

XITROM®

AZITROMICINA 500mg

COMPOSICIÓN:

Cada tableta contiene
Azitromicina 500mg
Excipientes c.s

FORMA FARMACÉUTICA: Tableta
Recubierta.

Lista de excipientes: Cab-o-Sil (Aerosil 200), Celulosa Microcristalina, Croscarmelosa Sódica PH 101, Lauril Sulfato de Sodio, Monoestearato de Magnesio, Opadry Blanco, Polivinilpirrolidona, Etnol 96°, Agua*.

GRUPO FARMACOTERAPÉUTICO: Azitromicina. Código ATC: J01 FA10

PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS: Azitromicina es un antibiótico macrólido, de la subclase de los azalídicos. Es un antibiótico semi-sintético que difiere estructuralmente de la eritromicina por la inclusión de un átomo de nitrógeno dentro del anillo de lactona.

Azitromicina ha demostrado ser activo tanto in vitro como in vivo contra la mayoría de las cepas de los siguientes microorganismos:

- Microorganismos gram positivos aerobios: *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus agalactiae*, *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*.

Se debe considerar que azitromicina ha demostrado resistencia cruzada con cepas gram positivas resistentes a la eritromicina. La mayoría de las cepas de *Enterococcus faecalis* y *Staphylococcus* resistentes a metilicina son resistentes a azitromicina.

- Microorganismos gram negativos aerobios: *Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Shigella*, *Pasteurella*, *Vibrio cholerae*. Las actividades frente a *Escherichia coli*, *Salmonella enteritidis*, *Salmonella typhi*, *Enterobacter*, *Aeromonas hydrophila* y *Klebsiella* son variables, por lo que deben realizarse pruebas de susceptibilidad. Especies de *Proteus*, *Serratia*, *Morganella* y *Pseudomonas aeruginosa* son usualmente resistentes.
- Organismos de enfermedades de transmisión sexual: La azitromicina es activa frente a la *Chlamydia trachomatis* y también muestra una buena actividad frente al *Treponema pallidum*, *Neisseria gonorrhoeae* y *Haemophilus ducreyi*.

- Otros microorganismos: Azitromicina ha demostrado actividad in vitro, en la prevención y en el tratamiento de las enfermedades causadas por los siguientes microorganismos: *Mycobacterium avium complex* (MAC)

Los siguientes datos están disponibles tras ensayos in vitro, sin embargo su importancia clínica es desconocida.

MECANISMO DE ACCIÓN:

Azitromicina inhibe la síntesis de proteínas en organismos susceptibles penetrando la pared celular y uniéndose a las sub-unidades ribosomales 50S, lo

que produce la inhibición de la translocación del ARN de transferencia y la consiguiente inhibición de la síntesis de proteínas.

FARMACOCINÉTICA:

Absorción: Después de la administración oral de Azitromicina está es ampliamente distribuida a través del cuerpo, la biodisponibilidad que se alcanza esta entre un 37% y un 38%, pruebas limitadas indican que esta biodisponibilidad es resultado de una absorción incompleta por efecto de la degradación de la droga en medio ácido o por un extenso metabolismo de primer paso. Azitromicina se puede administrar con o sin alimentos. La administración con alimentos produce un aumento del peak plasmático de azitromicina, sin alterar el área bajo la curva de la misma.

Distribución: Azitromicina posee una unión a proteínas plasmáticas que es concentración dependiente, con valores que van entre el 7% y el 50%, se une predominantemente a la glicoproteína ácida alfa 1. Se distribuye extensamente en muchos tejidos entre ellos los fluidos de la vejiga, las secreciones bronquiales, tejido cervical, oído, linfa, ovarios y esputo. Posee un volumen de distribución de 23 a 31.1 L/Kg.

Metabolismo: El 35% de la dosis es metabolizada por el hígado, dando lugar a una serie de metabolitos inactivos. Posee una vida media de variable que va de las 11 a las 68 horas.

