

ERITROMICINA ESTOLATO

CAS NUMBER: 3521-62-8

DCB: 03494

PESO MOLECULAR: 1056.40

FORMULA MOLECULAR: C₄₀H₇₁N₁₄.C₁₂H₂₆O₄S



INTRODUÇÃO

É um antibiótico macrólido bacteriostático, produzido por uma cepa de *Streptomyces erythreus*, não obstante pode ser bactericida em concentrações elevadas ou quando utilizado contra microrganismos altamente sensíveis. Acredita-se que penetre na membrana da célula bacteriana e se une de forma reversível à subunidade 50 S dos ribossomas bacterianos ou perto de "P" ou local doador, de forma a bloquear a união do tRNA (RNA de transferência) ao local doador. É evitada a translocação de peptídeos de "A" ou local receptor a "P" ou local doador, e conseqüentemente a síntese de proteínas é inibida. A eritromicina somente é eficaz frente a microrganismos que se dividem de forma ativa. Administrada por via oral é absorvida com facilidade e rapidamente metaboliza-se no fígado de forma parcial a metabólitos inativos e pode ser acumulada em pacientes com doença hepática grave. Etilsuccinato de eritromicina: é hidrolisado em fármaco livre no trato gastrointestinal e no sangue. Estolato de eritromicina: é dissociado no éster propanoato no trato gastrointestinal, é absorvido e, mais tarde, hidrolisado parcialmente ao fármaco livre no sangue. Estearato de eritromicina: é dissociado do fármaco livre no trato gastrointestinal. Sua união às proteínas é alta, obtendo-se máxima concentração plasmática em um período de 1 a 4 horas. É eliminada por via hepática (pela concentração no fígado e a excreção na bile). Via renal (por filtração glomerular): de 2% a 5%. É excretada inalterada após a administração oral; de 10% a 15% são excretados inalterados após a administração intravenosa.

INDICAÇÕES

- Gonorréia produzida por *Neisseria gonorrhoeae*
- Pneumonia por *Mycoplasma pneumoniae*

- Febre reumática
- Infecções de pele e tecidos brandos produzidas por *S. epidermidis* e *Staphylococcus aureus*
- Uretrite não-gonocócica
- Difteria produzida por *Corynebacterium diphteriae*
- Endocardite bacteriana em pacientes alérgicos a penicilina
- Faringite bacteriana por *Streptococcus epidermidis*
- Infecções produzidas por *Chlamydia trachomatis*: conjuntivite do recém-nascido, pneumonia da infância, infecções urogenitais durante a gravidez.

CONCENTRAÇÃO RECOMENDADA

Adultos: a dose usual é de 250mg a cada 6 horas, que pode ser aumentada até 4g ou mais ao dia, de acordo com a gravidade da infecção.

Dose usual em pediatria: 15 a 50mg/kg/dia em doses divididas (a cada 12 horas); em infecções mais graves, a dose pode ser duplicada. Tanto em adultos como em crianças pode ser administrada a metade da dose total diária a cada 12 horas.

Em infecções estreptocócicas a dose usual é de 20 a 50mg/kg/dia em doses divididas. O tratamento de infecções por estreptococos beta-hemolíticos do grupo A deve ser realizado durante 10 dias.

Na conjuntivite do recém-nascido por *C. trachomatis*, o tratamento consiste numa suspensão de eritromicina oral, em doses de 50mg/kg/dia divididos em 4 ingestões durante pelo menos 2 semanas.

Infecções urogenitais durante a gravidez: dose sugerida de 500mg por via oral, 4 vezes ao dia durante 7 dias, pelo menos; em caso de intolerância a este tratamento, poderão ser indicados 250mg 4 vezes ao dia, durante 14 dias.

EFEITOS COLATERAIS

As reações mais freqüentes são gastrintestinais: mal-estar e cólica abdominal. As náuseas, vômitos e diarreias se apresentam com pouca freqüência com doses orais habituais. Em tratamentos prolongados ou repetidos pode haver a proliferação excessiva de bactérias e fungos não-sensíveis. Nestes casos, a droga deve ser suspensa e deve ser estabelecido o tratamento apropriado. Foram apresentadas reações alérgicas leves como urticária e erupção cutânea. Em alguns casos foram informadas perdas reversíveis da audição, principalmente em pacientes com insuficiência renal ou naqueles que receberam doses altas de eritromicina.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Em pacientes que estiveram recebendo doses altas de teofilina, a administração de eritromicina pode aumentar os níveis séricos de teofilina e a possibilidade de esta produzir toxicidade. Nestes casos, a dose de teofilina deve ser diminuída. Poderá haver uma inibição competitiva entre eritromicina, clindamicina, lincomicina e cloranfenicol, já que competem pelos mesmos receptores celulares. Pode aumentar o tempo de protrombina ao ser administrada com anticoagulantes orais. A administração conjunta de eritromicina com carbamazepina ou digoxina produz uma elevação dos níveis plasmáticos dessas drogas, o que ocasiona toxicidade da carbamazepina ou digoxina em alguns pacientes. Em alguns casos são observadas reações isquêmicas quando é administrada com ergotamina ou fármacos que a contenham. Aumenta as concentrações séricas de ciclosporina, o que acrescenta um risco de nefrotoxicidade.

CONTRA INDICAÇÕES

Pacientes com hipersensibilidade conhecida ao antibiótico. A relação risco-benefício deverá ser avaliada em pacientes com disfunção hepática ou perda de audição.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

1. P.R. Vade-mécum Brasil. 2006/2007
2. ANFARMAG. Manual de equivalência – 2ª edição. São Paulo. 2006.

