

Organizadores:

Ellen Ágatta Marinho Silva

Júlio Araújo Rendeiro

Eduarda Batista Logrado

Ayniere Sousa Soares

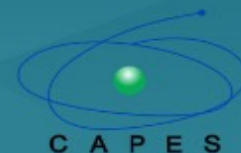
Thiago Cardoso Vianna

Carla Nogueira Soares

Ivete Furtado Ribeiro Caldas

Anderson Bentes de Lima

Priscila Xavier de Araújo



FARMACOTERAPIA

Antimicrobianos Utilizados na Atenção
Básica e em Pequenas Cirurgias

2021



2
vol

**Ellen Ágatta Marinho Silva
Júlio Araújo Rendeiro
Eduarda Batista Logrado
Ayniere Sousa Soares
Thiago Cardoso Vianna
Carla Nogueira Soares
Ivete Furtado Ribeiro Caldas
Anderson Bentes de Lima
Priscila Xavier de Araújo**

FARMACOTERAPIA

ANTIMICROBIANOS UTILIZADOS NA

ATENÇÃO BÁSICA E EM PEQUENAS CIRURGIAS

Vol. 02

EDITORA PASCAL

2021

2021 - Copyright© da Editora Pascal

Editor Chefe: Prof. Dr. Patrício Moreira de Araújo Filho
Edição e Diagramação: Eduardo Mendonça Pinheiro
Edição de Arte: Marcos Clyver dos Santos Oliveira
Bibliotecária: Rayssa Crithália Viana da Silva – CRB-13/904
Revisão: Autores

Conselho Editorial

Dr^a. Samantha Ariadne Alves de Freitas
Dr.^a Anna Christina Sanazario de Oliveira
Dr. Aruanã Joaquim Matheus Costa Rodrigues Pinheiro
Dr^a. Elba Pereira Chaves
Dr^a. Michela Costa Batista
Dr^a. Ildenice Nogueira Monteiro
Dr^a. Eliane Rosa da Silva Dilkin
MSc. Érica Mendonça Pinheiro

Dados Internacionais de Catalogação na Publicação (CIP)

L732v2

Coletânea Farmacoterapia: antimicrobianos utilizados na atenção básica e em pequenas cirurgias / Ellen Ágatta Marinho Silva, Júlio Araújo Rendeiro, Eduarda Batista Logrado, Ayniere Sousa Soares, Thiago Cardoso Vianna, Carla Nogueira Soares, Ivete Furtado Ribeiro Caldas, Anderson Bentes de Lima, Priscila Xavier de Araújo. — São Luís: Editora Pascal, 2021.

194 f. ; il. : (Farmacoterapia, v. 02)

Formato: PDF

Modo de acesso: World Wide Web

ISBN: 978-65-86707-73-1

D.O.I.: 10.29327/546986

1. Farmacoterapia. 2. Antimicrobianos. 3. Atenção Básica. 4. Pequenas cirurgias. I. Silva, Ellen Ágatta Marinho. II. Rendeiro, Júlio Araújo. III. Logrado, Eduarda Batista. IV. Soares, Ayniere Sousa V. Vianna, Thiago Cardoso. VI. Soares, Carla Nogueira. VII. Caldas, Ivete Furtado Ribeiro. VIII. Lima, Anderson Bentes de. IX. Araújo, Priscila Xavier de. X. Título.

CDD: 615.1:615.28(08)

O conteúdo dos artigos e seus dados em sua forma, correção e confiabilidade são de responsabilidade exclusiva dos autores.

2021

www.editorapascal.com.br



PREFÁCIO

O advento dos antimicrobianos foi um passo fundamental para a humanidade. Os antibióticos foram de extrema importância para o combate de diversas enfermidades ocasionadas por microrganismos como: bactérias, vírus e fungos. Pneumonias, micoses e doenças sexualmente transmissíveis que antes apresentavam uma mortalidade elevada, com a chegada desses medicamentos, tornaram-se menos avassaladoras para os pacientes, e aumentaram a sobrevivência dos enfermos.

Desse modo, o entendimento da farmacologia dos antimicrobianos torna-se necessária para o melhor cuidado do paciente o qual se encontra em um estado infeccioso. A necessidade da terapia medicamentosa antimicrobiana correta é um dos principais pontos debatidos no âmbito acadêmico. Em contraste, o conhecimento de quando não utilizar um medicamento antimicrobiano é tão importante quanto saber quando usar. Com isso, o amplo entendimento de tais assuntos é impreterível para a prática clínica.

Ademais, esse e-book tem como objetivo promover o amplo entendimento das bases farmacológicas dos antimicrobianos, separados pelas principais classes de medicamentos e indicações de uso.

O conteúdo a seguir objetiva o aprendizado e disponibilização de informações importantes para a prática clínica, no que tange antimicrobianos.

Autores



ORGANIZADORES

ELLEN ÁGATTA MARINHO SILVA

Técnica em Saneamento Básico e Ambiental pelo Instituto Federal de Educação, Ciência e Tecnologia do Pará. Graduanda do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII. Voluntária do projeto de extensão "Mil dias de alegria - Em defesa de uma vida saudável". Ligante da Liga Acadêmica Marabaense de Pediatria (LAMPED).

JÚLIO DE ARAÚJO RENDEIRO

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII. Diretor de Pesquisa da Liga Acadêmica de Cirurgia de Marabá (LACIM). Coordenador do Laboratório de Fisiologia e Saúde Baseado em Evidências (LABFISBE).

EDUARDA BATISTA LOGRADO

Graduanda do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII. Ligante da Liga Acadêmica Marabaense de Pediatria (LAMPED).

AYNIERE SOUSA SOARES

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII. Presidente da Liga do Trauma do Sudeste do Pará (LITRASP) da Universidade do Estado do Pará (UEPA).

CARLA NOGUEIRA SOARES

Fisioterapeuta, Especialista em Fisioterapia Cardiorrespiratória e Anatomia Funcional e Fisioterapia Intensiva Pediátrica e Neonatal pela Faculdade Unyleya, Mestre em Terapia Intensiva pela Sociedade Brasileira de Terapia Intensiva (SOBRATI), mestranda no programa de Cirurgia e Pesquisa Experimental (CIPE) da Universidade do Estado do Pará (UEPA)

THIAGO CARDOSO VIANNA

Cirurgião dentista. Habilitação em Odontologia Hospitalar. Especialista em Endodontia. Especialista em Ortodontia. Mestrando em Cirurgia e Pesquisa Experimental CIPE/UEPA.



ORGANIZADORES

IVETE FURTADO RIBEIRO CALDAS

Fisioterapeuta, Especialista em Fisioterapia Respiratória em Pediatria e Neonatologia pela Universidade Federal de São Paulo (UNIFESP), Mestre em Teoria e Prática do Comportamento pela Universidade Federal do Pará (UFPA), Doutora em Neurociências e Biologia Celular pela UFPA, Docente da Universidade do Estado do Pará (UEPA), Professora Permanente do Programa de Mestrado em Cirurgia e Pesquisa Experimental (CIPE) da UEPA e Coordenadora do Laboratório de Desenvolvimento Infantil (LADIN) da UEPA – Campus VIII.

ANDERSON BENTES DE LIMA

Farmacêutico, Doutor em Biotecnologia pela Universidade Federal do Pará (UFPA), Docente da Universidade do Estado do Pará (UEPA), Professor do Programa de Mestrado em Cirurgia e Pesquisa experimental (CIPE) da Universidade do Estado do Pará (UEPA)

PRISCILA XAVIER DE ARAÚJO

Farmacêutica, Especialista em Farmácia Magistral pela Oswaldo Cruz, Mestre em Farmacologia pela Universidade de São Paulo (USP), Doutora em Farmacologia pela Universidade Federal de São Paulo (UNIFESP), Professora Assistente I da Universidade do Estado do Pará (UEPA), Professora do Programa de Mestrado em Cirurgia e Pesquisa Experimental (CIPE) da Universidade do Estado do Pará (UEPA), Coordenadora do Laboratório de Farmacologia Clínica da UEPA Campus VIII.



AUTORES

ADRIELE FRANCISCA DA SILVA SOUZA

Graduanda em medicina pela Universidade do Estado do Pará (UEPA). Secretária da Liga do Trauma do Sudeste do Pará (LITRASP). Membro da Liga Acadêmica Marabaense de Pediatria (LAMPED). Membro do Laboratório de Desenvolvimento Infantil (LADIN). Membro-fundador da Liga Acadêmica de Anatomia Humana e Clínica (LIANAC).

AMANDA DA COSTA SILVEIRA

Cirurgiã dentista, Especialista em Endodontia e Prótese Dentária, Mestre em Clínica Odontológica pela Universidade de São Paulo (USP), Doutora em Biologia Parasitária pela Universidade Federal do Pará (UFPA), Docente Universidade do Estado do Pará (UEPA).

ANDREIA CARDOSO DA SILVA

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII.

ARIEL TAVARES SANTIAGO

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII.

CARLOS JAIME OLIVEIRA PAES

Enfermeiro, formado pela Universidade Federal do Pará. Especialista em Doenças Infecciosas e Parasitárias. Atua como enfermeiro assistencial em Unidade de Terapia Intensiva. Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA).

CESAR AUGUSTO MEDEIROS PAIVA RODRIGUES

Graduando em medicina pela Universidade do Estado do Pará (UEPA).

DAVI DA SILVA MARTINS

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII. Presidente da Liga Acadêmica Marabaense de Cardiologia (LAMAC). Diretor de extensão da Liga Acadêmica Marabaense de Pediatria (LAMPED).



AUTORES

GABRIELA DA SILVA LEANDRO

Graduanda do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Bolsista de iniciação científica (PIBIC). Vice-presidente da Liga Marabaense de Pediatria (LAMPED). Membro do Laboratório de Desenvolvimento Infantil (LADIN).

GABRIELA DE SOUZA LIMA

Graduanda em medicina pela Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII. Diretora científica da Liga Acadêmica Marabaense de Pediatria (LAMPED). Ligante da Liga do Trauma do Sudeste do Pará (LITRASP).

HELLEN GONÇALVES DA SILVA

Graduanda em medicina pela Universidade do Estado do Pará (UEPA). Diretora Financeira da Liga Acadêmica de Oncologia de Marabá (LAOM).

KAROLAINE GALVÃO PONTES

Graduanda em medicina pela Universidade do Estado do Pará (UEPA). Diretora de campo da Liga Acadêmica de Cirurgia de Marabá (LACIM). Membro do Laboratório de Fisiologia e Saúde Baseado em Evidências (LABFISBE).

KESSIA CASTRO DE SOUSA

Graduanda em medicina pela Universidade do Estado do Pará (UEPA). Ligante da Liga do Trauma do Sudeste do Pará (LITRASP).

KLEBER HENRIQUE DA SILVA BEZERRA

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII. Bolsista de iniciação científica PIBIC/FAPESPA. Membro da Liga Acadêmica de Oncologia de Marabá (LAOM). Membro da Liga Acadêmica Marabaense de Pediatria (LAMPED). Presidente do comitê local da IFMSA BRAZIL UEPA MARABÁ Coordenador regional Norte do Comitê Brasileiro de Ligas de Cancerologia (CoBraLC).

MARCELLE AGRA DE FREITAS

Graduanda em medicina pela Universidade do Estado do Pará (UEPA).



AUTORES

MARCELO DIAS FERREIRA JUNIOR

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). LVPI do Comitê UEPA Marabá da IFMSA BRAZIL. Diretor Geral de Produtos Atlético Águias.

MARCELO VAUGHAN LIMA DE OLIVEIRA

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII.

MATHEUS LEITE DE OLIVEIRA

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA). Membro do laboratório de Farmacologia Clínica da Universidade do Estado do Pará (UEPA), campus VIII.

TIAGO RIBEIRO

Graduando do curso de medicina da Universidade do Estado do Pará (UEPA).

WANDERSON THIAGO SANTOS NOLETO

Graduando em medicina pela Universidade do Estado do Pará (UEPA). Diretor Administrativo da Liga Acadêmica de Pediatria de Marabá (LAMPED).



SUMÁRIO

CAPÍTULO 1.....	14
ANTIBIÓTICOS	
RIFAMPICINA	15
RIFABUTINA	18
SULFAMETOXAZOL + TRIMETOPRIMA.....	20
SULFADIAZINA	23
FLUOCINOLONA ACETONIDA + SULFATO DE POLIMIXINA B + SULFATO DE NEOMICINA + CLORIDRATO DE LIDOCAÍNA	25
CLORIDRATO DE TETRACICLINA	27
CLORIDRATO DE MINOCICLINA	30
DOXICICLINA.....	33
NITROFURANTOÍNA	36
SULFATO DE AMICACINA	38
SULFATO DE ESTREPTOMICINA	41
SULFATO DE GENTAMICINA.....	44
TOBRAMICINA.....	47
LINEZOLIDA	50
AZITROMICINA DI-HIDRATADA.....	52
ESTOLATO DE ERITROMICINA	56
CLARITROMICINA	59
ESPIRAMICINA.....	62
AMOXICILINA	65
AMOXICILINA + CLAVULANATO DE POTÁSSIO	68
BENZILPENICILINA BENZATINA	71
BENZILPENICILINA POTÁSSICA	74
BENZILPENICILINA PROCAÍNA	77
FENOXIMETILPENICILINA POTÁSSICA	80
CEFALEXINA	83



SUMÁRIO

CEFUROXIMA	85
CEFTRIAXONA.....	87
CEFEPIMA.....	90
CEFTAROLINA	92
CLORANFENICOL.....	94
CLINDAMICINA	96
FOSFATO DE CLINDAMICINA	98
CIPROFLOXACINO	100
MOXIFLOXACINO	102

CAPÍTULO 2..... 105

ANTI-HELMÍNTÍASES

ALBENDAZOL.....	106
IVERMECTINA	109
PRAZIQUANTEL.....	112
DIETILCARBAMAZINA.....	116
OXAMNIQUINA.....	119

CAPÍTULO 3..... 121

ANTIFÚNGICOS

ITRACONAZOL	122
FLUCONAZOL	124
CETOCONAZOL.....	126
NITRATO DE MICONAZOL	128
NISTATINA	131



SUMÁRIO

CAPÍTULO 4..... 133

ANTIPROTOZOÁRIOS

DIFOSFATO DE CLOROQUINA	134
CLORIDRATO MEFLOQUINA.....	137
DIFOSFATO DE PRIMAQUINA	139
ISETIONATO DE PENTAMIDINA.....	141
BENZNIDAZOL	143
ANTIMONIATO DE MEGLUMINA	145
QUININA	147
PIRIMETAMINA.....	149
METRONIDAZOL.....	151
ARTEMETER + LUMEFANTRINA	154
ARTESUNATO + CLORIDRATO MEFLOQUINA	157

CAPÍTULO 5..... 159

ANTIRRETROVIRAIS

SULFATO DE ABACAVIR	160
RITONAVIR	162
TIPRANAVIR	164
ZIDOVUDINA	166
EFAVIRENZ	168
RALTEGRAVIR	170
ETRAVIRINA	172
FOSAMPRENAVIR	174
LOPINAVIR	176
FUMARATO DE TENOVIR DESOPROXILA.....	178
LAMIVUDINA.....	180
MARAVIROQUE.....	182



SUMÁRIO

NEVIRAPINA	184
ATAZANAVIR	186
ENFUVIRTIDA	188
DARUNAVIR	190
DOLUTEGRAVIR	192



CAPÍTULO 1

ANTIBIÓTICOS

ELLEN ÁGATTA MARINHO SILVA
GABRIELA DE SOUZA LIMA
ANDREIA CARDOSO DA SILVA
ARIEL TAVARES SANTIAGO
CARLOS JAIME OLIVIEIRA PAES
MARCELLE AGRA DE FREITAS
JÚLIO ARAÚJO RENDEIRO
EDUARDA BATISTA LOGRADO
THIAGO CARDOSO VIANNA
AYNIERE SOUSA SOARES
AMANDA DA COSTA SILVEIRA
PRISCILA XAVIER DE ARAÚJO



RIFAMPICINA

Suspensão Oral -- 20 mg/ml (2%)
Cápsulas -- 150 mg e 300 mg

→ Comprimidos dispersíveis e comprimido -- Rifampicina (300/150/75 mg) + Isoniazida (150/75/50 mg)

→ Comprimido -- Rifampicina (150 mg) + Isoniazida (75 mg) + Pirazinamida (400 mg) + Cloridrato de Etambutol (275 mg)

→ Comprimidos dispersíveis -- Rifampicina (75 mg) + Isoniazida (50 mg) + Pirazinamida (150 mg)

INDICAÇÕES

- Tuberculose;
- Endocardite;
- Osteomielite.

CLASSE

Macrolídeos.

CEPAS

A rifampicina age contra *Mycobacterium leprae*, *M.tuberculosis*, diversas outras micobactérias e bactérias gram-positivas e gram-negativas.

M. fortuitum é resistente.

MECANISMO DE AÇÃO

Agem inibindo a RNA-polimerase dependente de DNA das micobactérias, formando um complexo fármacoenzima estável. Dessa forma há bloqueio da transcrição, isto é, formação da cadeia na síntese de RNA (BRUTON, 2012).

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → Possui absorção adequada após administração oral. Devendo ser administrada de estômago vazio;
2. Distribuição → para todos os órgãos e líquidos. Níveis adequados no líquido cérebro-espinhal, mesmo na ausência de inflamação;
3. Excreção → bile nas fezes ou pela urina;
4. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → cinco horas.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Deve ser ingerido pela manhã, em jejum ou após 2 horas das refeições.

I. Tuberculose pulmonar e extrapulmonar (exceto a forma meningocéfálica)



RIFAMPICINA

Suspensão Oral -- 20 mg/ml (2%)
Cápsulas -- 150 mg e 300 mg

Adultos e crianças (≥ 10 anos de idade):

Esquema:

Fase intensiva (2 meses)

DOSE \rightarrow Rifampicina (150 mg), Isoniazida (75 mg), Pirazinamina (400 mg) e Etambutol (275 mg). Em comprimidos em doses fixas combinadas.

- 20 a 35 kg: 2 comprimidos;
- 36 a 50 kg: 3 comprimidos;
- 51 a 70 kg: 4 comprimidos;
- Acima de 70 kg: 5 comprimidos.

Fase de manutenção (4 meses)

DOSE \rightarrow Rifampicina (300 mg), Isoniazida (150 mg) ou Rifampicina (300 mg) e Isoniazida (150 mg). Em comprimidos em doses fixas combinadas.

- 20 a 35 kg: 1 comprimido 300/150 mg ou 2 comprimidos 150/75 mg;
- 36 a 50 kg: 1 comprimido 300/150 mg + 1 comprimido de 150/75 mg ou 3 comprimidos 150/75 mg;
- 51 a 70 kg: 2 comprimidos 300/150 mg ou 4 comprimidos 150/75 mg;
- Acima de 70 kg: 2 comprimidos 300/150 mg + 1 comprimido de 150/75 mg ou 5 comprimidos 150/75 mg.

Duração do tratamento: 6 meses.

REAÇÕES ADVERSAS

- Confere cor vermelho-alaranjado aos fluidos corporais, urina, suor, lágrimas e saliva;
- Reações gastrointestinais, náuseas, vômitos e diarreia;
- Reações dermatológicas, prurido e exantema;
- Reações hematológicas, trombocitopenia, neutropenia e anemia hemolítica aguda;
- Febre, calafrios e mialgias, provocando síndrome gripal quando administrada em altas doses em frequência inferior a 2 vezes por semana;
- Hepatotoxicidade observada em pacientes com fatores predisponentes, em alcoolistas e portadores de doença hepática.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a Rifampicina ao mesmo tempo com:

- Digoxina, cetoconazol, propranolol, anticoagulantes cumarínicos, barbituratos, contraceptivos orais e sulfonilureias, pois o medicamento pode induzir enzimas do citocromo P450 e dessa forma pode diminuir a meia vida de outros medicamentos que são biotransformados por esse sistema enzimático.



RIFAMPICINA

Suspensão Oral -- 20 mg/ml (2%)
Cápsulas -- 150 mg e 300 mg

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade;
- Hepatopatia grave, pois há risco de potencialização dos danos ao fígado;
- Uso de fármacos hepatotóxicos e contraceptivos orais;
- Insuficiência renal;
- Gravidez;
- Lactação;
- Não se recomenda para crianças com menos de 20 kg porque este produto não permite ajuste adequado das doses.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

MINISTÉRIO DA SAÚDE, MINISTÉRIO DA SAÚDE. Manual de recomendações para o controle da tuberculose no Brasil. 2019.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



RIFABUTINA

Cápsulas -- 150 mg

INDICAÇÕES

Tuberculose;
Infecções estafilocócicas.

CLASSE

Macrolídeos.

CEPAS

É ativa contra o *Mycobacterium leprae*, *M. tuberculosis*, assim como outras micobactérias e bactérias gram-positivas e gram-negativas.

MECANISMO DE AÇÃO

Agem inibindo a RNA-polimerase dependente de DNA das microbactérias, formando um complexo fármacoenzima estável.

Dessa forma há bloqueio da transcrição, isto é, formação da cadeia na síntese de RNA.

FARMACOCINÉTICA

Absorção → adequada após administração oral. Devendo ser administrada de estômago vazio;

Distribuição → para todos os órgãos e líquidos;

Ligação a proteínas plasmáticas → 85%;

Excreção → nas fezes ou pela urina como metabólitos.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

É recomendada no tratamento de tuberculose ativa quando é preciso associar ou manter inibidor de protease associado ao ritonavir (IP/r) no esquema antirretroviral, o que ocorre nas situações de intolerância, resistência ou contraindicação aos Inibidores da Transcriptase reversa não-análogo de nucleosídeo (ITRNN).

- A dose de rifabutina recomendada nesta situação é de 150 mg/dia.

REAÇÕES ADVERSAS

Geralmente bem tolerada, porém seus efeitos adversos mais comuns são:

- Exantema (4%);
- Intolerância gastrointestinal (3%);
- Neutropenia (2%).



RIFABUTINA

Cápsulas -- 150 mg

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a Rifabutina ao mesmo tempo com:

- Digoxina, cetoconazol, propranolol, anticoagulantes cumarínicos, barbituratos, contraceptivos orais e sulfonilureias, pois a rifabutina tem propriedade de indução das enzimas do citocromo P450.

Por isso, pode diminuir a meia vida desses medicamentos que são biotransformados por esse sistema enzimático.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade ao medicamento ou daqueles que contenham derivados da rifampicina.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Rifabutina de 2019. Acesso em: 01 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

MINISTÉRIO DA SAÚDE (BR). SECRETARIA-EXECUTIVA. Recomendações para o manejo da coinfeção TB-HIV em serviços de atenção especializada a pessoas vivendo com HIV/AIDS. 2013.

Anotações:



SULFAMETOXAZOL + TRIMETOPRIMA BACTRIM[®]

Suspensão oral -- 40 mg/ml + 8 mg/ml

Comprimidos -- 400 mg + 80 mg

Solução injetável -- 80 mg/ml + 16 mg/ml

INDICAÇÕES

- Infecções do trato urinário não complicadas;
- Infecções do trato respiratório;
- Infecções do trato gastrointestinal;
- Profilaxia para neutropênicos.

CLASSE

Trimetoprima – sulfametoxazol.

CEPAS

P. jiroveci, shigelose, infecções sistêmicas por salmonela, infecções do trato urinário, prostatite e algumas por micobacterias não tuberculosas.

Age contra a maioria das cepas de *Staphylococcus aureus*, e patógenos como pneumococo, *Haemophilus sp.*, *Moraxella catarrhalis* e *K. pneumoniae*.

MECANISMO DE AÇÃO

A atividade antimicrobiana do fármaco resulta de suas ações sinérgicas (sulfa e trimetoprima) sobre 2 etapas da via enzimática da síntese do ácido tetraidrofólico.

O tetraidofolato é essencial para as reações de transferência de carbono, que são essenciais para síntese do DNA bacteriano.

FARMACOCINÉTICA

As propriedades farmacocinéticas da trimetoprima (TMP) e do sulfametoxazol (SMZ) são muito semelhantes.

1. Absorção → Após administração oral, a TMP e o SMZ são rapidamente e quase completamente absorvidos na porção superior do trato gastrointestinal;
2. Distribuição → 45% de TMP e 66% de SMZ estão ligadas às proteínas plasmáticas. A TMP penetra melhor nos líquidos prostáticos e vaginais. TMP e SMZ são detectados nos tecidos fetais (placenta, fígado, pulmão), no sangue do cordão umbilical e líquido amniótico, indicando a transferência placentária de ambas as drogas. Ambas substâncias são excretadas pelo leite materno;
3. Metabolismo → Ambos são metabolizados pelo fígado;
4. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → média de 10 horas para TMP e 11 horas para SMZ;
5. Excreção → Ambas substâncias, assim como seus metabólitos, são eliminadas quase exclusivamente por via renal através de filtração glomerular e secreção tubular. Apenas uma pequena parte das substâncias é eliminada por via fecal.



SULFAMETOXAZOL + TRIMETOPRIMA BACTRIM[®]

Suspensão oral -- 40 mg/ml + 8 mg/ml

Comprimidos -- 400 mg + 80 mg

Solução injetável -- 80 mg/ml + 16 mg/ml

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral e endovenosa.

Adultos e crianças (> 12 anos):

DOSE

→ 1 comprimido de 800 mg de sulfametoxazol / 160 mg de trimetoprima, a cada 12 horas, ou seja, duas vezes ao dia depois das refeições.

→ 2 comprimidos de 400 mg de sulfametoxazol / 80 mg de trimetoprima a cada 12 horas, ou seja, duas vezes ao dia depois das refeições.

→ 8 a 20 mg/kg/dia de trimetoprima a cada 6 a 12 horas de forma injetável.

Crianças (≥ 2 meses):

DOSE

→ 6 a 12 mg/kg/dia de trimetoprima a cada 12 horas de forma injetável.

Duração do tratamento: Deve ser administrado por cinco a sete dias em infecções agudas. Se não houver melhora clínica após esse período, o paciente deve ser reavaliado.

REAÇÕES ADVERSAS

- Rashes cutâneos;
- Distúrbios gastrintestinais, como náuseas e vômitos;
- Glossite e estomatite;
- Megaloblastia, trombocitopenia e leucopenia, quando o paciente tem deficiência de folato;
- Sistema nervoso central, pode surgir depressão, cefaleia e alucinações;
- Disfunção renal irreversível, em pacientes com doença renal;

Obs.: A maioria dos efeitos adversos atingem a pele, sendo mais graves em idosos e mais comuns em pacientes com AIDS.

- Dermatite esfoliativa;
- Síndrome de Stevens Johnson;
- Necrólise epidérmica tóxica.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a sulfametoxazol + trimetoprima ao mesmo tempo com:

- Diuréticos;
- Depressores do sistema nervoso central, como antidepressivos;
- Medicamentos que contenham em sua



SULFAMETOXAZOL + TRIMETOPRIMA BACTRIM[®]

Suspensão oral -- 40 mg/ml + 8 mg/ml

Comprimidos -- 400 mg + 80 mg

Solução injetável -- 80 mg/ml + 16 mg/ml

fórmula: amantadina (medicamento antiviral e antiparkinsoniano), lamivudina (antirretroviral utilizado em pacientes portadores de HIV), ou memantina (utilizado em doença de Alzheimer), anti-diabéticos orais, ciclosporina (usada em transplantes, por exemplo), indometacina (usada em doenças reumatológicas, por exemplo), metotrexato (usado em doenças reumatológicas, por exemplo), pirimetamina (usada em infecções, como toxoplasmose, por exemplo) e varfarina (anticoagulante).

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade à sulfonamida, à trimetoprima ou a qualquer um dos componentes da formulação;

Pacientes portadores de doenças hepáticas renais e hepáticas graves.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Sulfametoxazol-Trimetoprima de 2019. Acesso em: 29 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:



SULFADIAZINA
LABDIAZINA[®]
Comprimidos -- 500 mg
SULFADIAZINA DE PRATA
DERMAZINE
Creme -- 10 mg/g (1%)

INDICAÇÕES

- Toxoplasmose;
- Alternativa na malária por *Plasmodium falciparum*;
- Na sua forma tópica, é usada em pacientes queimados para tratar infecções.

CLASSE

Sulfonamidas.

CEPAS

Inibem bactérias gram-positivas e gram-negativas, *Nocardia* sp., *Chlamydia trachomatis* e alguns protozoários.

Bactérias entéricas, como a *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Salmonella*, *Shigella* e *Enterobacter* sp., também são inibidas.

MECANISMO DE AÇÃO

As sulfonamidas têm efeito bacteriostático e inibem o metabolismo do ácido fólico, por mecanismo competitivo.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → administração oral é bem absorvida no intestino delgado;
2. Distribuição → Na circulação sanguínea, são ligadas a proteínas plasmáticas. Se distribuem pela água corporal. Penetram o líquido cerebrospinal. Penetram a barreira placentária e tecidos fetais;
3. Metabolização → metabolizadas pelo fígado;
4. Excreção → renal, filtração glomerular.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral e tópica.

I) Toxoplasmose

Adultos e crianças imunocompetentes:

DOSE → 500 a 1000 mg, 2 a 4 vezes ao dia.

Duração do tratamento: 4 a 6 semanas.

Administração tópica:

Aplica-se o medicamento na lesão limpa uma vez ao dia. Fazer curativo com gaze. Se a lesão for purulenta, administra-se o creme uma segunda vez ao dia. A sulfadiazina de prata é utilizada até que a ferida cicatrize.



SULFADIAZINA
LABDIAZINA[®]
Comprimidos -- 500 mg
SULFADIAZINA DE PRATA
DERMAZINE
Creme -- 10 mg/g (1%)

REAÇÕES ADVERSAS

- Nefrotoxicidade, devido a formação de cristais nos rins;
- Hipersensibilidade, como urticária, angioedema e síndrome de Stevens-Johnson;
- Anemia hemolítica em pacientes com deficiência de glicose-6-fosfato desidrogenase;
- Icterícia em recém-nascidos;
- A maioria dos pacientes não apresentam problemas com o uso do medicamento na pele.

Porém, pode ocorrer: argiria, descoloração da pele ou mucosas em razão da deposição do metal prata no uso por períodos longos.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a sulfadiazina ao mesmo tempo com:

- Anticoagulantes orais, metotrexato e fenitoína, pois pode potencializar os efeitos desses medicamentos;

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Sulfadiazina de 2018. Acesso em: 28 de abril de 2020.

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Sulfadiazina de Prata de 2019. Acesso em: 01 de maio de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

- É descrito na literatura médica interação da cimetidina com o uso tópico da sulfadiazina de prata, resultando em leucopenia.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Recém-nascidos;
- Crianças com menos de 2 meses;
- Gestantes a termo;
- Pacientes com deficiência de glicose-6-fosfato desidrogenase;
- Amamentação.

Anotações:



FLUOCINOLONA ACETONIDA + SULFATO DE POLIMIXINA B + SULFATO DE NEOMICINA + CLORIDRATO DE LIDOCAÍNA

Solução otológica -- 10.000 UI/ml + 3,500 mg/ml + 0,250 mg/ml + 20 mg/ml

INDICAÇÕES

- Otite externa;
- Doenças inflamatórias que respondem à terapia com corticoterapia na presença ou suspeita de infecção bacteriana.

CEPAS

Staphylococcus aureus e *Pseudomonas*.

MECANISMO DE AÇÃO

A terapêutica tópica das otites externas exige, em geral, a instituição simultânea de um medicamento capaz de corrigir o fator inflamatório e de um antibiótico eficaz contra os microrganismos mais habitualmente responsáveis por infecções auriculares.

É um medicamento eficaz nas síndromes otológicas externas, nas quais ao mesmo tempo em que corrige a inflamação e a infecção, faz desaparecer os sintomas subjetivos (prurido, ardor e dor).

A **fluocinolona acetonida** é o esteroide anti-inflamatório tópico que promove, de um modo rápido, a regressão da sintomatologia inflamatória ou alérgica e do quadro subjetivo que a acompanha.

A **polimixina B** é um antibiótico bactericida eficaz contra microrganismos gram-negativos comumente responsáveis pelas infecções auriculares.

A **neomicina**, antibiótico de largo espectro e de notável estabilidade, não só reforça a atividade da polimixina B sobre alguns microrganismos, como também aumenta o campo de ação antibiótica.

O **cloridrato de lidocaína**, como anestésico local, combate o sintoma dor, tão frequente nas afecções da orelha.

FARMACOCINÉTICA

1. Distribuição → Em veículo adequado, este medicamento se difunde nas secreções próprias das otites e chega à lesão, levando a cabo sua ação anti-inflamatória.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via tópica.

Adultos:

DOSE → 3 ou 4 gotas instiladas na orelha, 2 a 4 vezes ao dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Hipersensibilidade;
- Tontura e cefaleia;
- Distorção do paladar, sensação de formigamento em membros, alterações vi-



FLUCINOLONA ACETONIDA + SULFATO DE POLIMIXINA B + SULFATO DE NEOMICINA + CLORIDRATO DE LIDOCAÍNA

Solução otológica -- 10.000 UI/ml + 3,500 mg/ml + 0,250 mg/ml + 20 mg/ml

suas e distúrbios auditivos;

- Prurido, dor no local da aplicação e palidez;
- Hipertensão arterial;
- Distúrbios gastrointestinais;
- Distúrbios respiratórios.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- **Fluocinolona acetonida:** não há interações medicamentosas relevantes;
- **Polimixina B:** bloqueadores neuromusculares; antibióticos, como amicacina, penicilina G, ampicilina e cefalosporinas; antifúngicos; prednisona; ranitidina e vitaminas do complexo B e vitamina C;
- **Sulfato de neomicina:** bloqueadores neuromusculares; antibióticos; diuréticos; digoxina; anticoagulantes, como a varfarina e dicumarol; quinolonas e antineoplásicos;
- **Cloridrato de lidocaína:** broncodilatores; antiarrítmicos; antibióticos; antifúngico; digoxina; betabloqueadores e sulfas entre outros.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Fluocinolona acetonida + sulfato de polimixina b + sulfato de neomicina + cloridrato de lidocaína de 2019. Acesso em: 28 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade aos componentes da formulação;
- Infecções da orelha, micóticas ou virais, não tratadas;
- Herpes simples;
- Vacina;
- Varicela;
- Perfurações timpânicas.

Anotações:



CLORIDRATO DE TETRACICLINA TETRACICLINA

Pomada oftálmica -- 10 mg/g
Cápsula -- 500 mg

INDICAÇÕES

- Infecções intracelulares;
- Infecções por riquetsias;
- Tifo epidêmico;
- Linfogranuloma venéreo;
- Brucelose;
- Granuloma inguinal;
- Sífilis.

CLASSE

Tetraciclina.

CEPAS

Ação contra bactérias gram-positivas e gram-negativas e outros microrganismos.

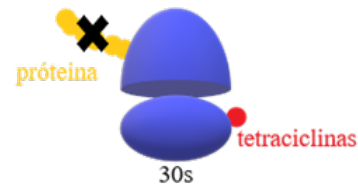
Mycoplasma e *Chlamydia*.

MECANISMO DE AÇÃO

A tetraciclina é obtida a partir da hidrólise de clortetraciclina.

As tetraciclina inibem a produção de proteínas nas bactérias por meio da ligação do fármaco à subunidade 30S dos ribossomos, sendo essa a organela responsável pela síntese proteica. Assim, se não há síntese de proteínas de forma eficaz a estrutura

bacteriana fica instável, o que atribui a esses fármacos a classificação como antibióticos bacteriostáticos.



Fonte: Autoria própria, 2020.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → 77% de absorção no trato gastrointestinal. A absorção sofre interferência quando administrado em concomitância ao leite e derivados;
2. Distribuição → tetraciclina possuem concentração no fígado;
3. Metabolismo → em parte, pela bile no intestino delgado, onde entram no ciclo enteroepático;
4. Excreção → principal via de eliminação é pela urina por meio da filtração glomerular.



CLORIDRATO DE TETRACICLINA TETRACICLINA Pomada oftálmica -- 10 mg/g Cápsula -- 500 mg

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral e oftálmica.

I) Gonorreia:

DOSE → 500 mg de 6 em 6 horas.

Duração do tratamento: durante 5 dias.

II) Brucelose:

DOSE → 500 mg de 6 em 6 horas, durante 3 semanas, administrado concomitantemente com 1 g de estreptomicina de 6 horas em 6 horas.

Duração do tratamento: durante 5 dias.

III) Sífilis:

DOSE → 500 mg de 6 horas em 6 horas.

Duração do tratamento: 15 dias ou 30 dias na sífilis tardia.

Administração oftálmica:

Aplicar diretamente no olho afetado a cada 2 horas ou com maior frequência de acordo com a severidade da infecção.

REAÇÕES ADVERSAS

- Atividade sobre tecidos ósseo e dentário;
- Manchas de descoloração nos dentes de crianças;
- Hepatotoxicidade;
- Efeitos gastrointestinais, quando a dose ultrapassa 2 g ao dia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a tetraciclina ao mesmo tempo com:

- Hidróxido de alumínio, bicarbonato de sódio, sais de cálcio e magnésio, pois haverá interferências na absorção da tetraciclina.



CLORIDRATO DE TETRACICLINA
TETRACICLINA
Pomada oftálmica -- 10 mg/g
Cápsula -- 500 mg

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade às tetraciclina;
- Gravidez;
- Amamentação.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde – Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Cloridrato de Tetraciclina de 2017. Acesso em 29 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



CLORIDRATO DE MINOCICLINA MINOCICLINA MINOMAX[®] Comprimido -- 100 mg

INDICAÇÕES

- Infecções intracelulares;
- Infecções por riquetsias;
- Tifo epidêmico;
- Linfogranuloma venéreo;
- Brucelose;
- Granuloma inguinal;
- Sífilis.

CLASSE

Tetraciclina.

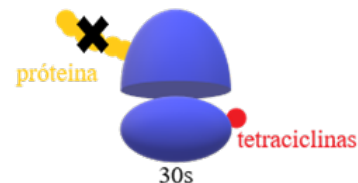
CEPAS

Ação contra bactérias gram-positivas e gram-negativas e outros microrganismos.

Mycoplasma e *Chlamydia*.

MECANISMO DE AÇÃO

As tetraciclinas inibem a produção de proteínas nas bactérias por meio da ligação do fármaco à subunidade 30S dos ribossomos, sendo essa a organela responsável pela síntese proteica. Assim, se não há síntese de proteínas de forma eficaz a estrutura bacteriana fica instável, o que atribui a esses fármacos a classificação como antibióticos bacteriostáticos.



Fonte: Autoria própria, 2020.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → de forma variável ao longo do trato gastrointestinal, sendo mais bem absorvidas no estômago e intestino delgado. Sendo que 95% é absorvida no trato gastrointestinal. Absorção não sofre interferência quando concomitante a leite e derivados;
2. Distribuição → possuem concentração no fígado;
3. Metabolismo → em parte, pela bile no



CLORIDRATO DE MINOCICLINA
MINOCICLINA
MINOMAX®
Comprimido -- 100 mg

intestino delgado, onde entram no ciclo enteroepático;

4. Excreção → pela urina por meio da filtração glomerular.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 200 mg, como dose inicial, seguida de 100 mg em 12 em 12 horas.

Crianças > 8 anos:

DOSE → 4 mg/kg, inicialmente, seguido de 2 mg/kg em 12 em 12 horas.

Duração do tratamento:

- Sífilis: 10 a 15 dias.
- Uretrite gonocócica não complicada no homem: 5 dias.
- Infecções uretrais, endocervicais ou retais não complicadas: 7 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- Atividade sobre tecidos ósseo e dentário;
- Manchas de descoloração nos dentes de crianças;
- Hepatotoxicidade;
- Efeitos gastrointestinais, quando a dose ultrapassa 2 g ao dia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a minociclina ao mesmo tempo com:

- Hidróxido de alumínio, bicarbonato de sódio, sais de cálcio e magnésio, pois a minociclina sofre interferências na absorção;
- Pacientes sob terapia anticoagulante podem requerer redução posológica do anticoagulante, visto que as tetraciclina podem deprimir a atividade da protrombina plasmática.



CLORIDRATO DE MINOCICLINA
MINOCICLINA
MINOMAX[®]
Comprimido -- 100 mg

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade às tetraciclinas.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde – Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Cloridrato de Minociclina. Acesso em 29 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



DOXICICLINA VIBRAMICINA ®

Comprimido -- 100 mg
Pó para solução injetável -- 100 mg

INDICAÇÕES

- Doença inflamatória pélvica;
- Exacerbação bronquite crônica;
- Malária *falciparum*;
- Trauma - ferimentos corto-contusos em partes moles.

CLASSE

Tetraciclina.

CEPAS

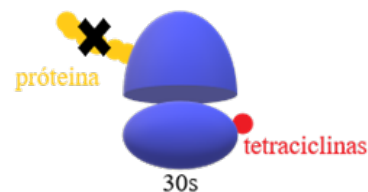
Ação contra bactérias gram-positivas (*Streptococo alfa-hemolítico*. Grupo *enterococo*, *Streptococcus pneumoniae* *Streptococcus pyogenes*) e gram-negativas (*Bacteroides spp.*, *Bartonella bacilliformis*, *Brucella spp.*, *Calymmatobacterium granulomatis*, *Campylobacter fetus*, *Enterobacter aerogenes*, *Escherichia coli* e outras) e outros microrganismos.

Mycoplasma e *Chlamydia*.

MECANISMO DE AÇÃO

As tetraciclinas inibem a produção de proteínas nas bactérias por meio da ligação do fármaco à subunidade 30S dos ribossomos, sendo essa a organela responsável pela

síntese proteica. Assim, se não há síntese de proteínas de forma eficaz a estrutura bacteriana fica instável, o que atribui a esses fármacos a classificação como antibióticos bacteriostáticos.



Fonte: Autoria própria, 2020.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → de forma variável ao longo do trato gastrointestinal, sendo mais bem absorvidas no estômago e intestino delgado;
2. Distribuição → possuem concentração no fígado;
3. Metabolismo → em parte, pela bile no intestino delgado, onde entram no ciclo enteroepático;
4. Excreção → pela urina por meio da filtração glomerular.



DOXICICLINA VIBRAMICINA®

Comprimido -- 100 mg
Pó para solução injetável -- 100 mg

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

I) Doença inflamatória pélvica e exacerbação bronquite crônica

Adultos:

DOSE → Dose inicial de 200 mg (dose fracionada de 100 mg em 12 horas em 12 horas), seguidas de uma dose de manutenção de 100 mg/dia.

Crianças > 8 anos:

DOSE →

- Crianças pesando 45 kg ou menos: 4,4 mg/kg de peso corpóreo, seguida por uma dose de manutenção de 2,2 mg/kg de peso corpóreo.
- Crianças pesando mais de 45 kg deve ser utilizada a dose usual recomendada para adultos.

Duração do tratamento: O tratamento deve continuar por pelo menos 24 a 48 horas após o desaparecimento dos sintomas e febre.

II) Malária resistente à cloroquina

DOSE → 200 mg ao dia.

Duração do tratamento: mínimo 7 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- Hepatotoxicidade;
- Atividade sobre tecidos ósseo e dentário;
- Reação de fotossensibilidade, rash incluindo erupções cutâneas maculopapulares e eritematosas;
- Cefaleia;
- Efeitos gastrointestinais, como náuseas, vômitos e diarreia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a doxiciclina ao mesmo tempo com:

- Cálcio do leite e derivados, pois diferentemente do que ocorre com outras tetraciclinas apresenta menor afinidade;
- Varfarina;
- Penicilina;
- Álcool, barbitúricos, carbamazepina e fenitoína, pois diminuem a meia-vida da doxiciclina.



DOXICICLINA
VIBRAMICINA®

Comprimido -- 100 mg

Pó para solução injetável -- 100 mg

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade à doxiciclina;
- Gravidez;
- Amamentação;
- Crianças com menos de 8 anos.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde – Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Doxiciclina de 2020. Acesso em 29 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*, Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



NITROFURANTOÍNA MACRODANTINA®

Cápsula – 100 mg

INDICAÇÕES

- Usado como antissépticos para tratar e prevenir infecções urinárias;
- Cistites;
- Pielite;
- Pielocistites;
- Pielonefrites.

CLASSE

Nitrofuranos.

CEPAS

Gram-positivos e negativos.

Ativo contra *Escherichia coli*, *Enterococcus faecalis* e *Staphylococcus aureus*.

MECANISMO DE AÇÃO

Não é bem estabelecido, mas sabe-se que ele age inibindo as inúmeras enzimas bacterianas.

Sua efetividade é em meio ao ambiente ácido, sendo inativado em pH maior que 8.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → de forma eficaz pelo trato gastrointestinal;
2. Ligação a proteínas plasmáticas → 50 a 70% do fármaco;
3. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 0,4 e 1,1 hora;
4. Metabolismo → pelo fígado;
5. Excreção → 40% é eliminado de forma inalterada, o que contribui para uma corúria amarelo fluorescente. Concentração urinária chega a 200 g/ml em doses diárias médias de 400 mg/dia, a concentração diminui em urina alcalina.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 100 mg, em 6 em 6 horas.

Duração do tratamento: 7 a 10 dias.

Caso seja necessário pode-se usar o medicamento por um prazo maior, assim uma redução da dose deverá ser considerada, tomar 1 cápsula de 100 mg antes de dormir.



NITROFURANTOÍNA MACRODANTINA®

Cápsula – 100 mg

REAÇÕES ADVERSAS

- Efeitos gástricos, como náuseas e vômitos;
- Efeitos neurológicos, como cefaleia, tonturas etc.;
- Neuropatia periférica;
- Alopecia transitória (queda de cabelos).

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a nitrofurantoína ao mesmo tempo com:

- Antiácidos contendo trissilicato de magnésio;
- Drogas uricosúricas, como por exemplo probenecida e a sulfimpirazona;
- Magnésio trissilicato;
- Ácido nalidíxico;
- Norfloxacin;
- Ácido oxolínico.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde – Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Nitrofurantoína de 2017. Acesso em 29 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Anúria;
- Oligúria
- Insuficiência renal com depuração de creatinina abaixo de 60 ml/minuto/1,73m²;
- Últimas semanas da gestação (38-42 semanas);
- Em crianças com menos de um mês de idade, devido à possibilidade de anemia hemolítica.

Anotações:



SULFATO DE AMICACINA AMICACINA AMICILON® / NOVAMIN

Solução injetável -- 250 mg/ml -- Caixa c/ 50 ampolas de 2 ml

INDICAÇÕES

- Bacteremia e septicemia;
- Infecções graves do trato respiratório, nos ossos e articulações, sistema nervoso central, pele e tecidos moles;
- Infecções intra-abdominais;
- Queimaduras;
- Infecções pós-operatórias.

CLASSE

Aminoglicosídeos.

CEPAS

Age contra cepas resistentes à gentamicina e tobramicina, como *Klebsiella*, *Enterobacter* e *Escherichia coli*.

Atua contra os bacilos gram-negativos aeróbicos:

Pseudomonas aeruginosa, *Proteus* e *Serratia*.

Atuante contra *Mycobacterium tuberculosis*.

MECANISMO DE AÇÃO

Os aminoglicosídeos são bactericidas, ou seja, destroem a célula bacteriana. O fármaco adentra na célula bacteriana através das porinas, por meio do processo de difusão da membrana celular externa.

Dentro da célula o fármaco formará uma ligação com os polissomos na subunidade 30S dos ribossomos. Essa ação acarretará erros de leitura e precoce tradução do RNA mensageiro causando falhas na síntese proteica. Isso ocasionará:

1. Acúmulo de monossomas;
2. Formação de proteínas anômalas;
3. Alteração da permeabilidade celular por meio da fixação das proteínas defeituosas na membrana celular;
4. Saída de íons e outras moléculas maiores que dificultará a sobrevivência da célula;
5. Por fim o rompimento do envelope celular com posterior morte da célula.

FARMACOCINÉTICA

1. Administração → intramuscular ou intravenosa;
2. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 2 horas;
3. Volume de distribuição → total médio de 24 litros, ou seja, aproximadamente 28% do peso corpóreo;



SULFATO DE AMICACINA AMICACINA AMICILON®/ NOVAMIN

Solução injetável -- 250 mg/ml -- Caixa c/ 50 ampolas de 2 ml

4. Ligação a proteínas plasmáticas → 0 a 11%;
5. Excreção → renal, filtração glomerular;
6. Distribuição → são encontrados níveis terapêuticos nos ossos, coração, bexiga, parênquima pulmonar, além de concentrações significativas na urina, bile, escarro, secreção brônquica e líquidos intersticial, pleural e sinovial. Sulfato de amicacina atravessa a barreira placentária, atingindo concentrações significativas no líquido amniótico.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via intramuscular ou intravenosa.

Adultos:

DOSE → 15 mg/kg/dia.

Pode ser dividida em 2 ou 3 tomadas em intervalos regulares de 12 em 12 horas ou 8 em 8 horas.

Prematuros:

DOSE → 7,5 mg/kg, a cada 12 horas.

Recém-nascidos:

DOSE → Ataque 10 mg/kg e seguido de 7,5 mg/kg, a cada 12 horas.

Crianças e lactentes (mais de 2 semanas):

DOSE → 7,5 mg/kg, a cada 12 horas ou 5 mg/kg a cada 8 horas.

Duração do tratamento: 7 a 10 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- Ototoxicidade;
- Perda auditiva;
- Bloqueio neuromuscular;
- Nefrotoxicidade.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a Amicacina ao mesmo tempo com:

Bebidas alcoólicas;

Drogas anestésicas;

Drogas diuréticas, como furosemida, ácido etacrínico, mercuriais e manitol;

Antibióticos neurotóxicos e nefrotóxicos, como canamicina, gentamicina, netilmicina, tobramicina, neomicina, estreptomina, polimixina B, vancomicina.



SULFATO DE AMICACINA
AMICACINA
AMICILON® / NOVAMIN

Solução injetável -- 250 mg/ml -- Caixa c/ 50 ampolas de 2 ml

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Pacientes com história de hipersensibilidade à amicacina ou a qualquer outro componente da formulação;
- Pacientes com história de reações tóxicas graves ou hipersensibilidade a outros aminoglicosídeos devido a conhecida sensibilidade cruzada dos pacientes a drogas desta classe.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Sulfato de Amicacina de 2019. Acesso em 01 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



SULFATO DE ESTREPTOMICINA ESTREPTOMICINAPó para solução injetável – 1g Caixa c/ 50 ampolas/frascos

INDICAÇÕES

- Brucelose, associado com doxiciclina;
- Tuberculose, nos casos de falência do esquema preferencial;
- Endocardite bacteriana, associado com penicilina G;
- Tularemia;
- Peste bubônica.

CLASSE

Aminoglicosídeos.

CEPAS

Atua contra bactérias gram-positivas e várias gram-negativas como:

Yersinia pestis, *Brucella* spp e *Franciella tularensis*.

Atuante contra *Mycobacterium tuberculosis*.

MECANISMO DE AÇÃO

Os aminoglicosídeos são bactericidas, ou seja, destroem a célula bacteriana. O fármaco adentra na célula bacteriana através das porinas, por meio do processo de difusão da membrana celular externa.

Dentro da célula o fármaco formará uma ligação com os polissomos na subunidade 30S dos ribossomos. Essa ação acarretará erros de leitura e precoce tradução do RNA mensageiro causando falhas na síntese proteica. Isso ocasionará:

1. Acúmulo de monossomas;
2. Formação de proteínas anômalas;
3. Alteração da permeabilidade celular por meio da fixação das proteínas defeituosas na membrana celular;
4. Saída de íons e outras moléculas maiores que dificultará a sobrevivência da célula;
5. Por fim o rompimento do envelope celular com posterior morte da célula.



SULFATO DE ESTREPTOMICINA ESTREPTOMICINAPó para solução injetável – 1g Caixa c/ 50 ampolas/frascos

FARMACOCINÉTICA

1. Distribuição → por todos os tecidos, com exceção do líquido cefalorraquidiano e atravessa a placenta;
2. Pico de concentração sanguínea → alcançado em cerca de uma hora;
3. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 2,5 horas;
4. Ligação a proteínas plasmáticas → Cerca de um terço da estreptomicina circulante está ligada à proteína plasmática;
5. Excreção → renal, 60% a 95% são eliminados sob a forma inalterada na urina em 24 horas. Pequenas quantidades são eliminadas no suor, saliva e leite materno.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via intramuscular ou intravenosa.

I) Brucelose e tuberculose

Adultos:

DOSE → 1000 mg/dia.

Crianças:

Até 20 kg de peso corporal

DOSE → 20 mg/kg/dia.

Maior que 20 kg até 35 kg de peso corporal

DOSE → 500 mg/dia.

Maior que 35 kg de peso corporal

DOSE → 1000 mg/dia.

Duração do tratamento: 3 meses.

II) Endocardite bacteriana

Adultos:

DOSE → 1000 mg/dia.

Tularemia

Adultos:

DOSE → 1000 a 2000 mg/dia em doses fracionadas.

Duração do tratamento: 10 a 14 dias.

III) Peste bubônica

Adultos:

DOSE → 2000 mg/dia, fracionadas em 12 em 12 horas.

Duração do tratamento: 10 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- Náuseas, vômitos;
- Febre, angioedema, urticária e erupções cutâneas;



SULFATO DE ESTREPTOMICINA

ESTREPTOMICINAPó para solução injetável – 1g Caixa c/ 50 ampolas/frascos

- Ototoxicidade;
- Disfunção do nervo óptico, com escotomas.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar Estreptomicina ao mesmo tempo com:

- Drogas anestésicas e relaxantes musculares;
- Drogas diuréticas, como furosemida e ácido etacrínico;
- Fármacos neurotóxicos e nefrotóxicos, como ciclosporina, canamicina, gentamicina, tobramicina, neomicina, polimixina B e colistina;
- Toxina botulínica, pois aumenta o efeito;
- Neostigmina e piridostigmina, pois diminui o efeito.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Sulfato de Estreptomicina de 2015. Acesso em 02 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- É contraindicada em caso de história de hipersensibilidade à estreptomicina, a qualquer outro componente da fórmula e a outros antibióticos aminoglicosídeos.

Anotações:



SULFATO DE GENTAMICINA GENTAMICINA

Pomada oftálmica – 5 mg/g - Bisnaga

Solução oftálmica – 5 mg/ml - Frasco plástico conta-gotas

INDICAÇÕES

- Infecções externas do globo ocular e seus anexos;
- Conjuntivite;
- Ceratite;
- Ceratoconjuntivite;
- Úlcera de córnea;
- Blefarite;
- Blefaroconjuntivite;
- Dacriocistite;
- Profilaxia cirúrgica.

CLASSE

Aminoglicosídeos.

CEPAS

Atua contra infecções graves causadas por bacilos gram-positivos e vários gram-negativos.

Dentre eles têm-se: *Diplococcus pneumoniae*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Proteus spp*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus aegyptius*, *Aerobacter aerogenes*, *Moraxella lacunata* e *Neisseria spp*, inclusive *Neisseria gonorrhoeae*.

MECANISMO DE AÇÃO

Os aminoglicosídeos são bactericidas, ou seja, destroem a célula bacteriana. O fármaco adentra na célula bacteriana através das porinas, por meio do processo de difusão da membrana celular externa.

Dentro da célula o fármaco formará uma ligação com os polissomos na subunidade 30S dos ribossomos. Essa ação acarretará erros de leitura e precoce tradução do RNA mensageiro causando falhas na síntese proteica. Isso ocasionará:

1. Acúmulo de monossomas;
2. Formação de proteínas anômalas;
3. Alteração da permeabilidade celular por meio da fixação das proteínas defeituosas na membrana celular;
4. Saída de íons e outras moléculas maiores que dificultará a sobrevivência da célula;
5. Por fim o rompimento do envelope celular com posterior morte da célula.



SULFATO DE GENTAMICINA GENTAMICINA

Pomada oftálmica – 5 mg/g - Bisnaga

Solução oftálmica – 5 mg/ml - Frasco plástico conta-gotas

FARMACOCINÉTICA

1. Administração → intramuscular, intravenosa, subconjuntival, subcapsular (cápsula de tenon), nebulização ou instilação intratraqueal direta;
2. Absorção → Por via oral a absorção é baixa. Absorção é rápida através da injeção intramuscular, cerca de 30 minutos;
3. Concentração máxima → 30 a 60 minutos;
4. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via tópica.

I) Pomada oftálmica

Adultos:

DOSE → Deve ser aplicado uma pequena quantidade dentro da pálpebra inferior a cada 8 horas ou a cada 6 horas, ou seja, de 3 ou 4 vezes ao dia.

Duração do tratamento: 7 dias.

II) Solução oftálmica

Adultos:

DOSE → 2 gotas aplicadas nos olhos, por 3 ou 4 vezes ao dia.

Duração do tratamento: 7 dias.

Obs.: Na profilaxia cirúrgica realizar aproximadamente 1 hora antes do início da cirurgia, ou na indução anestésica.

REAÇÕES ADVERSAS

- Irritação ocular transitória, hiperemia ocular, dor ocular;
- Infecções secundárias por microrganismos não sensíveis ao fármaco;
- Reações alérgicas.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar Gentamicina ao mesmo tempo com:

Corticosteróides tópicos, pois podem mascarar os sinais clínicos de bactérias, fungos, ou infecções virais, como também podem suprimir as reações de hipersensibilidade ao antibiótico ou outro ingrediente na fórmula.



SULFATO DE GENTAMICINA GENTAMICINA

Pomada oftálmica – 5 mg/g - Bisnaga

Solução oftálmica – 5 mg/ml - Frasco plástico conta-gotas

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- É contraindicado em pacientes com história de hipersensibilidade ao sulfato de gentamicina, ou a qualquer um dos demais componentes da sua fórmula.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Sulfato de Gentamicina de 2009. Acesso em 02 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*, Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



TOBRAMICINA

TOBI®

Solução para nebulização --- 300 mg
Embalagem com 56 ampolas de 5 mL de solução

INDICAÇÕES

- Pneumonia;
- Bacteremia, em osteomielite;
- Infecções do trato urinário;
- Meningite;
- Endocardite bacteriana;
- Sepses.

CLASSE

Aminoglicosídeos.

CEPAS

Staphylococci, inclusive *S. aureus* e *S. epidermidis* (coagulase positivos e coagulase negativos), incluindo cepas resistentes à penicilina. *Streptococci*, inclusive algumas espécies do grupo A beta-hemolítico, algumas espécies não hemolíticas e algumas cepas de *Streptococcus pneumoniae*. *Pseudomonas aeruginosa*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Enterobacter aerogenes*, *Proteus mirabilis*, *Morganella morganii*, maioria das cepas de *Proteus vulgaris*, *Haemophilus influenzae* e *H. aegyptius*, *Moraxella lacunata*, *Acinetobacter calcoaceticus* e algumas espécies de *Neisseria*.

MECANISMO DE AÇÃO

Os aminoglicosídeos são bactericidas, ou seja, destroem a célula bacteriana. O fármaco adentra na célula bacteriana através das porinas, por meio do processo de difusão da membrana celular externa.

Dentro da célula o fármaco formará uma ligação com os polissomos na subunidade 30S dos ribossomos. Essa ação acarretará erros de leitura e precoce tradução do RNA mensageiro causando falhas na síntese proteica. Isso ocasionará:

1. Acúmulo de monossomas;
2. Formação de proteínas anômalas;
3. Alteração da permeabilidade celular por meio da fixação das proteínas defeituosas na membrana celular;
4. Saída de íons e outras moléculas maiores que dificultará a sobrevivência da célula;
5. Por fim o rompimento do envelope celular com posterior morte da célula.



TOBRAMICINA

TOBI®

Solução para nebulização --- 300 mg
Embalagem com 56 ampolas de 5 mL de solução

FARMACOCINÉTICA

1. Distribuição → Não atravessa prontamente as membranas epiteliais;
2. Biodisponibilidade → pode variar devido a diferenças individuais no desempenho do nebulizador e da patologia das vias aéreas;
3. Concentração sérica → 1 hora após a inalação de uma dose única de 300 mg de tobramicina. Permanece concentrada primariamente nas vias aéreas;
4. Ligação a proteínas plasmáticas → desprezível;
5. Metabolismo → Não é metabolizada;
6. Excreção → inalterada na urina. Eliminada da circulação sistêmica primariamente por filtração glomerular do composto inalterado;
7. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 3 horas com 300 mg.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via inalatória.

Adultos e crianças (idade superior a 6 anos):

DOSE → 1 ampola 300 mg/5ml. Administrada 2 vezes ao dia, ou seja, 12 em 12 horas.

Duração do tratamento: 28 dias.

Importante: A tobramicina é utilizado em ciclos alternados de 28 dias com a droga, seguidos por 28 dias sem o uso da droga.

REAÇÕES ADVERSAS

- Nefrotoxicidade;
- Ototoxicidade;
- Broncoespasmo e dor orofaríngea;
- Hipersensibilidade, prurido, urticária e rash cutâneo;
- Afonia e disgeusia.



TOBRAMICINA TOBI®

Solução para nebulização --- 300 mg
Embalagem com 56 ampolas de 5 mL de solução

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar Tobramicina ao mesmo tempo com:

- Drogas diuréticas, pois podem aumentar a toxicidade, então não deve ser administrado com ácido etacrínico, furosemina, ureia ou manitol intravenoso;
- Drogas com potencial neurotóxico, nefrotóxico ou ototóxico.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- É contraindicado para pacientes com hipersensibilidade conhecida a qualquer aminoglicosídeo.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Tobramicina de 2015. Acesso em 02 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:



LINEZOLIDA
ZYVOX®

Comprimido -- 600 mg

Solução para infusão -- 2 mg/mL -- 10 bolsas de 300 mL

INDICAÇÕES

- Infecções causadas por cepas de *E. faecium* resistentes à vancomicina;
- Pneumonia hospitalar causadas por cepas de *S. aureus* resistentes à meticilina;
- Pneumonia adquirida na comunidade causada por cepas de *S. pneumoniae* sensíveis à penicilina;
- Infecções complicadas da pele e das estruturas cutâneas causadas por estreptococos e por cepas de *S. aureus*;
- Infecções não complicadas da pele e das estruturas cutâneas.

CLASSE

Oxazolidinonas.

CEPAS

Atua contra micro-organismos gram-positivos, dentre eles têm-se estafilococos, enterococos, cocos anaeróbicos gram-positivos e bastonetes gram-positivos, como *Corynebacterium spp.* e *Listeria monocytogenes*.

Possui atividade moderada in vitro contra *M. tuberculosis*.

MECANISMO DE AÇÃO

Seu mecanismo de ação baseia-se na inibição da síntese de proteínas plasmáticas.

A linezolida atua como um ligante ao local P da subunidade 50S do ribossomo bacteriano, isso permitirá que não ocorra a formação do complexo fMet-tRNA-ribossômico, complexo que iniciaria a síntese de proteínas da célula bacteriana.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → Após administração oral é bem absorvida, podendo ser administrada com ou sem alimento;
2. Biodisponibilidade → por via oral de 100%;
3. Concentrações séricas máximas → 13 µg/ml em 1 ou 2 horas após uma dose;
4. Tempo de ½ vida → entre 4 a 6 horas;
5. Ligação a proteínas plasmáticas → Aproximadamente 30% do fármaco;
6. Distribuição → extensa pelos tecidos;
7. Metabolismo → ocorre através da oxidação não enzimática aos derivados ácido aminoetoxicético e hidroxietil glicina;
8. Excreção → renal (80%) e fecal (10%).



LINEZOLIDA
ZYVOX®

Comprimido -- 600 mg

Solução para infusão -- 2 mg/mL -- 10 bolsas de 300 mL

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral e endovenosa.

I) Infecções enterocócicas resistentes à vancomicina, incluindo bacteremia concomitante

Adultos e crianças (≥ 12 anos):

DOSE \rightarrow 600 mg oral ou IV, 12 em 12 horas.

Crianças (< 12 anos):

DOSE \rightarrow 10 mg/kg oral ou IV, 8 em 8 horas.

Duração do tratamento: 14 a 28 dias.

II) Infecções não complicadas de pele e tecidos moles

Adultos e crianças (≥ 12 anos):

DOSE \rightarrow 600 mg oral ou IV, 12 em 12 horas.

Crianças:

< 5 anos: 10 mg/kg oral ou IV, 8 horas em 8 horas.

5 a 11 anos: 10 mg/kg oral ou IV, 12 em 12 horas.

Duração do tratamento: 10 a 14 dias.

III) Infecções complicadas de pele, tecidos moles e cutâneas; Pneumonia adquirida na comunidade, incluindo bacteremia concomitante; e Pneumonia hospitalar

Adultos e crianças (≥ 12 anos):

DOSE \rightarrow 600 mg oral ou IV, 12 em 12 horas.

Crianças (< 12 anos):

DOSE \rightarrow 10 mg/kg oral ou IV, 8 em 8 horas.

Duração do tratamento: 10 a 14 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- Complicações gastrintestinais;
- Cefaleia;
- Erupção cutânea;
- Distúrbios hematológicos, incluindo anemia, leucopenia e trombocitopenia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a linezolida ao mesmo tempo com:

- Agente adrenérgico;
- Agente serotoninérgico, como Inibidores Seletivos de Recaptação da Serotonina (ISRSs);



LINEZOLIDA
ZYVOX®

Comprimido -- 600 mg

Solução para infusão -- 2 mg/mL -- 10 bolsas de 300 mL

- Tiramina.

Obs.: Podem desencadear a síndrome da serotonina, com palpitações, cefaleia ou crise hipertensiva.

CONTRAINDICAÇÕES

Pacientes que apresentam hipersensibilidade à esse ativo ou a qualquer um dos componentes da fórmula.

Pacientes que estejam utilizando qualquer medicamento que seja um inibidor das monoaminooxidasas A ou B.

Pacientes com hipertensão não controlada, feocromocitoma, tireotoxicose.

Pacientes utilizando algum dos seguintes tipos de medicamentos: agentes simpatomiméticos de ação direta ou indireta, agentes vasoconstritores, agentes dopaminérgicos.

Pacientes com síndrome do carcinoide.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Linezolida de 2020. Acesso em 04 de maio de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



AZITROMICINA DI-HIDRATADA AZITROMICINA

Comprimido -- 500 mg
Pó para suspensão oral – 40 mg/mL

INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório inferior, como bronquite e pneumonia, e superior, incluindo sinusite, faringite ou amigdalite;
- Infecção da pele e tecidos moles;
- Otite média aguda;
- Infecções Sexualmente Transmissíveis não complicadas;
- Profilaxia de endocardite em procedimentos dentários orais, em caso de alergia a penicilina ou ampicilina: manipulação de gengivas, periapical dos dentes e perfuração das mucosas.

CLASSE

Macrolídeos.

CEPAS

Amplo espectro.

Bactérias aeróbicas e facultativas gram-positivas como: *S. aureus*, *Streptococcus agalactiae*, *S. pneumoniae* e *Streptococcus pyogenes*.

Bactérias aeróbicas e facultativas gram-negativas como: *Bordetella pertussis*, *Campylobacter jejuni*, *Haemophilus ducreyi*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus parainfluenzae*, *Legionella pneumophila*, *Mo-*

raxella catarrhalis, e *Neisseria gonorrhoeae*.

Bactérias anaeróbicas: *Clostridium perfringens*, *Peptostreptococcus spp.* e *Prevotella bivia*.

MECANISMO DE AÇÃO

Inibição da síntese de proteínas bacterianas através de sua ligação reversível com as subunidades ribossômicas 50S dos micro-organismos sensíveis (ação bacteriostática, porém, em altas concentrações, pode ser bactericida).

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → administração oral, amplamente distribuída pelo corpo;
2. Biodisponibilidade → 37%;
3. Concentração plasmática → 2 a 3 horas;
4. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 2 a 4 dias;
5. Excreção → principalmente biliar.



AZITROMICINA DI-HIDRATADA AZITROMICINA

Comprimido -- 500 mg
Pó para suspensão oral – 40 mg/mL

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos e idosos:

I) Infecções sexualmente transmissíveis causadas por *Chlamydia trachomatis*, *Haemophilus ducreyi* ou *Neisseria gonorrhoeae* suscetível

DOSE → 1000 mg, em dose oral única.

II) Outras indicações (Profilaxia cirúrgica)

DOSE → 500 mg/dia.

Duração do tratamento: Três dias.

Crianças (acima de 45 kg):

DOSE → 15-30 mg/kg, em dose máxima total.

Administração via oral por pó para suspensão.

DOSE → 1000 mg, em dose oral única.

REAÇÕES ADVERSAS

- Redução na contagem de neutrófilos e/ou plaquetas;
- Perda de audição, surdez e/ou tinido – maioria reversível;
- Náusea, vômito, diarreia, desconforto abdominal, flatulência, dispepsia, constipação, colite pseudomembranosa, pancreatite, anorexia;
- Disfunção hepática, hepatite e icterícia colestática;
- Reações alérgicas e anafilaxia (raramente fatal);
- Monilíase e vaginite;
- Reação agressiva, nervosismo, agitação, ansiedade, tontura, convulsões, cefaleia, hiperatividade, hipoestesia, parestesia, sonolência e desmaio;
- Hipotensão, palpitações e arritmias incluindo taquicardia ventricular;
- Artralgia, astenia, cansaço, mal-estar
- Nefrite intersticial e insuficiência renal aguda.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Não se deve administrar a Azitromicina ao mesmo tempo com:
- Antiácidos, pois o pico de concentração plasmática reduzido em cerca de 25%;



AZITROMICINA DI-HIDRATADA AZITROMICINA

Comprimido -- 500 mg
Pó para suspensão oral – 40 mg/mL

- Digoxina, pois a administração concomitante resulta em um aumento dos níveis séricos da digoxina;
- Ciclosporina, deve-se ter cuidado antes de considerar o uso concomitante. Se for necessário, os níveis de ciclosporina devem ser monitorados e a dose deve ser ajustada adequadamente;
- Nelfinavir: a coadministração no estado de equilíbrio resultou num aumento da concentração de azitromicina.

CONTRAINDICAÇÕES

Indivíduos com história de hipersensibilidade a qualquer macrolídeo, cetolídeo (outra classe de antibiótico), ou algum componente da fórmula.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Azitromicina de 2019 e de 2020. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*, Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



ESTOLATO DE ERITROMICINA ERITROMICINA

Comprimido -- 500 mg

Pó para Suspensão Oral -- 25mg/mL e 50mg/mL

INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório superior de leve a moderada gravidade;
- Infecções do trato respiratório inferior de leve a moderada gravidade,
- Sífilis primária causada por *Treponema pallidum*;
- Eritrasma: infecções por *Corynebacterium minutissimum*;
- Amebíase intestinal causada por *Entamoeba histolytica*. Amebíase extraentérica requer tratamento com outras drogas;
- Coqueluche causada por *Bordetella pertussis*;
- Infecções devidas a *Listeria monocytogenes*;
- Infecções da pele e tecidos moles de leve a moderada gravidade;
- Conjuntivite do recém-nascido.
- Pneumonia da infância;
- Infecções urogenitais de pacientes adultos, até mesmo na gravidez;
- Profilaxia a curto prazo contra endocardite bacteriana antes de intervenções cirúrgicas em pacientes com histórias de febre reumática ou cardiopatia;
- Doença dos legionários (*Legionella pneumophila*).

CLASSE

Macrolídeos.

CEPAS

Streptococcus pyogenes, estreptococos do grupo viridans, *Streptococcus pneumoniae*, ou *Haemophilus influenzae*, *S. pneumoniae*, *Mycoplasma pneumoniae* ou *Legionella pneumophila*, *Treponema pallidum*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Corynebacterium minutissimum*, *Entamoeba histolytica*, *Listeria monocytogenes*, *Staphylococcus aureus*, *Bordetella pertussis*, *Chlamydia trachomatis*.

MECANISMO DE AÇÃO

A eritromicina é um antibiótico da classe dos macrolídeos, de amplo espectro (semelhante ao da penicilina). Seu mecanismo de ação é a inibição da síntese de proteínas bacterianas através de sua ligação reversível com as subunidades ribossômicas 50S dos micro-organismos sensíveis (ação bacteriostática, porém, em altas concentrações, pode ser bactericida).



ESTOLATO DE ERITROMICINA ERITROMICINA

Comprimido -- 500 mg

Pó para Suspensão Oral -- 25mg/mL e 50mg/mL

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → trato gastrointestinal e alimentos podem reduzir a absorção;
2. Concentração sérica máxima → 1 a 4 horas;
3. Metabolização → hepática;
4. Excreção → biliar.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

a) Comprimidos:

DOSE → 500 mg, tomar um comprimido a cada 12 horas.

Duração do tratamento: sete a 10 dias.

b) Pó para suspensão

Adultos

DOSE → 250 mg a cada 6 horas, podendo aumentar a dose até para 4 g/dia.

Duração do tratamento: 10 dias.

Crianças:

DOSE → 30 a 50 mg/kg/dia, em doses divididas.

Duração do tratamento:

- Conjuntivite – 2 semanas.

- Pneumonia na infância causada por *C. trachomatis* - 3 semanas.

REAÇÕES ADVERSAS

- As mais frequentes são as gastrintestinais, como cólica abdominal e mal-estar e estão relacionadas com a dose;
- início de sintomas de colite pseudomembranosa pode ocorrer durante ou após o tratamento;
- Reações alérgicas leves, como: urticária e outras erupções cutâneas. Ou mesmo graves, incluindo anafilaxia;
- Perda da audição e/ou zumbido – ototoxicidade usualmente reversível com a interrupção;
- Alterações de exames laboratoriais: pode interferir com as determinações das transaminases (TGO).

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Não se deve administrar a Eritromicina ao mesmo tempo com:
- Probenecida: ela inibe a reabsorção tubular da eritromicina em animais, prolongando a manutenção dos níveis plasmáticos;
- Lincomicina ou Clindamicina: deve ser evitado, devido ao antagonismo entre essas duas classes;



ESTOLATO DE ERITROMICINA ERITROMICINA

Comprimido -- 500 mg

Pó para Suspensão Oral -- 25mg/mL e 50mg/mL

- Teofilina, digoxina, midazolam, anticoagulantes orais, ergotamina ou dihidroergotamina: o uso de eritromicina pode estar associado com um aumento dos níveis séricos e do potencial de toxicidade desses fármacos;
- Drogas metabolizadas pelo citocromo P450: elevações dos níveis séricos destas drogas;
- Cisaprida: reportados níveis elevados de cisaprida;
- Anti-histamínicos não sedativos, como terfenadina e astemizol: a eritromicina altera o metabolismo desses fármacos. Raros casos de prolongamento.

CONTRAINDICAÇÕES

Indivíduos com história de hipersensibilidade a qualquer macrolídeo, cetolídeo ou algum componente da fórmula.

Indivíduos fazendo uso de terfenadina ou astemizol.

Indivíduos hepatopatas, devido à alta hepatotoxicidade (hepatite colestática) com ou sem o aparecimento de icterícia, quando em uso por mais de 10 dias.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Estolato de Eritromicina de 2014. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



CLARITROMICINA

Comprimido – 250 e 500 mg
Grânulos para Suspensão Oral -- 50mg/mL
Cápsula -- 500 mg

INDICAÇÕES

- Infecções das vias aéreas superiores e inferiores e infecções de pele e tecidos moles causadas por todos os micro-organismos sensíveis;
- Profilaxia de endocardite em procedimentos dentários orais, em caso de alergia a penicilina ou ampicilina: manipulação de gengivas, periapical dos dentes e perfuração das mucosas.

CLASSE

Macrolídeos.

CEPAS

Micro-organismos Gram-positivos aeróbios: *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Listeria monocytogenes*.

Micro-organismos Gram-negativos aeróbios: *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus parainfluenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Legionella pneumophila*.

Outros micro-organismos: *Mycoplasma pneumoniae*, *Chlamydia pneumoniae*.

Micobactérias: *Mycobacterium leprae*, *Mycobacterium kansasii*, *Mycobacterium chelonae*, *Mycobacterium fortuitum*, *Mycobacterium avium complex (MAC)* consistindo

de: Mycobacterium avium e Mycobacterium intracellulare.

Helicobacter: Helicobacter pylori.

MECANISMO DE AÇÃO

A claritromicina é um antibiótico da classe dos macrolídeos. Seu mecanismo de ação é a inibição da síntese de proteínas bacterianas através de sua ligação reversível com as subunidades ribossômicas 50S dos microorganismos sensíveis (ação bacteriostática, porém, em altas concentrações, pode ser bactericida).

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → trato gastrointestinal, a ingesta antes da administração pode retardar a absorção;
2. Biodisponibilidade → 55%;
3. Ligação a proteínas plasmáticas → 65 a 75%;
4. Concentração máxima → 2 a 3 horas;
5. Biotransformação → hepática, com três vias: desmetilação, hidroxilação e hidrólise;
6. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 3 a 4 horas (250 mg) e 5 a 7 horas (500 mg);
7. Excreção → Renal.



CLARITROMICINA

Comprimido – 250 e 500 mg

Grânulos para Suspensão Oral -- 50mg/mL

Cápsula -- 500 mg

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

a) Comprimidos:

DOSE → 500 mg/dia

Duração do tratamento: 5 a 14 dias.

b) Grânulos para suspensão

Crianças:

DOSE → 7,5-15 mg/kg, duas vezes ao dia.

Duração do tratamento: 5 a 10 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- **Gastrointestinais:** náuseas, vômito, dor abdominal, diarreia, dispepsia. Intensidade geralmente leve. Outras reações são gastrite, estomatite, glossite, constipação, boca seca, eructação e flatulência.
- **Sistema nervoso:** disgeusia, cefaleia, tontura, tremor, sonolência, convulsão, ageusia, parosmia, anosmia e parestesia.
- **Hepatobiliar:** teste de função hepática anormal, alanina aminotransferase, aspartato aminotransferase aumentadas, disfunção hepática e icterícia hepatocelular.

- **Pele e tecidos subcutâneos:** rash, hiperidrose, prurido, urticária, reação adversa cutânea severa (SCAR) (por exemplo, pustulose generalizada exantemática aguda - PEGA, Síndrome de Stevens-Johnson, necrólise epidérmica tóxica, rash com eosinofilia e sintomas sistêmicos, acne).
- **Infecções e infestações:** candidíase, infecção, infecção vaginal, colite pseudomembranosa e erisipela
- **Sanguíneo e linfático:** leucopenia, agranulocitose e trombocitopenia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Não se deve administrar a Claritromicina ao mesmo tempo com:
- Fármacos indutores da CYP3A4 como rifampicina, fenitoína, carbamazepina e fenobarbital: podem induzir o metabolismo da claritromicina, resultando em níveis subterapêuticos da mesma e eficácia reduzida;
- Fármacos fortes indutores do metabolismo do citocromo P450: Efavirenz, nevirapina, rifampicina, rifabutina e rifapentina: aceleram o metabolismo da claritromicina e diminuir seus níveis plasmáticos.



CLARITROMICINA
Comprimido – 250 e 500 mg
Grânulos para Suspensão Oral -- 50mg/mL
Cápsula -- 500 mg

CONTRAINDICAÇÕES

Indivíduos com história de hipersensibilidade a qualquer macrolídeo, cetolídeo.

Indivíduos fazendo uso de astemizol, cispripida, pimozida e terfenadina.

Indivíduos fazendo uso de alcaloides de ergot.

Indivíduos com histórico de prolongamento do intervalo QT.

Indivíduos com hipocalcemia: risco de prolongamento do intervalo QT.

Indivíduos com insuficiência hepática grave em combinação com insuficiência renal.

Indivíduos fazendo uso de colchicina.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Claritromicina de 2019. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*, Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



ESPIRAMICINA ROVAMICINA

Comprimido – 1,5 M.U.I

INDICAÇÕES

- Manifestações otorrinolaringológicas, broncopulmonares, cutâneas, genitais, ósseas e estomatológicas;
- Profilaxia de meningite meningocócica
- Quimioprofilaxia de recaída de Reumatismo Articular Agudo em pacientes alérgicos à penicilina.
- Toxoplasmose, em mulheres grávidas.

CLASSE

Macrolídeos.

CEPAS

Micro-organismos sensíveis: *estreptococos*, *estafilococos metilina-sensíveis*, *Rhodococcus equi*, *Branhamella catarrhalis*, *Bordetella pertussis*, *Helicobacter pylori*, *Campylobacter jejuni*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Moraxella*, *Mycoplasma pneumoniae*, *Coxiella burnetti*, *Chlamydiae*, *Treponema pallidum*, *Borrelia burgdorferi*, *leptospiras*, *Propionibacterium acnes*, *Actinomyces*, *Eubacterium*, *Porphyromonas*, *Mobiluncus*, *Mycoplasma hominis* e *Toxoplasma gondii*;

Micro-organismos moderadamente sensíveis: *Neisseria gonorrhoeae*, *Vibrio*, *Ure-*

aplasma urealyticum, *Legionella pneumophila*.

Micro-organismos infrequentemente sensíveis: *Streptococcus pneumoniae*, *Enterococcus*, *Campylobacter coli*, *Peptostreptococcus*, *Clostridium perfringens*.

MECANISMO DE AÇÃO

A espiamicina é um antibiótico da classe dos macrolídeos. Seu mecanismo de ação é a inibição da síntese de proteínas bacterianas através de sua ligação reversível com as subunidades ribossômicas 50S dos microorganismos sensíveis (ação bacteriostática, porém, em altas concentrações, pode ser bactericida).

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida, mas incompleta, não sendo alterada pela ingestão de alimentos;
2. Concentração máxima → 3 horas;
3. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → 8 horas;
4. Ligação a proteínas plasmáticas → fraca, 10%;
5. Biotransformação → hepática, com formação de metabólitos ativos;
6. Excreção → lenta, biliar.



ESPIRAMICINA ROVAMICINA

Comprimido – 1,5 M.U.I

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

DOSE → 4 a 6 comprimidos por dia, divididos em 2 ou 3 administrações

I) Profilaxia de meningite meningocócica

DOSE → 2 comprimidos a cada 12 horas.

REAÇÕES ADVERSAS

- Efeitos Gastrointestinais: náusea, vômito, diarreia e casos muito raros de colite pseudo-membranosa;
- Reações de hipersensibilidade: rash, urticária e prurido; muito raramente angioedema, choque anafilático; casos isolados de vasculite, incluindo púrpura de Henoch-Schonlein;
- Sistema nervoso central e periférico: casos ocasionais de parestesia transitória;
- Sistema hepático: casos muito raros de alterações nos testes de função hepática; disgeusia transitória;
- Efeitos hematológicos: casos muito raros de hemólise aguda;
- Distúrbios de pele e tecidos subcutâneo: rash, urticária, prurido, Síndrome de Stevens-Johnson (SSJ), Necrólise Epidérmica Tóxica (NET) e Pustulose Exan-

temática Generalizada Aguda (PEGA);

- Distúrbios cardíacos: arritmia ventricular, taquicardia ventricular, torsade de pointes, que podem resultar em parada cardíaca, prolongamento do intervalo QT (em investigação).

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a Espiramicina ao mesmo tempo com:

- Levodopa: inibição da absorção da carbidopa com diminuição dos níveis plasmáticos de levodopa. Os pacientes devem ser cuidadosamente monitorizados, devendo-se realizar ajuste posológico da levodopa quando necessário.



ESPIRAMICINA
ROVAMICINA

Comprimido – 1,5 M.U.I

CONTRAINDICAÇÕES

Indivíduos com história de hipersensibilidade a qualquer macrolídeo, cetolídeo (outra classe de antibiótico), ou algum componente da fórmula.

Micro-organismos resistentes: estafilococos meticilina-resistentes, enterobactérias, Pseudomonas, Acinetobacter, Nocardia, Fusobacterium, Bacteroides fragilis, Haemophilus influenza e H. parainfluenza.

Há casos muito raros de hemólise aguda em pacientes com deficiência de glicose 6-fosfato desidrogenase. Uso não recomendado.

Avaliar os riscos e benefícios para o paciente pediátrico.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Rovamicina de 2019. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



AMOXICILINA AMOXICILINA TRI-HIDRATADA

Comprimido – 875 mg

Cápsula -- 500 mg

Pó para suspensão oral – 50 mg/mL

INDICAÇÕES

- Faringo-amigdalite por *Streptococcus* Beta-hemolítico;
- Otite média aguda;
- Rinossinusite bacteriana;
- Pneumonia adquirida na sociedade;
- Gonorreia;
- Profilaxia de endocardite em procedimentos dentários orais: manipulação de gengivas, periapical dos dentes e perfuração das mucosas.

CLASSE

Penicilinas

CEPAS

Gram-positivos aeróbios: *Enterococcus faecalis*, *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus viridans*, *Staphylococcus aureus* sensível a penicilina, espécies de *Corynebacterium*, *Bacillus anthracis*, *Listeria monocytogenes*;

Gram-positivos anaeróbios: espécies de *Clostridium*;

Outras: *Treponema pallidum*, *Leptospira icterohaemorrhagiae*.

Gram-negativos aeróbios: *Haemophilus influenzae*, *Escherichia coli*, *Proteus mirabilis*, espécies de *Salmonella*, espécies de *Shigella*, *Bordetella pertussis*, espécies de *Brucella*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Pasteurella septica*, *Vibrio cholerae*, *Helicobacter pylori*;

MECANISMO DE AÇÃO

A amoxicilina é um antibiótico beta-lactâmico da classe aminopenicilina: penicilinas semi-sintéticas, com a adição de um grupo amino na cadeia lateral, e de espectro de ação mais amplo, em relação às benzilpenicilinas. Atua inibindo a biossíntese do mucopeptídeo da parede celular.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → bem absorvida;
2. Ligação as proteínas plasmáticas → baixa, 18%;
3. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → 1 hora;
4. Excreção → renal.



AMOXICILINA AMOXICILINA TRI-HIDRATADA

Comprimido – 875 mg

Cápsula -- 500 mg

Pó para suspensão oral – 50 mg/mL

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

a) Cápsulas

Adultos e crianças (acima de 40 kg):

DOSE → 250 mg, três vezes ao dia. Em caso de infecções graves, aumentar para 500 mg três vezes ao dia.

b) Pó para suspensão:

Adultos e crianças (acima de 40 kg):

DOSE → 250 mg

Crianças (< 40 kg):

DOSE → 20 a 50 mg/kg/dia em doses divididas (três vezes ao dia)

c) Comprimidos

Adultos e idosos:

DOSE → 875 mg, a cada 12 horas.

I) Profilaxia de endocardite

Adultos

DOSE → 2 g por via oral.

Crianças

DOSE → 50 mg/kg por via oral.

REAÇÕES ADVERSAS

- Comuns: diarreia, náusea e rash cutâneo;
- Incomuns: vômito, urticária e prurido;
- Leucopenia reversível;
- Reações alérgicas graves, como edema angioneurótico, anafilaxia;
- Hipercinesia, vertigem e convulsões e meningite asséptica;
- Candidíase mucocutânea;
- Colite associada a antibióticos;
- Nefrite intersticial e cristalúria.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a Amoxicilina ao mesmo tempo com:

- Probenecida: reduz a secreção tubular renal da amoxicilina;
- Estrógenos: pode afetar a flora intestinal, levando a uma menor reabsorção deles, e reduzir a eficácia de contraceptivos orais combinados;
- Alopurinol: pode aumentar a probabilidade de reações alérgicas de pele;
- Testes para verificação da presença de glicose na urina: recomenda-se métodos de glicose oxidase enzimática. Devido às altas concentrações urinárias da amoxicilina, leituras falso-positivas são comuns com métodos químicos;



AMOXICILINA AMOXICILINA TRI-HIDRATADA

Comprimido – 875 mg

Cápsula -- 500 mg

Pó para suspensão oral – 50 mg/mL

- Anticoagulantes orais como cenocumarol e varfarina: Se a coadministração for necessária, o tempo de protrombina ou a razão normalizada internacional (RNI) devem ser monitorados com a introdução ou retirada do tratamento.

CONTRAINDICAÇÕES

A amoxicilina é suscetível à degradação por betalactamases, portanto o espectro de atividade de amoxicilina não abrange os microrganismos que produzem essas enzimas, ou seja, não inclui o *Staphylococcus* resistente e todas as cepas de *Pseudomonas*, *Klebsiella* e *Enterobacter*.

Outras: *Chlamydia* spp., *Mycoplasma* spp., *Legionella* spp.

Indivíduos com história de hipersensibilidade a este ou qualquer beta-lactâmico (ex: penicilina e cefalosporina), ou algum componente da fórmula.

Comprimidos não são indicados para crianças.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Amoxicilina de 2020. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*, Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



AMOXICILINA + CLAVULANATO DE POTÁSSIO

Comprimido – 500 mg + 125 mg
Pó para suspensão oral – 50 mg/mL + 12,5 mg/mL

INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório superior: como amigdalite, sinusite e otite média;
- Infecções do trato respiratório inferior: como bronquite aguda e crônica, pneumonia lobar e broncopneumonia;
- Infecções do trato geniturinário: como cistite, uretrite e pielonefrites;
- Infecções de pele e tecidos moles: como furúnculos, abscessos, celulite e ferimentos infectados;
- Infecções de ossos e articulações: como osteomielite;
- Outras infecções: como aborto séptico, sepse puerperal e sepse intra-abdominal.

CLASSE

Penicilinas com anti betalactamases.

MECANISMO DE AÇÃO

A amoxicilina é um antibiótico beta-lactâmico da classe aminopenicilina: penicilinas semi-sintéticas, com a adição de um grupo amino na cadeia lateral, e de espectro de ação mais amplo, em relação às benzilpenicilinas.

O ácido clavulânico é uma substância produzida pela fermentação do *Streptomyces*

clavuligerus, que possui a propriedade especial de inativar de modo irreversível as enzimas betalactamases, permitindo, dessa forma, que os microrganismos se tornem sensíveis à rápida ação bactericida da amoxicilina. Atua por inibição da biossíntese da parede celular.

CEPAS

Gram-positivos aeróbios, como *Staphylococcus saprophyticus*, *Staphylococcus coagulase-negativo*, *Enterococcus faecalis*, *Streptococcus pyogenes*;

Gram-positivos anaeróbios, como espécies de *Clostridium*, *Peptococcus niger*, *Peptostreptococcus magnus*, *Peptostreptococcus micros*, *Peptostreptococcus spp*;

Gram-negativos aeróbios, como *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus parainfluenzae*, *Escherichia coli*, *Proteus mirabilis*, espécies de *Salmonella*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Proteus spp.*, *Salmonella spp*;

Outras: *Borrelia burgdorferi*, *Treponema pallidum*, *Leptospira icterohaemorrhagiae*;



AMOXICILINA + CLAVULANATO DE POTÁSSIO

Comprimido – 500 mg + 125 mg
Pó para suspensão oral – 50 mg/mL + 12,5 mg/mL

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rapidamente e bem absorvidos;
2. Ligação as proteínas plasmáticas → amoxicilina 18% e ácido clavulânico 25%;
3. Excreção → Renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos e idosos:

DOSE → 1 comprimido três vezes ao dia.

Crianças (acima de 12 anos):

DOSE → 25 mg/kg, divididos em 8/8 horas. Caso de maior gravidade aumentar para 50 mg/kg/dia, divididos em 8/8hs

REAÇÕES ADVERSAS

Muito comuns: Diarreia (em adultos);
Candidíase muco cutânea;
Náusea e vômitos (em adultos);
Diarreia, náusea e vômitos (em crianças);
Vaginite;
Tontura;
Dor de cabeça, indigestão;

Aumento moderado de AST e/ou ALT;
Rash, prurido e urticária.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Probenecida: retarda a excreção renal da amoxicilina;
- Alopurinol: aumenta consideravelmente a incidência de rash;
- Estrógenos: pode afetar a flora intestinal, levando a uma menor reabsorção deles, e reduzir a eficácia de contraceptivos orais combinados;
- Anticoagulantes orais como cenocumamol e varfarina;
- Se a coadministração for necessária, o tempo de protrombina ou a razão normalizada internacional (RNI) devem ser monitorados com a introdução ou retirada do tratamento;
- Micofenolato de mofetila: redução na concentração do metabólito ativo ácido micofenólico de cerca de 50%.

CONTRAINDICAÇÕES

Bactérias resistentes.
Gram-negativas aeróbias.
Outras: Chlamydia spp., Coxiella burnetti, Mycoplasma spp.
Indivíduos com história de hipersensibilidade à penicilinas e/ou disfunção hepática/



AMOXICILINA + CLAVULANATO DE POTÁSSIO

Comprimido – 500 mg + 125 mg
Pó para suspensão oral – 50 mg/mL + 12,5 mg/mL

icterícia associadas a este medicamento ou a outras penicilinas.

Deve-se dar atenção à possível sensibilidade cruzada com outros antibióticos betalactâmicos.

Não deve ser administrado junto com dissulfiram.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Amoxicilina + Clavulanato de Potássio de 2019. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



BENZILPENICILINA BENZATINA BENZETACIL

Pó para suspensão injetável – 1.200.000 U

INDICAÇÕES

- Indicado para o tratamento de infecções por microrganismos sensíveis à penicilina G, que sejam suscetíveis aos níveis séricos baixos, porém muito prolongados, característicos desta forma de dosificação.
- Infecções do trato respiratório superior e da pele.
- Infecções venéreas: sífilis, boubá, bejel (sífilis endêmica) e pinta.
- Profilaxia da glomerulonefrite aguda e doença reumática; recorrências da febre reumática e/ou coreia de Sydenham.

CLASSE

Penicilina

CEPAS

Infecções estreptocócicas (grupo A, sem bacteremia), *estafilocócicas* (exceto as cepas produtoras de penicilase) e *pneumocócicas*.

Outros microrganismos sensíveis: *Neisseria gonorrhoeae*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*, *Clostridium sp*, *Actinomyces bovis*, *Streptobacillus moniliformis*, *Listeria monocytogenes* e *Leptospira*.

MECANISMO DE AÇÃO

A Penicilina G Benzatina é um antibiótico beta-lactâmico da classe penicilina, que resulta da combinação de duas moléculas da penicilina com uma da NN' dibenziletlenodiamina (benzatina). Atua por inibição da biossíntese do mucopeptídeo da parede celular.

FARMACOCINÉTICA

1. Administração → lenta;
2. Distribuição → ampla;
3. Ligação as proteínas plasmáticas → 50%;
4. Excreção → Renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via intramuscular.

Recomenda-se injeção intramuscular profunda no quadrante superior lateral da nádega. Em lactentes e crianças pequenas, pode ser preferível a face lateral da coxa. Para doses repetidas, recomenda-se variar o local da injeção.

I) Infecções estreptocócicas (grupo A) do trato respiratório superior e da pele

DOSE:

Injeção única de 300.000 a 600.000 unida-



BENZILPENICILINA BENZATINA BENZETACIL

Pó para suspensão injetável – 1.200.000 U

des de para crianças até 27 kg.

Injeção única de 900.000 unidades para crianças maiores.

Injeção única de 1.200.000 unidades para adultos.

II) Sífilis primária, secundária, latente e terciária (exceto neurosífilis)

DOSE:

Sífilis primária, secundária e latente precoce: injeção única de 2.400.000 unidades.

Sífilis latente tardia (incluindo as de “tempo não definido”) e terciária, exceto neurosífilis: 3 injeções de 2.400.000 unidades, com intervalo de 1 semana, entre as doses.

Sífilis congênita (pacientes assintomáticos): 50.000 U/kg em dose única para crianças menores de 2 anos de idade e dose única ajustada de acordo com a tabela de adultos, para crianças entre 2 e 12 anos.

III) Boubá, bejel (sífilis endêmica) e pinta

DOSE → injeção única de 1.200.000 unidades.

Profilaxia da febre reumática e da glomerulonefrite

DOSE → utilização periódica a cada 4 semanas, na dose de 1.200.000 unidades.

REAÇÕES ADVERSAS

- Sistema nervoso central: cefaleia;
- Sistema gastrointestinal: monilíase oral, náusea, vômito, diarreia;
- Trato genital: monilíase vaginal e/ou vulvar.
- Pele: erupções cutâneas, rash, prurido, urticária;
- Sistema urinário/eletrolítico: edema por retenção de fluidos;
- Reações de hipersensibilidade: reações anafiláticas, reação semelhante à doença do soro, edema de laringe;

Sistema cardiovascular: hipotensão.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Anticoncepcionais orais: pode haver redução da eficácia contraceptiva;
- Metotrexato: diminuição da excreção do metotrexato, acarretando risco de intoxicação por este fármaco;
- Micofenolato de mofetila: redução dos níveis séricos deste fármaco;
- Tetraciclina: podem reduzir o efeito terapêutico das penicilinas.



BENZILPENICILINA BENZATINA BENZETACIL

Pó para suspensão injetável – 1.200.000 U

CONTRAINDICAÇÕES

Bactérias resistentes: Produtoras de penicilase.

Indivíduos com história de hipersensibilidade a penicilinas.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Benzilpenicilina Benzatina de 2014. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



BENZILPENICILINA POTÁSSICA ARICILINA

Pó para suspensão injetável – 5.000.000 UI

INDICAÇÕES

- Indicado para o tratamento de infecções por microrganismos sensíveis à penicilina G, que sejam suscetíveis aos níveis séricos baixos, porém muito prolongados, característicos desta forma de dosificação.
- Infecções do trato respiratório superior e da pele.
- Infecções venéreas: sífilis, boubá, bejel (sífilis endêmica) e pinta.
- Profilaxia da glomerulonefrite aguda e doença reumática; recorrências da febre reumática e/ou coreia de Sydenham.

CLASSE

Penicilina.

CEPAS

Infecções estreptocócicas (grupo A, sem bacteremia), *estafilocócicas* (exceto as cepas produtoras de penicilase) e *pneumocócicas*.

Outros microrganismos sensíveis: *Neisseria gonorrhoeae*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*, *Clostridium sp*, *Actinomyces bovis*, *Streptobacillus moniliformis*, *Listeria monocytogenes* e *Leptospira*.

MECANISMO DE AÇÃO

A Penicilina G potássica é uma penicilina natural, do grupo dos beta-lactâmicos que exerce ação bactericida durante o estágio de multiplicação ativa dos microrganismos sensíveis. Atua por inibição da biossíntese do mucopeptídeo da parede celular. Ação bactericida.

FARMACOCINÉTICA

1. Ligação as proteínas plasmáticas → 60%;
2. Distribuição → ampla;
3. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via intravenosa.

Diluir com soro fisiológico a 0,9% ou soro glicosado a 5%, observando-se uma concentração final de 50.000 UI/mL.

Infundir em 30 a 60 minutos e a velocidade de infusão deve ser de 0,25 mEq/kg/hora.

Adultos:

DOSE → 1.000.000 a 5.000.000 UI diárias, divididas em 4 intervalos de 2 a 6 hora.



BENZILPENICILINA POTÁSSICA ARICILINA

Pó para suspensão injetável – 5.000.000 UI

Crianças:

DOSE → 100.000 a 250.000 UI/kg/dia, dividida em intervalos a cada 6 horas.

REAÇÕES ADVERSAS

- As mais comuns têm sido as de hipersensibilidade e independem da dose: urticária, prurido, edema angioneurótico, laringoespasma, broncoespasmo, hipotensão, colapso vascular, erupções cutâneas desde a forma maculopapulosa até a dermatite esfoliativa, eritema multiforme, reações semelhantes à doença do soro (febre, calafrios, edema, artralgia e mialgia), edema de laringe; miocardite.
- As reações locais mais comuns são: irritação inflamatória, dor no local da aplicação, equimose, trombose e hematoma.
- (SSJ), Necrólise Epidérmica Tóxica (NET) e Pustulose Exantemática Generalizada Aguda (PEGA);
- Distúrbios cardíacos: arritmia ventricular, taquicardia ventricular, torsade de pointes, que podem resultar em parada cardíaca, prolongamento do intervalo QT (em investigação).

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Drogas nefrotóxicas: como os aminoglicosídeos no geral;
- Pobrecina: inibe a secreção renal da penicilina, portanto, aumenta a concentração sérica desta e prolonga a sua duração de ação;
- Tetraciclina e Cloranfenicol: podem reduzir o efeito terapêutico das penicilinas;
- Bloqueadores beta-adrenérgicos: pode aumentar o risco e a gravidade de reações anafiláticas;
- Heparina e anticoagulantes orais: A utilização de altas doses de penicilina, por via intravenosa, pode aumentar o risco de sangramento.

CONTRAINDICAÇÕES

Bactérias resistentes: Produtoras de penicilase.

Indivíduos com história de hipersensibilidade a penicilinas.



BENZILPENICILINA POTÁSSICA ARICILINA

Pó para suspensão injetável – 5.000.000 UI

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Benzilpenicilina potássica de 2016. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



BENZILPENICILINA PROCAÍNA ENZILPENICILINA POTÁSSICA PENKARON

Pó para Suspensão Injetável: Benzilpenicilina procaína -- 400.000 UI
Benzilpenicilina potássica -- 100.000 UI

INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório superior e da pele;
- Sífilis.

CLASSE

Penicilinas.

CEPAS

Infecções *estreptocócicas* (grupo A, sem bacteremia), *estafilocócicas* (exceto as cepas produtoras de penicilase) e *pneumocócicas*;

Outros microrganismos sensíveis: *Neisseria gonorrhoeae*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*, *Clostridium sp*, *Actinomyces bovis*, *Streptobacillus moniliformis*, *Listeria monocytogenes* e *Leptospira* *Peptostreptococcus*, *Clostridium perfringens*.

MECANISMO DE AÇÃO

A penicilina G é um antibiótico beta-lactâmico.

A benzilpenicilina potássica é rapidamente absorvida após a injeção intramuscular: níveis séricos elevados durante as primeiras horas.

A benzilpenicilina procaína é um composto de procaína e benzilpenicilina; após a administração intramuscular, a benzilpenicilina é liberada lentamente do local de injeção: níveis séricos estáveis por 4 horas, que decrescem lentamente por um período de 15 a 20 horas. Atua por inibição da biossíntese do mucopeptídeo da parede celular. Ação bactericida.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rapidamente absorvida com elevados níveis séricos nas primeiras horas;
2. Concentração plasmática → é liberada lentamente do local de injeção, produzindo níveis séricos estáveis por 4 horas;
3. Distribuição → distribui-se amplamente pelos vários tecidos;
4. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via intramuscular.

Recomenda-se a injeção no quadrante superior lateral da nádega; em lactentes e crianças pequenas pode ser preferível a face lateral da coxa.

I) Pneumonia (pneumocócica) não complicada

DOSE → 600.000 a 1.200.000 UI/dia.



BENZILPENICILINA PROCAÍNA ENZILPENICILINA POTÁSSICA PENKARON

Pó para Suspensão Injetável: Benzilpenicilina procaína -- 400.000 UI
Benzilpenicilina potássica -- 100.000 UI

II) Infecções estreptocócicas moderadamente sérias a graves (amigdalite, erisipela, escarlatina, infecções da pele e tecidos moles e do trato respiratório superior)

DOSE → 600.000 a 1.200.000 UI/dia, durante 10 dias no mínimo.

III) Infecções estafilocócicas moderadamente sérias a graves (da pele e tecidos moles)

DOSE → 600.000 a 1.200.000 UI/dia.

IV) Pneumonias, infecções estreptocócicas (grupo A) e estafilocócicas de crianças com menos de 27 kg

DOSE → 300.000 UI/dia.

V) Difteria (como adjunto à antitoxina)

DOSE → 300.000 a 600.000 UI/dia.

VI) Difteria (erradicação em portadores)

DOSE → 300.000 UI diariamente por 10 dias.

VII) Antraz cutâneo

DOSE → 600.000 a 1.200.000 UI/dia.

VIII) Fusoespiroquetoses (infecções de Vincent)

DOSE → 600.000 a 1.200.000 UI/dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Hipersensibilidade e independem da dose;
- As reações locais mais comuns são: irritação inflamatória, dor no local da aplicação, equimose, trombose e hematoma;
- Alterações do sistema linfático e hematopoiético. Reversíveis após a interrupção do tratamento.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Pobrecina: inibe a secreção renal da penicilina, portanto, aumenta a concentração sérica desta e prolonga a sua duração de ação;
- Tetraciclina e Cloranfenicol: podem reduzir o efeito terapêutico das penicilinas;
- Bloqueadores beta-adrenérgicos: pode aumentar o risco e a gravidade de reações anafiláticas;
- Testes de laboratório: As penicilinas podem interferir com a medida da glicosúria realizada pelo método do sulfato de cobre, ocasionando falsos resultados de acréscimo, ou diminuição.



BENZILPENICILINA PROCAÍNA ENZILPENICILINA POTÁSSICA PENKARON

Pó para Suspensão Injetável: Benzilpenicilina procaína -- 400.000 UI
Benzilpenicilina potássica -- 100.000 UI

CONTRAINDICAÇÕES

Bactérias resistentes: Produtoras de penicilase.

Indivíduos com história de hipersensibilidade a penicilinas e cefalosporinas.

Durante os estágios agudos de pneumonia severa, empiema, bacteremia, pericardite, meningite, peritonite e artrite de etiologia pneumocócica, utilizar preferencialmente a benzilpenicilina potássica.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Benzilpenicilina procaína + Benzilpenicilina potássica de 2017. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



FENOXIMETILPENICILINA POTÁSSICA PEN-VE-ORAL

Pó para Suspensão Oral -- 800.000 UI/mL

INDICAÇÕES

- Infecções estreptocócicas leves a moderadas do trato respiratório superior, escarlatina e erisipela, (grupos A, C, G, H, L e M);
- Infecções pneumocócicas: infecções leves a moderadas do trato respiratório;
- Infecções estafilocócicas: infecções leves localizadas na pele e tecidos moles;
- Sífilis;
- Profilaxia da endocardite bacteriana em pacientes, com lesões cardíacas.

CLASSE

Penicilinas.

CEPAS

Além dos que já foram citados na indicação, há sensibilidades *Neisseria gonorrhoeae*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*, *Clostridium sp*, *Actinomyces bovis*, *Streptobacillus moniliformis*, *Listeria monocytogenes* e *Leptospira*.

MECANISMO DE AÇÃO

A fenoximetilpenicilina potássica é um antibiótico beta-lactâmico. É o análogo fenoximetil da penicilina G, quimica-

mente designado de ácido 3,3-dimetil-7-oxo-6(2-fenoxiacetamido)-4-tia-1-azabicyclo [3.2.0] heptano-2-carboxílico. Atua por inibição da biossíntese do mucopeptídeo da parede celular. Ação bactericida. Sua principal diferença para a benzilpenicilina é a resistência à inativação pelo suco gástrico.

FARMACOCINÉTICA

1. Administração → resistência à inativação pelo suco gástrico. Pode ser administrada durante as refeições
2. Ligação as proteínas plasmáticas → 80%;
3. Distribuição → ampla;
4. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos e crianças (> 12 anos)

Infecções estreptocócicas do trato respiratório superior

DOSE → 200.000 a 500.000 UI a cada 6 ou 8 horas, por 10 dias.

I) Infecções pneumocócicas do trato respiratório

DOSE → 400.000 a 500.000 UI a cada 6 horas em paciente febril por pelo menos 2 dias.



FENOXIMETILPENICILINA POTÁSSICA PEN-VE-ORAL

Pó para Suspensão Oral -- 800.000 UI/mL

II) Infecções estafilocócicas da pele e dos tecidos moles

DOSE → 400.000 a 500.000 UI a cada 6 ou 8 horas.

III) Fusoespiroquetoses da orofaringe

DOSE → 400.000 a 500.000 UI a cada 6 ou 8 horas.

IV) Para prevenção de recorrência de febre reumática e/ou coreia

DOSE → 200.000 a 500.000 UI duas vezes ao dia, ininterruptamente.

V) Profilaxia da endocardite bacteriana em pacientes com lesões cardíacas

DOSE → 3.000.000 de UI (1.500.000 de UI para crianças < 27 kg) uma hora antes do procedimento, e então, 1.500.000 de UI (800.000 a 1.000.000 de UI para crianças < 27 kg) após 6 horas.

Crianças (<12 anos):

DOSE → 25.000 A 90.000 UI/kg/dia, divididas em 3 a 6 administrações.

REAÇÕES ADVERSAS

- Sistema nervoso central: cefaleia;
- Sistema gastrointestinal: monilíase oral, náusea, vômito, diarreia;
- Trato genital: monilíase vaginal e/ou vulvar;
- Sistema urinário eletrolítico: edema por retenção de água e sódio;
- Sistema respiratório: dispneia;
- Sistema gastrointestinal: dor abdominal;
- Reações de hipersensibilidade.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Anticoncepcionais orais: redução da eficácia contraceptiva;
- Bloqueadores de bomba de prótons: a elevação do pH gástrico prejudica a absorção;
- Bupropiona: aumento do risco de convulsões;
- Pobrecina: inibe a secreção renal da penicilina, portanto, aumenta a concentração sérica desta;
- Tetraciclina e Cloranfenicol: podem reduzir o efeito terapêutico das penicilinas.



FENOXIMETILPENICILINA POTÁSSICA PEN-VE-ORAL

Pó para Suspensão Oral -- 800.000 UI/mL

CONTRAINDICAÇÕES

Bactérias resistentes: Produtoras de penicilase.

Indivíduos com história de hipersensibilidade a penicilinas e cefalosporinas.

Pneumonia grave, empiema, bacteremia, pericardite, meningite e artrite não devem ser tratadas com fenoximetilpenicilina potássica durante o estágio agudo.

Crianças menores de 5 anos de idade.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Fenoximetilpenicilina potássica de 2020. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



CEFALEXINA CEFALEXINA MONOIDRATADA

Suspensão oral – 262,96mg/5ml

INDICAÇÕES

- Infecções de pele e partes moles, ósseas e articulares;
- Profilaxia de endocardite em procedimentos dentários orais, em caso de alergia a penicilina ou ampicilina: manipulação de gengivas, periapical dos dentes e perfuração das mucosas;
- Profilaxia cirúrgica (cirurgias limpas e potencialmente contaminadas).

CLASSE

Cefalosporinas.

CEPAS

Infecções por *Streptococo pneumoniae*, *Streptococo pyogenis*, *Streptococo agalactiae* e *Streptococo viridans*.

MECANISMO DE AÇÃO

A Cefalexina é um antibiótico da classe das Cefalosporinas de primeira geração de amplo espectro com uso oral tendo atividade contra bactérias Gram positivo (estreptococos e estafilococos comunitários) e gram negativo (*Proteus mirabilis*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*). Atua na inibição da síntese de parede celular, via inibição da ligação cruzada dos polímeros de

mureína.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida pela administração oral, não tendo alteração com alimentação;
2. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 1 a 4 gramas, em doses fracionadas por dia.

Crianças:

DOSE → 25 a 50 mg/kg em doses fracionadas por dia.

Obs.: Na profilaxia cirúrgica realizar aproximadamente 1 hora antes do início da cirurgia, ou na indução anestésica.



CEFALEXINA CEFALEXINA MONOIDRATADA

Suspensão oral – 262,96mg/5ml

REAÇÕES ADVERSAS

- Sintomas de colite pseudomembranosa podem aparecer durante ou após o tratamento com antibióticos;
- Náuseas e vômitos;
- Diarreia;
- Dispepsia, dor abdominal e gastrite;
- Hipersensibilidade, erupções cutâneas, urticária, angioedema e eritema multiforme e síndrome de Stevens-Johnson.
- Prurido anal e genital, monilíase genital, vaginite e corrimento vaginal;
- Tonturas, fadiga e dor de cabeça;
- Agitação, confusão e alucinações;
- Artralgia, artrite e doenças articulares.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- O uso concomitante a anticoagulantes orais pode prolongar o tempo de protrombina;
- A administração concomitante a medicamentos tais como aminoglicosídeos, outras cefalosporinas, furosemida, aumenta o risco de neurotoxicidade;
- A cefalexina diminui a eficácia de anticoncepcionais orais. Desta forma, indica-se o uso adicional de métodos contraceptivos alternativos.

CONTRAINDICAÇÕES

É contraindicada a pacientes com alergia aos fármacos da classe dos betalactâmicos.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Cefalexina de 2020. Acesso em 27 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*. Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



CEFUROXIMA CEFUROXIMA SÓDICA

Ampola para uso parenteral – 750 mg



INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório;
- Infecções do ouvido;
- Infecções do sistema urinário;
- Infecções de tecidos moles, como: celulite (inflamação do tecido celular subcutâneo), infecção da pele causada por bactérias e infecções de feridas;
- Infecções de articulações e ósseas;
- Infecções ginecológicas, obstétricas e doenças inflamatórias pélvicas, gonorreia;
- Profilaxia cirúrgica em procedimentos potencialmente contaminados e contaminados.

CLASSE

Cefalosporinas.

CEPAS

Aeróbios Gram-positivos: *Staphylococcus aureus* e *Staphylococcus coagulase negativa*, *Streptococcus pyogenes*, estreptococos β -hemolíticos;

Aeróbios Gram-negativos: *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus parainfluenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Shigella spp.*;

Anaeróbios Gram-positivos: *Peptostreptococcus spp.*, *Propionibacterium spp.*;

Espiroquetas: *Borrelia burgdorferi*.

MECANISMO DE AÇÃO

A Cefuroxima é um antibiótico da classe das Cefalosporinas de segunda geração de amplo espectro com uso oral tendo atividade contra bactérias gram negativo (*Haemophilus influenzae*, *Enterobacter spp.*, *Neisseria spp.*, *Proteus mirabilis*, *Escherichia coli*). Atua na inibição da síntese de parede celular, via inibição da ligação cruzada dos polímeros de mureína.

FARMACOCINÉTICA

1. Concentração sérica máxima → 30 a 45 minutos;
2. Ligação as proteínas plasmáticas → 33 a 50%;
3. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 70 minutos;
4. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via parenteral.

Adultos:

DOSE → 750 mg três vezes ao dia. Dose



CEFUROXIMA CEFUROXIMA SÓDICA

Ampola para uso parenteral – 750 mg



máxima de 6 gramas por dia.

Lactentes e crianças:

DOSE → 30 a 100 mg/kg/dia, divididos em três ou quatro doses.

Recém-nascidos:

DOSE → 30 a 100 mg/kg/dia, divididos em duas ou três doses.

Obs.: Na profilaxia cirúrgica realizar aproximadamente 1 hora antes do início da cirurgia, ou na indução anestésica.

REAÇÕES ADVERSAS

- Distúrbios gastrointestinais;
- Exantema;
- Cefaleia, tontura;
- Fadiga;
- Trombocitopenia, leucopenia;

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Cefuroxima de 2020. Acesso em 28 de julho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*. Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.

- Aumento transitório das enzimas hepáticas, entre outras.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- A administração concomitante a medicamentos tais como aminoglicosídeos, outras cefalosporinas, furosemida, aumenta o risco de nefrotoxicidade;
- A cefuroxima diminui a eficácia de anticoncepcionais orais. Desta forma, indica-se o uso adicional de métodos contraceptivos alternativos.

CONTRAINDICAÇÕES

É contraindicada a pacientes com alergia aos fármacos da classe dos betalactâmicos.

Anotações:



CEFTRIAXONA CEFTRIAXONA SÓDICA

Ampola para uso parenteral – 1 g

INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório;
- Infecções do sistema nervoso (meningites);
- Sepses;
- Infecções do sistema urinário;
- Infecções de tecidos moles, como: celulite (inflamação do tecido celular subcutâneo), infecção da pele causada por bactérias e infecções de feridas;
- Infecções de articulações e ósseas;
- Infecções ginecológicas, obstétricas e doenças inflamatórias pélvicas, gonorreia;
- Profilaxia de endocardite em procedimentos dentários orais: manipulação de gengivas, periapical dos dentes e perfuração das mucosas;
- Profilaxia cirúrgica em procedimentos potencialmente contaminados e contaminados.

CLASSE

Cefalosporinas.

CEPAS

Ativa contra um amplo espectro de microrganismos Gram-positivos e Gram-negativos, sendo altamente estável à maioria

das betalactamases, tanto cefalosporinases quanto penicilinases desses microrganismos.

MECANISMO DE AÇÃO

Trata-se um antibiótico da classe das Cefalosporinas de terceira geração de amplo espectro com uso oral tendo atividade contra bactérias gram negativo (*Haemophilus influenzae*, *Enterobacter* spp., *Neisseria* spp., *Proteus mirabilis*, *Escherichia coli*). Atua na inibição da síntese de parede celular, via inibição da ligação cruzada dos polímeros de mureína.

FARMACOCINÉTICA

1. Concentração plasmáticas máxima → 2 a 3 horas;
2. Biodisponibilidade → 100%;
3. Distribuição → ampla;
4. Ligação as proteínas plasmáticas → 95%, ligando-se reversivelmente a albumina;
5. Metabolização → não é metabolizada sistemicamente;
6. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 8 horas;
7. Excreção → renal.



CEFTRIAXONA CEFTRIAXONA SÓDICA

Ampola para uso parenteral – 1 g

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via parenteral.

Na administração intramuscular deve-se dissolver Ceftriaxona IM 1g em 3,5 mL ou 500mg em 2mL de uma solução de lidocaína a 1% e injetar profundamente na região glútea ou em outro músculo relativamente grande.

Na administração intravenosa deve-se dissolver ceftriaxona IV 500 mg em 5 mL ou 1 g em 10 mL de água para injetáveis e então administrar por via intravenosa direta, durante 2 a 4 minutos.

Adultos e crianças acima de 12 anos:

DOSE → 1 – 4 g, dose única diária (cada 24 horas).

Recém-nascidos (abaixo de 14 dias):

DOSE → 20 – 50 mg/kg, dose única diária. Não ultrapassar 50 mg/kg.

Recém-nascidos, lactentes e crianças (15 dias até 12 anos):

DOSE → 20 – 80 mg/kg, dose única diária.

Obs.: Para crianças de 50 kg ou mais, deve ser utilizada a posologia de adultos.

Obs.: Na profilaxia cirúrgica realizar aproximadamente 1 hora antes do início da cirurgia, ou na indução anestésica.

REAÇÕES ADVERSAS

- Distúrbios gastrointestinais;
- Exantema;
- Cefaleia, tontura;
- Fadiga;
- Trombocitopenia;
- Anemia hemolítica;
- Hepatite colestática.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

A administração concomitante a medicamentos tais como aminoglicosídeos, outras cefalosporinas, furosemida, aumenta o risco de nefrotoxicidade;

A ceftriaxona diminui a eficácia de anticoncepcionais orais. Desta forma, indica-se o uso adicional de métodos contraceptivos alternativos.

CONTRAINDICAÇÕES

É contraindicada a pacientes com alergia aos fármacos da classe dos betalactâmicos.



CEFTRIAXONA CEFTRIAXONA SÓDICA

Ampola para uso parenteral – 1 g



Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Ceftriaxona de 2020. Acesso em 17 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*, Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



CEFEPIMA CLORIDRATO DE CEFEPIMA

Pó para solução injetável – 500, 1000 e 2000 mg

INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório;
- Infecções do sistema nervoso (meningites);
- Sepsis;
- Infecções do sistema urinário;
- Infecções de tecidos moles, como: celulite (inflamação do tecido celular subcutâneo), infecção da pele causada por bactérias e infecções de feridas.

CLASSE

Cefalosporinas.

CEPAS

Gram-positivos aeróbios:

Staphylococcus aureus, *Staphylococcus epidermidis*; Outros estafilococos entre os quais *S. hominis* e *S. saprophyticus*, *Streptococcus pyogenes* (estreptococos do Grupo A), *Streptococcus agalactiae* (estreptococos do Grupo B), *Streptococcus pneumoniae*; Outros estreptococos beta-hemolíticos (Grupos C, G, F), *S. bovis* (Grupo D) e estreptococos *Viridans*.

Gram-negativos aeróbios:

Aeromonas hydrophila, *Capnocytophaga sp.*, *Citrobacter sp.*, entre os quais *C. di-*

versus e *C. freundii*, *Campylobacter jejuni*, *Enterobacter sp.*, entre os quais *E. cloacae*, *E. aerogenes* e *E. sakazakii*, *Escherichia coli*, *Gardnerella vaginalis*, *Haemophilus ducreyi*, *Haemophilus influenzae* e entre outros.

Anaeróbios:

Bacteroides sp., *Clostridium perfringens*, *Fusobacterium sp.*, *Mobiluncus sp.*, *Peptostreptococcus sp.*, *Prevotella melaninogenica*.

MECANISMO DE AÇÃO

Trata-se um antibiótico da classe das Cefalosporinas de quarta geração de amplo espectro com uso oral tendo atividade contra bactérias gram positivo (estafilococos e estreptococos resistentes) e gram negativo (*Haemophilus influenzae*, *Enterobacter spp.*, *Neisseria spp.*, *Pseudomonas aeruginosa*). Atua na inibição da síntese de parede celular, via inibição da ligação cruzada dos polímeros de mureína.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → completamente absorvida;
2. Ligação as proteínas plasmáticas → 16,4%;
3. Metabolismo → hepática;
4. Tempo de ½ vida → 2 horas;



CEFEPIMA CLORIDRATO DE CEFEPIMA

Pó para solução injetável – 500, 1000 e 2000 mg

5. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via parenteral.

Adultos e crianças (> 40 kg):

DOSE → 500 – 2000 mg 12/12 horas.

Crianças (< 40 kg):

DOSE → 50 mg/kg a cada 8/8 horas.

REAÇÕES ADVERSAS

- Distúrbios gastrointestinais (tais como náuseas, vômitos, diarreia);
- Exantema;
- Enterocolite pseudomembranosa;
- Cefaleia, tontura;
- Fadiga;
- Trombocitopenia;
- Prurido, urticária;

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Cefepime de 2014. Acesso em 20 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

- Formação de autoanticorpos antieritrocitários sem hemólise significativa.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- A administração concomitante a medicamentos tais como aminoglicosídeos, outras cefalosporinas, furosemida, aumenta o risco de nefrotoxicidade;
- A cefepime diminui a eficácia de anticoncepcionais orais. Desta forma, indica-se o uso adicional de métodos contraceptivos alternativos.

CONTRAINDICAÇÕES

É contraindicada a pacientes com alergia aos fármacos da classe dos betalactâmicos.

Anotações:



CEFTAROLINA CEFTAROLINA FOSAMILA

Pó para solução injetável – 600 mg

INDICAÇÕES

- Pneumonia adquirida na comunidade;
- Infecções graves de pele e tecidos moles.

CLASSE

Cefalosporinas.

CEPAS

Organismos Gram-positivos:

Staphylococcus aureus; *Streptococcus pyogenes*; *Streptococcus agalactiae*; *Streptococcus anginosus*; *Streptococcus dysgalactiae*.

Organismos Gram-negativos:

Escherichia coli; *Klebsiella pneumoniae*; *Klebsiella oxytoca*; *Morganella morganii*.

MECANISMO DE AÇÃO

Trata-se um antibiótico da classe das Cefalosporinas de quinta geração de amplo espectro com uso oral tendo atividade contra bactérias gram positivo (estreptococos- *Streptococcus aureus* e *Streptococcus pneumoniae* resistentes) e gram negativo (*Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*). Atua na inibição da síntese de parede celular, via inibição da ligação cruzada dos polímeros de mureína.

FARMACOCINÉTICA

1. Concentração plasmática máxima → 8 horas;
2. Ligação as proteínas plasmáticas → 20%, baixa;
3. Metabolização → hepática;
4. Tempo de ½ vida → 2,5 horas;
5. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via intravenosa.

Adultos (maiores de 18 anos):

DOSE --: 600 mg diluídos em bolsa de infusão a cada 12 horas, por 1 hora.

REAÇÕES ADVERSAS

- Distúrbios gastrointestinais (tais como náuseas, vômitos, diarreia);
- Exantema;
- Enterocolite pseudomembranosa;
- Cefaleia, tontura;
- Fadiga;
- Trombocitopenia, anemia hemolítica;
- Prurido, urticária.



CEFTAROLINA CEFTAROLINA FOSAMILA

Pó para solução injetável – 600 mg

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- A administração concomitante a medicamentos tais como aminoglicosídeos, outras cefalosporinas, furosemida, aumenta o risco de nefrotoxicidade;
- Diminui a eficácia de anticoncepcionais orais. Desta forma, indica-se o uso adicional de métodos contraceptivos alternativos.

CONTRAINDICAÇÕES

É contraindicada a pacientes com alergia aos fármacos da classe dos betalactâmicos.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Ceftarolina de 2019. Acesso em 23 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



CLORANFENICOL ARIFENICOL SUCCINATO SÓDICO DE CLORANFENICOL Pó injetável – 1000 mg

INDICAÇÕES

- Tratamento de infecções por enterococos resistentes a vancomicina;
- Salmoneloses, principalmente em casos de febre tifoide;
- Alternativa terapêutica para o tratamento de meningite bacteriana e epiglote, artrite séptica e osteomielite, pacientes alérgicos a beta-lactâmicos;
- Tratamento de rickettsioses ou erlichiose.

CLASSE

Afenicóis.

CEPAS

Contra a maioria das bactérias anaeróbicas, incluindo *Bacteroides spp.*

MECANISMO DE AÇÃO

O cloranfenicol é um antibiótico da classe dos afenicóis de amplo espectro. É disponível na forma oral (palmitato), intravenosa (succinato) e tópica, tendo atividade contra bactérias Gram positivo (estreptococos) e gram negativo (*Shigella*, *Salmonella*, *Hemófilos*). Atua inibindo a síntese proteica, especificamente na subunidade 50S.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida e completamente absorvido no trato gastrointestinal;
2. Biodisponibilidade → 80% na ingestão oral;
3. Concentração plasmática máxima → 3 horas;
4. Distribuição → boa distribuição corpórea, com penetração no líquido cefalorraquidiano;
5. Ligação as proteínas plasmáticas → 50 a 60%;
6. Biotransformação → conjugado no fígado;
7. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 1,5 a 3,5 horas;
8. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via parenteral.

Adultos:

DOSE → 50mg/kg/dia com dose máxima de 4g, fracionadas em quatro doses diárias.

Crianças:

DOSE → 50mg/kg/dia, em quatro doses fracionadas.

Recém-nascidos de até duas semanas



CLORANFENICOL ARIFENICOL SUCCINATO SÓDICO DE CLORANFENICOL Pó injetável – 1000 mg

de vida:

DOSE → 25mg/kg/dia em quatro doses fracionadas.

REAÇÕES ADVERSAS

- Distúrbios gastrointestinais (tais como náuseas, vômitos, diarreia);
- Exantema;
- Enterocolite pseudomembranosa;
- Cefaleia, tontura;
- Fadiga;
- A toxicidade hematológica apresenta-se com reticulocitopenia, podendo evoluir com anemia, granulocitopenia, trombocitopenia, anemia aplásica, entre outros.
- Síndrome cinzenta do recém-nascido;
- Reações de hipersensibilidade como erupção macular ou vesicular acompanhada ou não de febre são incomuns.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- O cloranfenicol inibe a atividade do ci-

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Arifenicol de 2019. Acesso em 7 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

tocromo p450, interferindo na metabolização dos fármacos que utilizam esse complexo enzimático. Tais como fenobarbital, vafarina, vitamina B12, anti-diabéticos orais, entre outros fármacos;

- Pode induzir a reações se usado concomitantemente a ingesta alcoólica. Ocasionalmente o aparecimento de rubor cutâneo, hiperemia conjuntival, sensação de calor na face, cefaleia latejante, náuseas e opressão torácica;
- O cloranfenicol diminui a eficácia de anticoncepcionais orais. Desta forma, indica-se o uso adicional de métodos contraceptivos alternativos.

CONTRAINDICAÇÕES

É contraindicado a pacientes que apresentem hipersensibilidade ao Cloranfenicol, seus derivados ou a qualquer componente da fórmula.

Pacientes portadores de depressão medular, discrasias sanguíneas ou insuficiência hepática, gestantes no segundo e terceiro trimestre, lactentes e lactantes.



CLINDAMICINA CLORIDRATO DE CLINDAMICINA MONOIDRATADO

Cápsula – 300 mg

FOSFATO DE CLINDAMICINA

Ampola -- 150 mg

INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório superior, incluindo amidalite, faringite, sinusite, otite média;
- Infecções do trato respiratório inferior, incluindo bronquite e pneumonia;
- Infecções da pele e partes moles, incluindo acne, furúnculos, celulite, impetigo, abscessos e feridas infeccionadas;
- Infecções ósseas e infecções das articulações;
- Infecções dentárias, incluindo abscessos periodontais, periodontite e gengivite;
- Infecções da pelve e do trato genital feminino;
- Profilaxia de endocardite em procedimentos dentários orais, em caso de alergia a penicilina ou ampicilina: manipulação de gengivas, periapical dos dentes e perfuração das mucosas;
- Profilaxia antimicrobiana em cirurgia.

CLASSE

Lincosamidas.

CEPAS

Cepas sensíveis a *pneumococos*, *S. phyogenes* e *estreptococos viridans*.

Cepas de *S. aureus* sensíveis à metilina

em geral são sensíveis à clindamicina.

Bactérias anaeróbicas susceptíveis, por cepas susceptíveis de bactérias aeróbias Gram-positivas como *estreptococos*, *estafilococos* e *pneumococos*.

MECANISMO DE AÇÃO

A clindamicina é o principal antibiótico da classe das Lincosamidas. De ação bactericida de amplo espectro, um derivado do aminoácido ácido trans-L-4-n-propilgrínico, fixado a um derivado que contém enxofre de uma octose. Atua bloqueando a formação de ligações peptídicas, ligando-se exclusivamente à subunidade 50S dos ribossomos bacterianos (sítio A e P) e suprimindo a síntese de proteínas. Embora a clindamicina, a eritromicina e o cloranfenicol não sejam estruturalmente relacionados, todos os três atuam em locais em estreita proximidade, e a ligação de um desses antibióticos ao ribossomo pode inibir a interação dos outros. Não existe nenhuma indicação clínica para o uso concomitante desses antibióticos.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida;
2. Distribuição → ampla;
3. Metabolismo → hepático;
4. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 2,4 horas;
5. Excreção → renal.



CLINDAMICINA CLORIDRATO DE CLINDAMICINA MONOIDRATADO Cápsula – 300 mg FOSFATO DE CLINDAMICINA Ampola -- 150 mg

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 150-300 mg de 6/6 horas, em caso de infecções graves aumentar para 300-600 mg a cada 6 horas.

Crianças:

DOSE → 12-20 mg/kg/dia, divididas em 3 a 4 doses.

Administração via parenteral.

Adultos:

DOSE → 1200-2400 mg/dia, divididos em 3 a 4 doses iguais.

Crianças:

DOSE → 15-40 mg/kg/dia, em 3 ou 4 doses fracionadas.

Obs.: Na profilaxia cirúrgica realizar aproximadamente 1 hora antes do início da cirurgia, ou na indução anestésica.

REAÇÕES ADVERSAS

- Colite pseudomembranosa causada pela toxina do microrganismo *C. difficile*;
- Eritema multiforme exsudativo (síndrome de Stevens-Johnson);
- Elevação reversível dos níveis de aspartato aminotransferase e alanina aminotransferase granulocitopenia;
- Trombocitopenia e reações anafiláticas;
- A administração intravenosa pode ser seguida de tromboflebite local.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Deve-se evitar o uso concomitante de clindamicina e eritromicina ou clorafenicol.

CONTRAINDICAÇÕES

Não é indicado o uso concomitante de clindamicina com eritromicina, ou clorafenicol por atuarem nos mesmos sítios dos ribossomos 50S.

Indivíduos com história de hipersensibilidade a este ou outra lincosamida, ou algum componente da fórmula, dependendo da apresentação.

Fosfato de clindamicina é um medicamento classificado na categoria B de risco de gravidez. E durante o uso é detectável no leite



CLINDAMICINA
CLORIDRATO DE CLINDAMICINA MONOIDRATADO
Cápsula – 300 mg
FOSFATO DE CLINDAMICINA
Ampola -- 150 mg

materno.

Atenção, o uso de clindamicina pode causar colite membranosa.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Clindamicina de 2016. Acesso em 27 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*. Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



CIPROFLOXACINO CLORIDRATO DE CIPROFLOXACINO

Comprimido – 500 mg

Solução para infusão de ciprofloxacino -- 2 mg/mL

INDICAÇÕES

- Infecções do trato respiratório inferior;
- Infecções do trato geniturinário;
- Profilaxia antimicrobiana em cirurgia.

CLASSE

Fluoroquinolonas.

CEPAS

Micro-organismos Gram-positivos aeróbios: *Bacillus anthracis*, *Enterococcus faecalis*, *Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus saprophyticus* e *Streptococcus pneumoniae*.

Micro-organismos Gram-negativos aeróbios: *Burkholderia cepacia*, *Klebsiella pneumoniae*, *Providencia spp.*, *Campylobacter spp.*, *Klebsiella oxytoca*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Citrobacter freundii*, *Moraxella catarrhalis*;

Micro-organismos que mostram um grau variável de sensibilidade ao ciprofloxacino: *Burkholderia cepacia*, *Campylobacter spp.*, *Enterococcus faecalis*, *Morganella morganii*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Proteus mirabilis*, *Pseudomonas aeruginosa*.

MECANISMO DE AÇÃO

A ciprofloxacino é um antimicrobiano da classe das quinolonas fluoradas. Possui ampla atividade antimicrobiana. Os antibióticos quinolônicos tem como alvo a DNA-girase e a topoisomerase II e IV bacterianas, resultando em "superenrolamento" do DNA bacteriano, impedindo que haja divisão do DNA e por consequência, impedindo a replicação bacteriana.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida. Por via oral é absorvido no intestino delgado;
2. Ligação as proteínas plasmáticas → baixa, 20 a 30%;
3. Metabolismo → hepático;
4. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via parenteral.



CIPROFLOXACINO CLORIDRATO DE CIPROFLOXACINO

Comprimido – 500 mg

Solução para infusão de ciprofloxacino -- 2 mg/mL

Adultos:

INDICAÇÃO	DOSE DIÁRIA (MG)
Infeções do trato respiratório	2x 200 a 400 mg
Infeções do Trato Urinário: - Aguda, não complicada - Cistite em mulheres (antes da menopausa) - Complicada	2x 100 mg Dose única 100 mg 2x 200 mg
Diarreia	2x200 mg
Infeções graves (septicemia, pericardite, pneumonia esteptocócica, infecções decorrentes de fibrose cística)	3x400 mg
Gonorreia: - Extragenital - Aguda, não complicada	2x 100 mg ou dose única 100 mg

Administração via oral.

INDICAÇÃO	DOSE DIÁRIA (MG)
Infeções do trato respiratório	2x250 a 500 mg
Infeções do Trato Urinário: - Aguda, não complicada - Cistite em mulheres - Complicada	1 a 2x 250 mg Dose única 250 mg 2x 250 a 500 mg
Diarreia	1 a 2x 500 mg
Infeções graves (septicemia, pericardite, pneumonia esteptocócica, infecções decorrentes de fibrose cística)	2x750 mg

Crianças:

DOSE → 20 mg/kg duas vezes ao dia, dose máxima 1500 mg.



CIPROFLOXACINO CLORIDRATO DE CIPROFLOXACINO

Comprimido – 500 mg

Solução para infusão de ciprofloxacino -- 2 mg/mL

Obs.: Na profilaxia cirúrgica realizar aproximadamente 2 horas antes do início da cirurgia, ou na indução anestésica.

REAÇÕES ADVERSAS

- Náusea e diarreia;
- Infestação de infecção micótica;
- Eosinofilia;
- Cefaleia, tontura, distúrbio do sono
- Leucopenia reversível (inclusive neutropenia) e trombocitopenia;
- Anorexia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- A ciprofloxacino, como outras fluoroquinolonas deve ser utilizada com cautela em pacientes que estejam recebendo medicamentos conhecidos por prolongarem o intervalo QT (por exemplo, antiarrítmicos classes IA e III, antidepressivos

tricíclicos, macrolídeos, antipsicóticos);

- O omeprazol quando utilizado por via oral pode diminuir a absorção dos comprimidos de ciprofloxacino;
- Metotrexato: A administração concomitante de ciprofloxacino pode inibir o transporte tubular renal do metotrexato, podendo potencialmente aumentar os níveis plasmáticos deste.

CONTRAINDICAÇÕES

Está contraindicado o uso quando o paciente apresentar hipersensibilidade aos componentes da fórmula ou a outras fluoroquinolonas.

Risco categoria C. Não deve ser utilizado por gestantes.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Ciprofloxacino de 2016. Acesso em 7 de julho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

SCHVARTSMAN C. *et al.*. Manual Farmacêutico. Albert Einstein, 2019. Disponível em: <https://aplicacoes.einstein.br/manualfarmaceutico/Paginas/Termos.aspx?filtro=Profilaxia%20Antimicrobiana&itemID=150#-detalheTermo>. Acesso: 23 de setembro de 2021.



MOXIFLOXACINO CLORIDRATO DE MOXIFLOXACINO

Comprimido – 400 mg
Solução para infusão – 400 mg

INDICAÇÕES

- Infecções das vias respiratórias superiores e inferiores;
- Exacerbações agudas de bronquite crônica;
- Pneumonia adquirida na comunidade (PAC) incluindo PAC causada por cepas multirresistentes;
- Sinusite aguda.
- Infecções não complicadas de pele e tecidos moles;
- Doença inflamatória pélvica não complicada;
- Infecções complicadas de pele e anexos;
- Infecções intra-abdominais complicadas, incluindo infecções polimicrobianas, como abscessos.

CLASSE

Fluoroquinolonas.

CEPAS

Ampla ação bactericida em microorganismos gram-positivos e gram-negativos, anaeróbios, bactérias resistentes a ácidos e atípicos.

MECANISMO DE AÇÃO

O moxifloxacino é um agente antibacteriano da classe das quinolonas fluoradas (8-metóxi-fluoroquinolônico de amplo espectro e ação bactericida com atividade in vitro frente a uma ampla gama de microrganismos gram-positivos e gram-negativos, anaeróbios, bactérias resistentes a ácidos e atípicos, como por exemplo, *Chlamydia* spp, *Mycoplasma* spp e *Legionella* spp. A ação bactericida resulta da interferência nas topoisomerasas II e IV.

O moxifloxacino é eficaz frente a bactérias resistentes aos antibióticos β -lactâmicos e macrolídeos.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida;
2. Biodisponibilidade → 91%;
3. Concentração plasmática máxima → 4 horas;
4. Biotransformação → fase II;
5. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → 12 horas;
6. Excreção → renal e biliar/fecal.



MOXIFLOXACINO CLORIDRATO DE MOXIFLOXACINO

Comprimido – 400 mg
Solução para infusão – 400 mg

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral e parenteral.

Adultos (maiores de 18 anos):

DOSE → 400 mg/dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Superinfecções micóticas;
- Prolongamento do intervalo QT em pacientes com hipocalcemia;
- Cefaleia e tontura;
- Náuseas, vômitos, dores gastrintestinais e abdominais, diarreia;
- Aumento das transaminases;
- Anemia, leucopenia, neutropenia, trombocitopenia;
- Reação alérgica; prurido, rash e urticária;
- Eosinofilia sanguínea;
- Hiperlipidemia;
- Reações de ansiedade, hiperatividade psicomotora / agitação, parestesia e disestesia, distúrbios do paladar, confusão e desorientação, distúrbios do sono, tremor, vertigens;
- Sonolência.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Antiácidos, minerais e multivitaminas: A ingestão concomitante de cloridrato de moxifloxacino com antiácidos, minerais e multivitaminas pode diminuir a absorção do moxifloxacino após administração oral devido à formação de complexos quelados com os cátions multivalentes contidos nestes preparados. Isto pode levar a concentrações plasmáticas consideravelmente mais baixas do que o desejado;
- Portanto, antiácidos, agentes antirretrovirais (por exemplo, didanosina) e outros produtos contendo magnésio ou alumínio, sucralfato e agentes contendo ferro ou zinco devem ser administrados pelo menos 4 horas antes ou 2 horas após a ingestão de uma dose oral de moxifloxacino.

CONTRAINDICAÇÕES

Gravidez e lactação.

Indivíduos menores de 18 anos.

Hipersensibilidade ao fármaco ou a outra quinolona.



MOXIFLOXACINO
CLORIDRATO DE MOXIFLOXACINO
Comprimido – 400 mg
Solução para infusão – 400 mg

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional Moxifloxacino de 2019. Acesso em 7 de julho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



CAPÍTULO 2

ANTI-HELMÍNTÍASES

ADRIELE FRANCISCA DA SILVA SOUZA
MARCELO DIAS FERREIRA JUNIOR
MARCELO VAUGHAN LIMA DE OLIVEIRA
WANDERSON THIAGO SANTOS NOLETO
ELLEN ÁGATTA MARINHO SILVA
JÚLIO ARAÚJO RENDEIRO
EDUARDA BATISTA LOGRADO
AYNIERE SOUSA SOARES
IVETE FURTADO RIBEIRO CALDAS
ANDERSON BENTES DE LIMA
PRISCILA XAVIER DE ARAÚJO



ALBENDAZOL

ZENTEL[®]Suspensão oral – 40 mg/ml
Comprimido – 200 e 400 mg

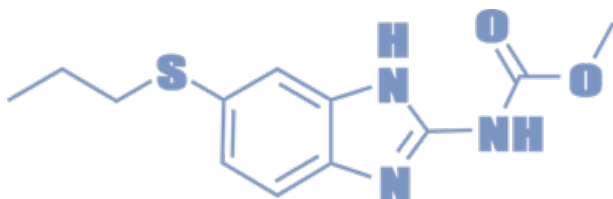
INDICAÇÕES

- Infecções por neumatóides ancilóstomos, *T. trichiura* e *A. Lumbricoides*;
- Tratar hidatidose que tem como causa principal o *Echinococcus granulosus*, a neurocisticerose resultado da infecção da *Taenia Solium*;
- Tratamento de doenças intestinais por *Capillaria philippinensis* e larva migrans cutânea.

CLASSE

Anti-helmíntico.

MECANISMO DE AÇÃO



O Albendazol liga-se a β -tubulina, assim os microtúbulos não sofrem a polimerização e como resultado podem ter algumas alterações nos parasitas como inibição da fumarato, glicose fica com transporte diminuído e a fosforilação oxidativa é interrompida.

FARMACOCINÉTICA

1. Administração → oral;
2. Absorção → aumenta cerca de cinco vezes quando ingerido na presença de comidas gordurosas, é pouco hidrossolúvel;
3. Metabolismo → realizado no fígado, onde é transformado em Sulfóxido de albendazol;
4. Ligação as proteínas plasmáticas → aproximadamente 70%;
5. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → em torno de 4 a 15 horas;
6. Excreção → metabólicos tem como via de excreção a urina.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos (maiores de 2 anos):

Enterobius vermicularis e *Ancylostoma duodenale*.

DOSE → 1 comprimido de 400 mg (10 ml da suspensão a 4%).

Duração do tratamento: Dose única.

- *Strongyloides stercoralis*, *Taenia* spp., *Hymenolepis nana*

DOSE → 1 comprimido de 400 mg (10 ml



ALBENDAZOL

ZENTEL[®]

Suspensão oral – 40 mg/ml
Comprimido – 200 e 400 mg

da suspensão a 4%).

Duração do tratamento: 1 comprimido por dia, em 3 dias consecutivos.

- Opistorquíase

DOSE → 2 comprimidos de 400 mg (10 ml da suspensão a 4%).

Duração do tratamento: 1 comprimido, duas vezes ao dia, em no período de 1 a 3 dias.

Administração via oral.

Adultos (maiores de 2 anos):

- Larva migrans cutânea

DOSE → 1 comprimido de 400 mg (10 ml da suspensão a 4%).

Duração do tratamento: 1 comprimido no período de 1 a 3 dias.

- *Ascaris lumbricoides*, *Necator americanus*, *Trichuris trichiura*

DOSE → 1 comprimido 400 mg (10 ml da suspensão a 4%).

Duração do tratamento: Dose única.

Crianças (1 a 2 anos):

- *Ascaris lumbricoides*, *Necator americanus*, *Trichuris trichiura*

DOSE → 1 comprimido 200 mg (5 ml da suspensão a 4%).

Duração do tratamento: Dose única.

Crianças (2 anos a 12 anos):

- Giardíase

DOSE → 1 comprimido 400 mg (10 ml da suspensão a 4%) por dia.

Duração do tratamento: 5 dias consecutivos.

REAÇÕES ADVERSAS

São reações poucos expressivas nos pacientes, cerca de 1% dos pacientes apresentam sintomas, como:

- Dor no abdome;
- Diarreia;
- Vômitos;
- Dor de cabeça.



ALBENDAZOL

ZENTEL[®]

Suspensão oral – 40 mg/ml
Comprimido – 200 e 400 mg

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Não se deve administrar a albendazol ao mesmo tempo com:
- Quando utilizado junto com cimetidina, dexametasona e praziquantel eleva-se concentração do metabólito do albendazol nos tecidos;
- Quando utilizado junto com fenobarbital, fenitoína, carbamazepina e ritonavir baixa a concentração do metabólito do albendazol nos tecidos.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Tratamento de grávidas devido prejudicar o desenvolvimento do feto, causando anomalias congênitas;
- Pessoas que tem alergia ao medicamento.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Albendazol de 2019. Acesso em 18 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:



IVERMECTINA RECEVTINA ®

Comprimido – 6 mg
Creme dermatológico – 10 mg/g

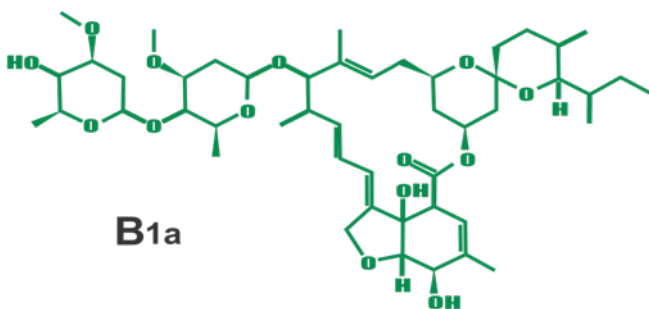
INDICAÇÕES

- Oncocercose;
- Filariose;
- Estrongiloidíase;
- Pediculose;
- Escabiose;
- Ascaridíase.

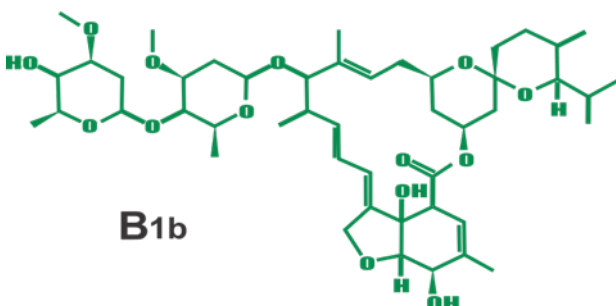
CLASSE

Anti-helmíntico, anti escabiótico, antiparasitário.

MECANISMO DE AÇÃO



B1a



B1b

O fármaco atua imobilizando os vermes, ou seja, provocando paralisia da musculatura do parasita. Isso ocorre devido a indução e ativação dos canais de Cl⁻ sensíveis a Ivermectina (avermectinas), que são controlados por glutamato.

FARMACOCINÉTICA

1. Pico plasmático → 4-5 horas após administração oral;
2. Tempo de ½ vida → 22 a 28 horas;
3. Ligação as proteínas plasmáticas → 93% do fármaco;
4. Metabolismo → metabolização hepática a maior parte convertido em metabólitos pelo CYP3A4;
5. Distribuição → Não atravessa a Barreira Hematoencefálica em condições normais;
6. Excreção → principalmente nas fezes em aproximadamente 12 dias.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Estrongiloidíase, Filariose, Ascaridíase, Escabiose e Pediculose

DOSE → fornecendo 200 mcg por kg de peso corporal.



IVERMECTINA RECEVTINA ®

Comprimido – 6 mg
Creme dermatológico – 10 mg/g

PESO CORPORAL	DOSE ORAL ÚNICA
15 a 24	½ comprimido
25 a 35	1 comprimido
36 a 50	1 ½ comprimidos
51 a 65	2 comprimidos
66 a 79	2 ½ comprimidos
≥ 80	200mcg/kg

Duração do tratamento: dose única.

Oncocercose

DOSE → fornecendo 150 mcg por kg de peso corporal.

PESO CORPORAL	DOSE ORAL ÚNICA
15 a 25	½ comprimido
26 a 44	1 comprimido
45 a 64	1 ½ comprimidos
65 a 84	2 comprimidos
≥ 85	150mcg/kg

Duração do tratamento: dose única.

REAÇÕES ADVERSAS

Quando ocorrem, geralmente manifestam-se de forma leve e transitória e incluem:

- Diarreia;
- Náuseas;
- Astenia;
- Dor abdominal;
- Anorexia;
- Constipação;
- Vômitos.
- Reações relacionadas ao SNC:
- Tontura;
- Sonolência;
- Vertigem;
- Tremores.
- Reações epidérmicas:
- