
Azithromycin - Azitromicina

Autor:

Data de publicació: 24-09-2022

Azitromicina

Dades clíniques

Noms comercials

Zithromax, Azitrocin, Sumamed, altres[1]

Altres noms

9-desoxi-9?-aza-9?-metil-9?-homoeritromicina A

AHFS/Drugs.com

Monografia

MedlinePlus

a697037

Dades de llicències

EU EMA: per INN

DailyMed dels EUA: Azitromicina

FDA dels EUA: Azitromicina

Categoria d'embaràs

UA: B1[2]

Vies d'administració

Per via oral (càpsula, comprimit o suspensió), intravenosa, caiguda dels ulls

Classe de drogues
Antibiòtic macròlid

Codi ATC

J01FA10 (OMS) S01AA26 (QUI) J01RA07 (OMS))

Règim jurídic

Règim jurídic

EUA: ?-només
UE: Només Rx [3]

Dades farmacocinètiques

Biodisponibilitat
38% per càpsules de 250 mg

Metabolisme
Fetge

Eliminació mitja vida útil
11–14 h (monodosi) 68 h (dosificació múltiple)

Excreció
Conducte biliar, ronyó (4,5%)

Identificadors

mostrar
Nom IUPAC

Número CAS

83905-01-5

PubChem CID

55185

IUPHAR/BPS

6510

Banc de Drogues

DB00207

ChemSpider

10482163

UNII

J2KLZ20U1M

KEGG

D07486

ChEBI

CHEBI:2955

ChEMBL

ChEMBL529

NIAID ChemDB

007311

Tauler de control CompTox (EPA)

DTXSID8030760

InfoCard de l'ECHA
100.126.551

Dades químiques i físiques

Fórmula
C₃₈H₇₂N₂O₁₂

Massa molar
748.996 g·mol⁻¹

Model 3D (JSmol)

Imatge interactiva

mostrar
SOMRIURES

mostrar
InChI

GLAH&page2=Azitromicina (verificar)

L'azitromicina és un medicament antibiòtic utilitzat per al tractament d'una sèrie d'infeccions bacterianes. [4] Això inclou infeccions d'òrta mitjana, gola estrep, pneumònia, diarrea del viatger i algunes altres infeccions intestinals. [4] Juntament amb altres medicaments, també es pot utilitzar per a la malària. [4] Es pot prendre per via oral o per via intravenosa amb dosis una vegada al dia. [4]

Els efectes secundaris comuns inclouen nàusees, vòmits, diarrea i malestar estomacal. [4] És possible una reacció al·lèrgica, com ara anafilaxi, prolongació del QT o un tipus de diarrea causada per *Clostridium difficile*. [4] No s'ha trobat cap dany amb el seu ús durant l'embaràs. [4] La seva seguretat durant la lactància materna no està confirmada, però és probable que sigui segura. [5] L'azitromicina és un azalur, un tipus d'antibiòtic macròlid. [4] Funciona disminuint la producció de proteïnes, aturant així el creixement bacterià. [4][6]

L'azitromicina va ser descoberta el 1980 per la farmacèutica croata Pliva i aprovada per a ús mèdic amb la marca Sumamed el 1988. [7][8] Es troba a la llista de medicaments essencials de l'Organització Mundial de la Salut. [9] L'Organització Mundial de la Salut la classifica com a d'importància crítica per a la medicina humana. [10] Està disponible com a medicament genèric[11] i es ven sota molts noms comercials a tot el món. [1] El 2019, va ser el 48è medicament més receptat als Estats Units, amb més de 15 milions de receptes. [12][13]

Usos mèdics

L'azitromicina s'utilitza per tractar diverses infeccions, Incloent:

Prevenió i tractament de les exacerbacions bacterianes agudes de la malaltia pulmonar obstructiva crònica a causa de *H. influenzae*, *M. catarrhalis* o *S. pneumoniae*. Els beneficis de la profilaxi a llarg termini s'han de ponderar pacient per pacient contra el risc d'efectes cardiovasculars i altres efectes adversos. [14]

Pneumònia adquirida a la comunitat a causa de *C. pneumoniae*, *H. influenzae*, *M. pneumoniae* o *S. pneumoniae*[15]

Infeccions de la pell sense complicacions a causa de *S. aureus*, *S. pyogenes* o *S. agalactiae*

Uretritis i cervicitis degudes a *C. trachomatis* o *N. gonorrhoeae*. En combinació amb la ceftriaxona, l'azitromicina forma part del règim recomanat pels Centres per al Control de Malalties dels Estats Units per al tractament de la gonorrea.

L'azitromicina és activa com a monoteràpia en la majoria dels casos, però la combinació amb ceftriaxona es recomana basant-se en la barrera relativament baixa per al desenvolupament de resistència en gonococs i a causa de la coinfecció freqüent amb *C. trachomatis* i *N. gonorrhoeae*. [16]

Tracoma degut a *C. trachomatis*[17]

Malaltia d'úlcer genital (chancroid) en homes a causa de *H. ducrey*

Sinusitis bacteriana aguda deguda a *H. influenzae*, *M. catarrhalis* o *S. pneumoniae*. No obstant això, generalment es prefereixen altres agents, com l'amoxicil·lina/clavulanat. [18][19]

Otitis mitjana aguda causada per *H. influenzae*, *M. catarrhalis* o *S. pneumoniae*. L'azitromicina no és, però, un agent de primera línia per a aquesta condició. Generalment es prefereix l'amoxicil·lina o un altre antibiòtic beta lactam. [20]

Faringitis o amigdalitis causada per *S. pyogenes* com a alternativa a la teràpia de primera línia en individus que no poden utilitzar teràpia de primera línia[21]

Sumamed 500 mg

Susceptibilitat bacteriana

L'azitromicina té una activitat antibacteriana relativament àmplia però poc profunda. Inhibeix alguns bacteris Gram positius, alguns bacteris gramnegatius i molts bacteris atípics.

El 2015 es va trobar una soca de gonorrea altament resistent a l'azitromicina. *Neisseria gonorrhoeae* és normalment susceptible a l'azitromicina,[22] però el fàrmac no s'utilitza àmpliament com a monoteràpia a causa d'una baixa barrera per al desenvolupament de resistències. [16] L'ús extensiu de l'azitromicina ha donat lloc a una creixent resistència a *Streptococcus pneumoniae*. [23]

Microorganismes grampositius aeròbics i facultatius

Staphylococcus aureus (només sensible a la meticil·lina)

Streptococcus agalactiae

Streptococcus pneumoniae

Streptococcus pyogenes

Microorganismes anaerobis aeròbics i facultatius Gramnegatius

Haemophilus ducreyi

Haemophilus influenzae
Moraxella catarrhalis
Neisseria gonorrhoeae
Tos ferina de Bordetella
Legionella pneumophila

Microorganismes anaeròbics

Espècie Peptostreptococcus
Prevotella bivia

Altres microorganismes

Chlamydophila pneumoniae
Chlamydia trachomatis
Mycoplasma genitalium
Mycoplasma pneumoniae
Ureaplasma urealyticum

Embaràs i lactància

No s'ha trobat cap dany amb l'ús durant l'embaràs. [4] No obstant això, no hi ha estudis adequats i ben controlats en dones embarassades. [24]

La seguretat de la medicació durant la lactància materna no està clara. Es va informar que, com que només es troben nivells baixos en la llet materna i la medicació també s'ha utilitzat en nens petits, és poc probable que els nadons alletats tinguin efectes adversos. [5] No obstant això, es recomana que el medicament s'utilitzi amb precaució durant la lactància. [4]

Malalties de les vies respiratòries

L'azitromicina sembla ser eficaç en el tractament de la malaltia pulmonar obstructiva crònica a través de la seva supressió de processos inflamatoris. [25] I potencialment útil en asma i sinusitis a través d'aquest mecanisme. [26] Es creu que l'azitromicina produeix els seus efectes mitjançant la supressió de certes respostes immunitàries que poden contribuir a la inflamació de les vies respiratòries. [27][28]

Efectes adversos

Els efectes adversos més comuns són diarrea (5%), nàusees (3%), dolor abdominal (3%) i vòmits. Menys de l'1% de les persones deixen de prendre el fàrmac a causa d'efectes secundaris. S'ha informat de nerviosisme, reaccions cutànies i anafilaxi. [29] S'ha informat de la infecció per Clostridium difficile amb l'ús d'azitromicina. [4] L'azitromicina no afecta l'eficàcia del control de la natalitat a diferència d'alguns altres antibiòtics com la rifampina. S'ha informat de pèrdua d'audició. [30]

Ocasionalment, les persones han desenvolupat hepatitis colèstica o deliri. La sobredosi intravenosa accidental en un lactant va causar un bloqueig cardíac sever, donant lloc a una encefalopatia residual. [31][32]

El 2013, la FDA va emetre un advertiment que l'azitromicina "pot causar canvis anormals en l'activitat elèctrica del cor que poden conduir a un ritme cardíac irregular potencialment mortal". La FDA va assenyalar en l'advertència un estudi de 2012 que va trobar que el fàrmac pot augmentar el risc de mort, especialment en aquells amb problemes cardíacs, en comparació amb els d'altres antibiòtics com l'amoxicil·lina o cap antibiòtic. L'advertència indicava que les persones amb afeccions preexistents tenen un risc especial, com ara aquelles amb prolongació de l'interval QT, nivells baixos en sang de potassi o magnesi, una freqüència cardíaca més lenta del normal, o aquelles que utilitzen certs medicaments per tractar ritmes cardíacs anormals. [33][34][35]

S'ha informat que l'azitromicina bloqueja l'autofàgia i pot predisposar els pacients amb fibrosi quística a la infecció micobacteri. [36]

Farmacologia

Mecanisme d'acció

L'azitromicina impedeix que els bacteris creixin interferint en la seva síntesi de proteïnes. S'uneix a la subunitat 50S

del ribosoma bacterià, inhibint així la traducció de l'ARNm. La síntesi d'àcids nucleics no es veu afectada. [24]

Farmacocinètica

L'azitromicina és un antibiòtic estable en àcids, de manera que es pot prendre per via oral sense necessitat de protecció contra els àcids gàstrics. S'absorbeix fàcilment, però l'absorció és més gran a l'estómac buit. El temps fins a la concentració màxima (T_{max}) en adults és de 2,1 a 3,2 hores per a les formes de dosificació oral. A causa de la seva alta concentració en fagòcits, l'azitromicina es transporta activament al lloc de la infecció. Durant la fagocitosi activa, s'alliberen grans concentracions. La concentració d'azitromicina en els teixits pot ser més de 50 vegades superior a la del plasma a causa de la captura d'ions i la seva alta solubilitat lipídica. [cal citació] La vida mitjana de l'azitromicina permet administrar una sola dosi gran i, tot i així, mantenir els nivells bacteriostàtics en el teixit infectat durant diversos dies. [37]

Després d'una sola dosi de 500 mg, l'eliminació terminal aparent de la vida mitjana de l'azitromicina és de 68 hores. [37] L'excreció biliar de l'azitromicina, predominantment inalterada, és una via important d'eliminació. Al llarg d'una setmana, al voltant del 6% de la dosi administrada apareix com un medicament sense canvis en l'orina.

Història

Un equip d'investigadors de la farmacèutica Pliva de Zagreb, Croàcia—Gabrijela Kobrehel, Gorjana Radobolja-Lazarevski i Zrinka Tamburašev, dirigits per Slobodan ?oki?—van descobrir l'azitromicina el 1980. [38] L'empresa Pliva la va patentar el 1981. [8] El 1986, Pliva i Pfizer van signar un acord de llicència, que donava a Pfizer drets exclusius per a la venda d'azitromicina a Europa Occidental i els Estats Units. Pliva va posar la seva azitromicina al mercat a Europa Central i de l'Est sota la marca Sumamed el 1988. Pfizer va llançar l'azitromicina sota la llicència de Pliva en altres mercats sota la marca Zithromax el 1991. [39] La protecció per patent va finalitzar el 2005. [40]

Societat i cultura

Zithromax (azitromicina) 250 mg comprimits (CA)

Formularis disponibles

L'azitromicina està disponible com a medicament genèric. L'azitromicina s'administra comunament en comprimits recoberts amb pel·lícula, càpsula, suspensió oral, injecció intravenosa, grànuls per a la suspensió en sobre i solució oftàlmica. [1]

Ús

El 2010, l'azitromicina va ser l'antibiòtic més prescrit per a pacients ambulatoris als Estats Units,[41] mentre que a Suècia, on l'ús ambulatori d'antibiòtics és un terç de la prevalença, els macròlids només es troben en el 3% de les prescripcions. [42] El 2017, l'azitromicina va ser el segon antibiòtic més prescrit per a pacients ambulatoris als Estats Units. [43]

mostrar

Llistats de marques

Tot i que les primeres evidències que mostren que l'azitromicina va alentir la multiplicació del coronavirus en entorns de laboratori, investigacions posteriors indiquen que és ineficaç com a tractament per a la COVID-19 en humans. [44] Després que un assaig a gran escala no mostrés cap benefici d'utilitzar azitromicina en el tractament de la COVID-19, l'Institut Nacional d'Excel·lència en Salut i Atenció (NICE) del Regne Unit va actualitzar les seves directrius i ja no recomana el medicament per a la COVID-19. [45]

Referències

- ^ Jump up to:un b c d e f "Marques internacionals d'azitromicina".. Drugs.com. Arxivat de l'original el 28 Febrer 2017. [Consulta: 27 febrer 2017].
- ^ "Ús d'azitromicina durant l'embaràs". Drugs.com. 2 de maig de 2019. [Consulta: 24 desembre 2019].
- ^ https://www.ema.europa.eu/documents/psusa/azithromycin-list-nationally-authorized-medicinal-products-psusa/00010491/202004_en.pdf[URL nua PDF]
- ^ Jump up to:un b c d e f g h i j k l "Azitromicina". La Societat Americana de Farmacèutics del Sistema de Salut. Arxivat de l'original el 5 September 2015. [Consulta: 1r agost 2015].
- ^ Jump up to:un b "Ús d'azitromicina durant la lactància materna" Arxivat de l'original el 5 September 2015. [Consulta: 4 setembre 2015].
- ^ "L'azitromicina atura el creixement dels bacteris" (en alemany). [Consulta: 24 desembre 2017].
- ^ Greenwood, David (2008). *Fàrmacs antimicrobians : crònica d'un triomf mèdic del segle XX* (1. publ. ed.). Oxford: Oxford University Press. p. 239. ISBN 9780199534845. Arxivat de l'original el 5 march 2016.
- ^ Jump up to:un b Alapi EM, Fischer J (2006). "Taula de classes analògiques seleccionades". A Fischer J, Ganellin CR (eds.). *Descobrimet de fàrmacs basat en anàlegs*. Weinheim: Wiley-Vch Verlag GmbH & Co. KGaA. Pàg 498. ISBN 978-3-527-31257-3.
- ^ Organització Mundial de la Salut (2019). *Llista model de medicaments essencials de l'Organització Mundial de la Salut: 21a llista 2019*. Ginebra: Organització Mundial de la Salut. hdl:10665/325771. OMS/MVP/EMP/IAU/2019.06. Llicència: CC BY-NC-SA 3.0 IGO.
- ^ Organització Mundial de la Salut (2018). *Antimicrobians d'importància crítica per a la medicina humana (6a revisió ed.)*. Ginebra: Organització Mundial de la Salut. hdl:10665/312266. ISBN 9789241515528. Llicència: CC BY-NC-SA 3.0 IGO. Arxivat de l'original el 22 October 2019.
- ^ Hamilton, Richart (2015). *Tarascon Pocket Pharmacopoeia 2015 Edició Lab-Coat Deluxe*. Jones & Bartlett Learning. ISBN 9781284057560.
- ^ "El Top 300 del 2019". ClinCalc. [Consulta: 16 octubre 2021].
- ^ "Azitromicina - Estadístiques d'ús de drogues". ClinCalc. [Consulta: 16 octubre 2021].
- ^ Taylor SP, Sellers E, Taylor BT (desembre de 2015). "Azitromicina per a la prevenció de les exacerbacions de la MPOC: el bo, el dolent i el lleig". *L'American Journal of Medicine*. 128 (12): 1362.e1-6. DOI:10.1016/j.amjmed.2015.07.032. 26291905 PMID.
- ^ Mandell LA, Wunderink RG, Anzueto A, Bartlett JG, Campbell GD, Dean NC, et al. (Març 2007). "Infectious Diseases Society of America/American Thoracic Society directrius de consens sobre el maneig de la pneumònia adquirida per la comunitat en adults". *Malalties Infeccioses Clíniques*. 44 Suppl 2: S27-72. DOI:10.1086/511159. pmc 7107997. 17278083 PMID.
- ^ Jump up to:un b "Infeccions gonocòcciques: directrius de tractament de MTS 2015". Arxivat de l'original el 1 March 2016.
- ^ Burton M, Habtamu E, Ho D, Gower EW (novembre 2015). "Intervencions per a la triquiassi tracomasi". *La base de dades Cochrane de revisions sistemàtiques*. 11 (11): CD004008. DOI:10.1002/14651858.CD004008.pub3. pmc 4661324. 26568232 PMID.
- ^ Rosenfeld RM, Piccirillo JF, Chandrasekhar SS, Brook I, Ashok Kumar K, Kramper M, et al. (Abril 2015). "Guia de pràctica clínica (actualització): sinusitis de l'adult". *Otorinolaringologia–Cirurgia de Cap i Coll*. 152 (2 Suppl): S1–S39. DOI:10.1177/0194599815572097. 25832968 PMID.
- ^ Hauk L (abril 2014). "L'AAP publica directrius sobre el diagnòstic i el maneig de la sinusitis bacteriana aguda en nens d'un a 18 anys". *Metge de família nord-americà*. 89 (8): 676-81. 24784128 PMID.
- ^ Neff MJ (juny 2004). "AAP, AAFP publiquen directrius sobre diagnòstic i maneig de l'otitis mitjana aguda". *Metge de família nord-americà*. 69 (11): 2713-5. 15202704 PMID.
- ^ Randel A (Setembre 2013). "Directriu d'actualització de l'IDSA per al maneig de la faringitis estreptococ del grup A". *Metge de família nord-americà*. 88 (5): 338-40. 24010402 PMID.
- ^ El diari The Guardian: Brot de 'Super-gonorrhoea' a Leeds, 18 de setembre de 2015 Arxivat el 18 de setembre de 2015 a Wayback Machine.
- ^ *Ressenyes il·lustrades de Lippincott: Farmacologia Sisena Edició*. Pàg 506.

- ^ Jump up to:a b "US azithromycin label" (PDF). FDA. February 2016. Archived (PDF) from the original on 23 November 2016.
- ^ Simoons S, Laekeman G, Decramer M (May 2013). "Preventing COPD exacerbations with macrolides: a review and budget impact analysis". *Respiratory Medicine*. 107 (5): 637–48. doi:10.1016/j.rmed.2012.12.019. PMID 23352223.
- ^ Gotfried MH (February 2004). "Macrolides for the treatment of chronic sinusitis, asthma, and COPD". *Chest*. 125 (2 Suppl): 52S–60S, quiz 60S-61S. doi:10.1378/chest.125.2_suppl.52S. PMID 14872001.
- ^ Zarogoulidis P, Papanas N, Kioumis I, Chatzaki E, Maltezos E, Zarogoulidis K (May 2012). "Macrolides: from in vitro anti-inflammatory and immunomodulatory properties to clinical practice in respiratory diseases". *European Journal of Clinical Pharmacology*. 68 (5): 479–503. doi:10.1007/s00228-011-1161-x. PMID 22105373. S2CID 1904304.
- ^ Steel HC, Theron AJ, Cockeran R, Anderson R, Feldman C (2012). "Pathogen- and host-directed anti-inflammatory activities of macrolide antibiotics". *Mediators of Inflammation*. 2012: 584262. doi:10.1155/2012/584262. PMC 3388425. PMID 22778497.
- ^ Mori F, Pecorari L, Pantano S, Rossi ME, Pucci N, De Martino M, Novembre E (2014). "Azithromycin anaphylaxis in children". *International Journal of Immunopathology and Pharmacology*. 27 (1): 121–6. doi:10.1177/039463201402700116. PMID 24674687. S2CID 45729751.
- ^ Dart RC (2004). *Medical Toxicology*. Lippincott Williams & Wilkins. p. 23.
- ^ Tilelli JA, Smith KM, Pettignano R (Gener 2006). "Bradicàrrítia potencialment mortal després d'una sobredosi massiva d'azitromicina". *Farmacoteràpia*. 26 (1): 147-50. DOI:10.1592/phco.2006.26.1.147. 16506357 PMID. 43222966 S2CID.
- ^ Baselt R (2008). *Disposició de drogues tòxiques i productes químics en l'home (8a ed.)*. Foster City, CA: Publicacions biomèdiques. 132-133.
- ^ Grady D (16 maig 2012). "L'antibiòtic popular pot augmentar el risc de mort sobtada" *The New York Times*. Arxivat de l'original el 17 maig 2012. [Consulta: 18 maig 2012].
- ^ Ray WA, Murray KT, Hall K, Arbogast PG, Stein CM (Maig 2012). "L'azitromicina i el risc de mort cardiovascular". *The New England Journal of Medicine*. 366 (20): 1881-90. DOI:10.1056/NEJMoa1003833. pmc 3374857. pmid 22591294.
- ^ "Comunicació de seguretat de medicaments de la FDA: azitromicina (Zithromax o Zmax) i el risc de ritmes cardíacs potencialment mortals". *Fda*. 12 de març de 2013. Arxivat de l'original el 27 October 2016.
- ^ Maurizio R (Setembre 2011). "L'azitromicina bloqueja l'autofàgia i pot predisposar els pacients amb fibrosi quística a la infecció micobacteri". *J Clin Invest*. 121 (9): 3554-63. DOI:10.1172/JCI46095. pmc 3163956. 21804191 PMID.
- ^ Jump up to:un b "Zithromax - FDA que prescriu informació, efectes secundaris i usos". Arxivat de l'original el 14 October 2014. [Consulta: 10 octubre 2014].
- ^ Bani? Tomiši? Z (Desembre 2011). "La història de l'azitromicina". *Kemija U Industriji: ?asopis Kemi?ara I Kemijskih Inženjera Hrvatske*. 60 (12): 603-17.
- ^ Bani? Tomiši? Z (2011). "La història de l'azitromicina". *Kemija U Industriji*. 60 (12): 603-617. ISSN 0022-9830. Arxivat de l'original el 8 September 2017. [Consulta: 15 abril 2013].
- ^ "Azitromicina: Un antibiòtic més venut al món". *www.wipo.int*. Organització Mundial de la Propietat Intel·lectual. [Consulta: 18 juny 2019].
- ^ Hicks LA, Taylor TH, Hunkler RJ (abril 2013). "Prescripció d'antibiòtics ambulatoris dels EUA, 2010". *The New England Journal of Medicine*. 368 (15): 1461-2. DOI:10.1056/NEJMc1212055. 23574140 PMID.
- ^ Hicks LA, Taylor TH, Hunkler RJ (Setembre 2013). "Més sobre la prescripció d'antibiòtics ambulatoris dels EUA, 2010". *The New England Journal of Medicine*. 369 (12): 1175-6. DOI:10.1056/NEJMc1306863. 24047077 PMID.
- ^ "Receptes ambulatoris d'antibiòtics - Estats Units, 2017 - Comunitat - Ús d'antibiòtics". *Centres per al Control i la Prevenció de Malalties (CDC)*. 26 de març de 2020. [Consulta: 30 març 2020].
- ^ Popp M, Stegemann M, Riemer M, Metzendorf M, Romero CS, Mikolajewska A, Kranke P, Meybohm P, Skoetz N, Weibel S (22 d'octubre de 2021). "Antibiòtics d'intervenció per al tractament de la COVID-19". *Base de dades Cochrane de revisions sistemàtiques*. 10: CD015025. DOI:10.1002/14651858.CD015025. pmc 8536098. 34679203 PMID.
- ^ "L'assaig de la plataforma descarta tractaments per a la COVID-19" *Evidència NIHR (resum en anglès simple)*. 31 de maig de 2022.

Enllaços externs

Scholia té un perfil per azitromicina (Q165399).

mostrar

v
t
e

Antibacterians que inhibeixen la síntesi de proteïnes (J01A, J01B, J01F, J01G, QJ01XQ)

Portal:
Medicina

Categories:

Agents antimalàrics
Invencions croates
Compostos de dimetilamino
Antibiòtics macròlids
Marques de Pfizer
Medicaments essencials de l'Organització Mundial de la Salut