Excreción: Azitromicina posee una excreción renal del orden del 4.5% al 12.2%, el clearance total del cuerpo es de 4.83 L/hr/Kg. La excreción biliar es una vía principal de eliminación de azitromicina, más del 50% de la dosis se excreta como droga inalterada por la biliar.

FARMACOCINÉTICA EN SITUACIONES CLÍNICAS

ESPECIALES: Pacientes de edad avanzada En voluntarios de edad avanzada (> 65 años), los valores del área bajo la curva de concentraciones plasmáticas versus tiempo (AUC) tras un régimen de 5 días de tratamiento, fueron ligeramente más altos que los observados en voluntarios jóvenes (<40 años), pero esta diferencia carece de significación clínica y, por consiguiente, no es necesario recomendar ajustes de la dosificación.

INDICACIONES: Azitromicina está indicado para el tratamiento de:

- Infecciones del tracto respiratorio inferior incluyendo bronquitis y neumonía
- Infección leve o moderada del tracto respiratorio superior incluyendo laringitis, faringitis, tonsilitis, sinusitis causadas por *S. Pyogenes*.
- Infecciones de la piel y tejidos blandos
- Tratamiento de las infecciones genitales no complicadas debido a *Chlamydia trachomatis* y *Neisseria gonorrhoeae* no multirresistente.

POSOLÓGIA Y ADMINISTRACIÓN:

Vía de administración: oral

Dosis: según prescripción médica.

Adultos: En el tratamiento de las enfermedades sexuales producidas por microorganismos sensibles, la dosis recomendada es de 1 g como dosis oral única.

Para todas las otras indicaciones, la dosis recomendada es de 1500 mg (dosis total) administrando 500 mg diarios durante 3 días. Como una alternativa, la misma dosis total se puede administrar durante 5 días, administrando 500 mg el primer día y luego 250 mg diarios desde el 2° al 5° día.

En los pacientes con daño hepático leve a moderado puede utilizarse el mismo rango de dosificación como en los pacientes con función hepática normal.

Niños y adolescentes: (Niños mayores de 2 años) Se administra como una dosis única al día. La dosis usual en niños es de 10 mg/Kg/día una vez al día por 3 días o como alternativa, la misma dosis total puede ser administrada en 5 días utilizando 10 mg/Kg/día (sin sobrepasar los 500 mg), durante el primer día, seguido de 5mg/Kg/día una vez al día durante los días 2 al 5 (sin sobrepasar 250 mg diarios). Para el tratamiento de Faringoamigdalitis en niños se recomienda administrar 12 mg/Kg/día una vez al día por 5 días (sin sobrepasar 500 mg diarios).

CONTRAINDICACIONES

El uso de XITROM está contraindicado en casos de hipersensibilidad a la azitromicina, a cualquier otro antibiótico macrólido como la eritromicina o a cualquier otro componente de la fórmula.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Se han reportado pocos casos de reacciones alérgicas graves, incluyendo angioedema y anafilaxia, a pesar de que tratamiento de los síntomas alérgicos es inicialmente exitoso, cuando se suspendió el tratamiento sintomático, los síntomas alérgicos reaparecieron poco después en algunos pacientes, sin que se les volviera a administrar azitromicina. Los pacientes que llegaron a presentar reacciones alérgicas después de la administración de azitromicina requieren periodos prolongados de observación y tratamiento. Se desconoce la relación entre estos episodios alérgicos y la larga vida media de azitromicina en los tejidos. Si ocurre una reacción alérgica, el medicamento debe ser suspendido y se deberá instaurar el tratamiento adecuado para manejar los signos de la reacción alérgica. Se debe estar consciente que los signos de reacción alérgica pueden reaparecer después de haber interrumpido el tratamiento sintomático.

