usualmente son reversibles una vez discontinuado el medicamento.

En cuanto al rango de toxicidad, los macrólidos en general, son antibióticos de bajo orden de toxicidad.

12.- BIBLIOGRAFÍA:

- GOODMAN - GILMAN : Bases Farmacológicas de la Terapéutica, 1996
- MARTINDALE: The Extra Pharmacopoeia 30, 1993
- PHYSICIANS MEDICAL REFERENCE 49, 1995
- USP Dispensing Information, 1995
- DRUGS - FACTS & COMPARISONS 2000.
- THE MERCK INDEX 11th Edition.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.