

Rx Thuốc bán theo đơn

AZITHROMYCIN

(Viên nang Azithromycin 250mg)

Thành phần: Mỗi viên nang chứa:

Azithromycin dihydrat tương đương.....250mg Azithromycin

Tá dược: Cellulose vi tinh thể PH 101, lactose monohydrat, polyvinyl pyrrolidon K30, talcum, magnesi stearat, Sodium lauryl sulfat vừa đủ.....1 viên.

Được lực học:

- **Cơ chế tác dụng:** Azithromycin là kháng sinh kim khuẩn thuộc nhóm macrolid. Thuốc ức chế tổng hợp protein của tế bào vi khuẩn do gắn vào tiểu đơn vị 50S của ribosom, ngăn cản sự chuyển vị peptidyl-ARNt từ vị trí tiếp nhận sang vị trí cho nên các aminoacyl-ARN mới không thể vào vị trí tiếp nhận, do đó các acid amin không thể gắn vào chuỗi peptid đang được thành lập.

- **Phổ tác dụng:** Azithromycin là một kháng sinh mới có hoạt phổ rộng, tuy nhiên cũng đã có kháng chéo với erythromycin, vì vậy cần cân nhắc cần thận khi sử dụng azithromycin do đã lan rộng vi khuẩn kháng macrolid ở Việt Nam.

Azithromycin có tác dụng tốt trên các vi khuẩn gram dương như *Streptococcus*, *Pneumococcus*, *Staphylococcus aureus*. Các nghiên cứu tiến hành ở Việt Nam cho thấy các loài này kháng nhóm macrolid khoảng 40%, vì vậy khả năng sử dụng azithromycin bị hạn chế ít nhiều.

Một số chủng vi khuẩn khác cũng rất nhạy cảm với azithromycin như:

Corynebacterium diphtheriae, *Clostridium perfringens*, *Peptostreptococcus* và *Propionibacterium acnes*. Các chủng vi sinh vật kháng erythromycin cũng có thể kháng cả azithromycin như những chủng Gram dương, kể cả các loài *Enterococcus* và hầu hết các chủng *Staphylococcus* kháng methicilin đã hoàn toàn kháng đối với azithromycin.

Azithromycin có tác dụng tốt trên vi khuẩn Gram âm như: *Haemophilis influenzae*, *parainfluenzae* và *ducreyi*, *Moraxella pneumophila*, *Bordetella pertussis* và *parapertussis*, *Neisseria gonorrhoeae* và *Campylobacter* sp.

Ngoài ra, kháng sinh này cũng có hiệu quả với *Listeria monocytogenes*, *Mycobacterium avium*, *Mycoplasma pneumoniae* và *hominis*, *Ureaplasma urealyticum*, *Toxoplasma gondii*, *Chlamydia trachomatis* và *Chlamydia pneumoniae*, *Treponema pallidum* và *Borrelia burgdorferi*.

Azithromycin có tác dụng vừa phải trên các vi khuẩn Gram âm như *E. coli*, *Salmonella enteritis*, và *Salmonella typhi*, *Enterobacter*, *Acromonas hydrophilia*, *Klebsiella*. Các chủng Gram âm kháng azithromycin là *Proteus*, *Serratia*, *Pseudomonas aeruginosa* và *Morganella*.

Nhìn chung, azithromycin tác dụng trên vi khuẩn Gram dương yếu hơn một chút so với erythromycin nhưng mạnh hơn trên một số vi khuẩn Gram âm trong đó có *Haemophilus*.

Được động học:

- **Hấp thu:** Sau khi uống, azithromycin phân bố rộng rãi trong cơ thể, sinh khả dụng khoảng 40% và đạt nồng độ tối đa trong huyết tương trong vòng từ 2 đến 3 giờ. Thức ăn làm giảm khả năng hấp thu azithromycin khoảng 50%.

- **Phân bố:** Thuốc được phân bố chủ yếu trong các mô như: phổi, amidan, tiền tuyến tuyến, bạch cầu hạt và đại thực bào, cao hơn trong máu nhiều lần (khoảng 50 lần nồng độ tối đa tìm thấy trong huyết tương). Nồng độ của thuốc trong hệ thống thần kinh trung ương rất thấp.

- **Thải trừ:** Một lượng nhỏ azithromycin bị khử methyl trong gan và được thải trừ qua mật một phần ở dạng không biến đổi và một phần ở dạng chuyển hoá. Khoảng 6% liều uống thải trừ qua nước tiểu trong vòng 72 giờ dưới dạng không biến đổi. Thời gian bán thải của thuốc từ 2 đến 4 ngày.

Chỉ định:

Thuốc được chỉ định dùng trong các trường hợp nhiễm khuẩn do các vi khuẩn nhạy cảm với azithromycin như:

Nhiễm khuẩn đường hô hấp dưới: Viêm phế quản, viêm phổi.

- Các nhiễm khuẩn da và mô mềm.
- Nhiễm khuẩn đường hô hấp trên: viêm tai giữa, viêm xoang, viêm họng và viêm amidan.

- Bệnh lây nhiễm qua đường tình dục ở cả nam và nữ. Azithromycin được dùng điều trị nhiễm khuẩn đường sinh dục chưa biến chứng do *Chlamydia trachomatis* hoặc *Neisseria gonorrhoeae* không đa kháng.

Liều dùng và cách dùng:

Azithromycin dùng một lần mỗi ngày, uống 1 giờ trước bữa ăn hoặc 2 giờ sau khi ăn.

Người lớn: Điều trị bệnh lây lan qua đường tình dục như viêm cổ tử cung, viêm niệu đạo do nhiễm *Chlamydia trachomatis* với một liều duy nhất 1 g.

Các chỉ định khác (viêm phế quản, viêm phổi, viêm họng, nhiễm khuẩn da và mô mềm): Tổng liều 6 viên Azithromycin chia thành 3 ngày (liều pháp 3 ngày), mỗi ngày 2 viên hoặc ngày đầu tiên uống một liều 500 mg và dùng 4 ngày tiếp theo với liều đơn 250 mg/ngày.

- Trẻ em: Liều gợi ý cho trẻ ngày đầu là 10 mg/kg thể trọng, tiếp theo từ ngày thứ 2 đến ngày thứ 5 là 5 mg/kg/lần x 1 lần/ngày.

Chống chỉ định: Không sử dụng cho người bệnh quá mẫn với azithromycin hay bất kỳ kháng sinh nào thuộc nhóm macrolid.

Thận trọng:

Cần thận trọng khi sử dụng azithromycin và các macrolid khác vì khả năng gây dị ứng như phù thần kinh mạch và sốc phản vệ rất nguy hiểm (tuy ít xảy ra).

Cũng như với các kháng sinh khác trong quá trình sử dụng thuốc phải quan

Tương tác thuốc:

Tình trạng giảm độ acid dạ dày khi điều trị bằng esomeprazol có thể làm tăng hay giảm sự hấp thu của các thuốc khác nếu cơ chế hấp thu của các thuốc này bị ảnh hưởng bởi độ acid dạ dày. Giống như các thuốc ức chế tiết acid dịch vị khác hay thuốc kháng acid, sự hấp thu của ketoconazole và itraconazole có thể giảm trong khi điều trị với esomeprazol.

Esomeprazol ức chế CYP2C19, do vậy khi esomeprazol được dùng chung với các thuốc chuyển hóa qua CYP2C19 như diazepam, citalopram, imipramine, clomipramine, phenytoin..., nồng độ các thuốc này trong huyết tương có thể tăng và cần giảm liều dùng.

Tác dụng không mong muốn của thuốc:

Thường gặp: ADR > 1/100

Toàn thân: Đau đầu, chóng mặt, ban ngoài da

Tiêu hóa: Buồn nôn, nôn, đau bụng, tiêu chảy, táo bón, đầy hơi, khô miệng

Ít gặp: 1/1000 < ADR < 1/100

Toàn thân: Mệt mỏi, mất ngủ, buồn ngủ, phát ban, ngứa

Rối loạn thị giác

Hiếm gặp: ADR < 1/1000

Toàn thân: Sốt, đỏ mủ hời, phù ngoại biên, mẫn cảm với ánh sáng, phản ứng quá mẫn (bao gồm mày đay, phù mạch, co thắt phế quản, sốc phản vệ).

Thần kinh trung ương: Kích động, trầm cảm, lú lẫn có hồi phục, ảo giác ở người bệnh nặng

Huyết học: Chứng mất bạch cầu hạt, giảm bạch cầu, giảm tiểu cầu

Gan: Tăng enzym gan, viêm gan, vàng da, suy chức năng gan

Tiêu hóa: Rối loạn vị giác

Cơ xương: Đau khớp, đau cơ

Tiết niệu: Viêm thận kẽ

Dạ: Ban mọng nước, hội chứng Stevens-Johnson, hoại tử biểu bì nhiễm độc, viêm da

Do làm giảm độ acid trong dạ dày, các thuốc ức chế bơm proton có thể làm tăng nguy cơ nhiễm khuẩn ở đường tiêu hóa.

Quá liều và cách xử trí:

Cho đến nay có rất ít kinh nghiệm về việc dùng quá liều có chủ đích. Các triệu chứng được mô tả có liên quan đến việc dùng liều uống 280 mg là các triệu chứng trên đường tiêu hóa và tình trạng yếu ớt. Các liều đơn esomeprazol dạng uống 80 mg và dạng tĩnh mạch 100mg vẫn an toàn khi dùng. Chưa có chất giải độc đặc hiệu. Esomeprazol gắn kết mạnh với protein huyết tương và vì vậy không dễ dàng bị phân tách. Trong trường hợp quá liều, nên điều trị triệu chứng và sử dụng các biện pháp hỗ trợ tổng quát.

Đặc tính dược lực học:

Nhóm dược lý: Thuốc ức chế bơm proton

Mã ATC: A02BC05

Esomeprazol là dạng đồng phân S-của omeprazol và làm giảm sự bài tiết acid dạ dày bằng một cơ chế tác động chuyên biệt. Thuốc là chất ức chế đặc hiệu bơm acid ở tế bào thành. Cả hai dạng đồng phân R-và S-của omeprazole đều có tác động dược lực học tương tự. Esomeprazol là một chất kiềm yếu, được tập trung và biến đổi thành dạng có hoạt tính trong môi trường acid cao ở ống tiêu quản chế tiết của tế bào thành, tại đây thuốc ức chế men H⁺K⁺-ATPase (bơm acid) và ức chế cả sự tiết dịch cơ bản lẫn sự tiết dịch do kích thích.

Đặc tính dược động học:

Esomeprazol hấp thu nhanh, nồng độ đỉnh huyết tương đạt được sau khi uống 1-2 giờ. Sinh khả dụng tuyệt đối là 50% sau khi uống liều đơn 20 mg và tăng lên 68% sau khi uống liều lặp lại ngày 1 lần. Thức ăn làm chậm và giảm hấp thu esomeprazol, diện tích dưới đường cong (AUC) sau khi uống một liều duy nhất esomeprazol 40mg vào bữa ăn so với lúc đói giảm từ 33-53%, esomeprazol không bền trong môi trường acid. Khoảng 97% esomeprazol gắn vào protein huyết tương. Thể tích phân bố khi nồng độ thuốc ổn định ở người tình nguyện khỏe mạnh là 16 lít. Thuốc chuyển hóa chủ yếu ở gan nhờ isoenzym CYP2C19, hệ enzym cytochrome P450, thành các chất chuyển hóa hydroxyl và desmethyl không còn hoạt tính. Phần còn lại được chuyển hóa qua isoenzym CYP3A4 thành esomeprazol sulfon. Khi dùng nhắc lại, chuyển hóa bước đầu qua gan và độ thanh thải của thuốc giảm, có thể do isoenzym CYP2C19 bị ức chế. Tuy nhiên không có hiện tượng tích lũy thuốc khi dùng mỗi ngày một lần. Ở một số người vì thiếu CYP2C19 do di truyền (15-20% người châu Á), nên làm chậm chuyển hóa esomeprazol, dẫn đến giá trị AUC tăng cao khoảng 2 lần so với người có đủ enzym. Ở người suy gan nặng, giá trị AUC ở tình trạng ổn định cao hơn 2 - 3 lần so với người có chức năng gan bình thường, vì vậy phải giảm liều esomeprazol ở những người bệnh này, liều dùng không quá 20mg/ngày

Nửa đời thải trừ trong huyết tương 1 - 1,5 giờ Nồng độ đỉnh trung bình của thuốc ở dạng uống tương ứng trong huyết tương là khoảng 4,6mcml/L. Các chất chuyển hóa chính của esomeprazol không ảnh hưởng đến sự tiết acid dạ dày. Khoảng 80% esomeprazol liều uống được bài tiết qua nước tiểu dưới dạng các chất chuyển hóa, phần còn lại qua phân. Ít hơn 1% thuốc được tìm thấy trong nước tiểu dưới dạng không đổi.

Quy cách đóng gói: Hộp 3 vỉ x 10 viên.

Bảo quản: Bảo quản nơi khô mát, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.

Hạn dùng: 24 tháng kể từ ngày sản xuất.

Không dùng thuốc quá hạn sử dụng.

Tiêu chuẩn chất lượng: Tiêu chuẩn cơ sở

Nhà sản xuất:

BHARAT PARENTERALS LTD

Địa chỉ: Survey No. 144 & 146, Jarod Samlaya, Road, Tal-Savli, City: Haripura,

Dist: Vadodara, Ấn Độ.