La diarrea asociada a *Clostridium difficile* (DADC) ha sido reportado con el uso de casi todos los agentes antibacterianos, incluyendo azitromicina. La diarrea puede variar en severidad, desde diarrea leve a colitis fatal. El tratamiento con agentes antibacterianos que pueden alterar la flora intestinal normal pueden llevar a la proliferación de *C. difficile*. Las

toxinas producidas por algunas cepas de *C. difficile* pueden causar un incremento en la morbilidad y mortalidad de la diarrea, la cual se puede volver refractaria a la terapia con antibióticos, llegando a requerir colectomía. La diarrea asociada a *C. difficile* debe ser considerada en cualquier paciente que experimente diarrea después de la administración de antibióticos.

Debido a que la azitromicina se elimina principalmente por vía hepática, esta se debe administrar con precaución a pacientes con insuficiencia hepática. De igual forma se recomienda administrar con precaución en pacientes con tasa de filtración glomerular <10 ml / min.

Como se ha visto con el tratamiento con otros macrólidos, en pacientes con antecedentes de prolongación del intervalo QT o problemas en la repolarización cardíaca, se ha asociado al riesgo de desarrollar arritmias cardíacas y torsades de pointes. Un efecto similar con azitromicina no se puede descartarse por completo en los pacientes de mayor riesgo.

Este medicamento se debe administrar sólo cuando se cuenta con respaldo de la existencia de una infección o con una fuerte sospecha de que se trata de una infección bacteriana, de lo contrario existe un mayor riesgo de desarrollar resistencia a azitromicina.

Debe administrarse con precaución a pacientes con miastenia gravis, se ha informado que la administración de azitromicina a este tipo de pacientes agrava los síntomas miasténicos o producir la exacerbación de la enfermedad.

Su uso no se recomienda en pacientes con neumonía que no respondieron apropiadamente a la terapia oral debido a que la enfermedad está en un estado moderado a grave. Tampoco se recomienda su uso en pacientes con neumonía, los cuales presentan factores de riesgo (fibrosis quística, sospecha de infecciones causadas por bacterias nosocomiales, pacientes hospitalizados, ancianos, pacientes debilitados, o pacientes inmunosuprimidos significativamente).

EMBARAZO Y LACTANCIA:
Embarazo: Categoría B. Se han realizado estudios en animales que no han revelado efectos adversos para el feto, sin embargo no existen estudios controlados en mujeres. Este tipo de drogas debe darse sólo cuando sea estrictamente necesario.

Lactancia: Las pruebas disponibles no son concluyentes y la información es insuficiente para determinar el riesgo infantil cuando se utiliza durante la lactancia. No se sabe si azitromicina se excreta en la leche materna, en base a esto, se debe tener precaución cuando se administra azitromicina a una mujer que está amamantando.

EFFECTOS SOBRE LA CAPACIDAD PARA CONDUCIR Y UTILIZAR

MÁQUINAS: No existen evidencias de que azitromicina tenga efectos en la capacidad de conducir o manejar maquinaria. No obstante, debido a que durante tratamiento con azitromicina se han notificado casos de somnolencia y mareos, el paciente debe tener precaución al conducir o manejar maquinaria, hasta que no se establezca como le puede afectar la toma de azitromicina de forma individual.

REACCIONES ADVERSAS:

Frecuentes: diarrea / heces blandas, vómitos, náuseas, dolor abdominal, dolor de cabeza, rash cutáneo.

Poco frecuentes: palpitaciones, dolor en el pecho, falta de respiración, reacciones alérgicas, pérdida de apetito, mareos, somnolencia, trastornos de la vista o de la audición, vértigo, prurito.

Raros: agitación, ictericia, prolongación del segmento QT con arritmias cardíacas, extrasístoles, palpitaciones, colestasis, hepatotoxicidad, Síndrome de Stevens-Johnson. Diarrea asociada a *Clostridium difficile*, Pancreatitis.

CARCINOGENESIS, MUTAGENESIS, FERTILIDAD:

No se han realizado estudios a largo plazo en animales para evaluar el potencial carcinogénico de este antibiótico. La azitromicina no ha mostrado potencial mutagénico en las pruebas estándar de laboratorio (ensayo de linfoma de ratón, ensayo clastogénico en linfocitos humanos y ensayo clastogénico en la médula ósea de ratón).

INTERACCIONES:

• La administración concomitante de azitromicina con algunos medicamentos podría aumentar el riesgo de cardiotoxicidad asociado a la administración de los antibióticos macrólidos, la cardiotoxicidad se manifiesta con la prolongación del intervalo Q-T, torsades de pointes y/o paro cardíaco. Dentro de los medicamentos que pueden incrementar el riesgo de cardiotoxicidad están: amiodarona, bretilium, pimozida, propafenona, sotalol.

• El uso conjunto de azitromicina con antiácidos que contengan aluminio o magnesio, disminuyen la absorción de azitromicina debido a quelación de azitromicina con los cationes polivalentes, disminuyendo así su concentración plasmática y consiguiente efectividad terapéutica.

• Se podrían incrementar las concentraciones séricas de distintos medicamentos, si es que se administran en concomitancia con azitromicina, los medicamentos que pueden sufrir este tipo de interacción son: carbamazepina, ciclosporina, digoxina, hexobarbital, fenitoína, teofilina.

• La administración de azitromicina puede inhibir el metabolismo de ciertas drogas, produciendo la elevación de las concentraciones séricas de las drogas que se administran concomitantemente, entre estas están: los derivados del ergol

y metisergide.

• Administrar azitromicina con fentanil podría incrementar y prolongar los efectos opioides de fentanil. La concomitancia de nefenavir con azitromicina eleva las concentraciones séricas de este último.

• La concomitancia de azitromicina con triazolam incrementa el efecto farmacológico de triazolam.

• Warfarina y el uso con antibióticos macrólidos ha sido asociado con un incremento en sus efectos anticoagulantes; el tiempo de protrombina deberá ser cuidadosamente monitoreado en pacientes con terapia concurrente.

SOBREDOSIFICACIONES: No existe información acerca de una sobredosificación por azitromicina. En caso de ocurrir se recomienda implementar los cuidados generales para revertir los síntomas.

ALMACENAMIENTO:

Conservar a temperatura no mayor a 30°C, en un lugar fresco y seco.

PRECAUCIONES:

Producto de uso delicado. Adminístrese por prescripción y bajo vigilancia médica.

Todo medicamento debe conservarse fuera del alcance de los niños.

ESPECIFICACION DE VENTA:

Venta bajo receta médica

PRESENTACIONES:

- Caja x 1 blister x 3 tabletas c/u + prospecto (Caja x 3)
- Caja x 1 blister x 5 tabletas c/u + prospecto (Caja x 5)
- Caja x 1 blister x 7 tabletas c/u + prospecto (Caja x 7)
- Caja x 1 blister x 10 tabletas c/u + prospecto (Caja x 10)
- Caja x 2 blister x 7 tabletas c/u + prospecto (Caja x 14)
- Caja x 3 blister x 10 tabletas c/u + prospecto (Caja x 30)
- Caja x 1 blister x 1 tableta c/u + prospecto (Caja x 1) (Muestra médica).

ESPECIFICACION DE VENTA:

VENTA: Bajo Receta Médica.
Registro Sanitario N°: 1185-MEN-0717
Elaborado y Distribuido por:
FARBIOPHARMA S.A.
QUITO - ECUADOR
Dirección: Calle Guayas N° E3-296 y Av. Pichincha
Sector Lomas de la Concepción, vía a Pintag.
Telf: (593) 2 2794046 - 2794031 FAX: 2794021
SERVICIO AL CLIENTE: 1800327246
www.farbiopharma.com

XITROM®
AZITROMICINA 500mg

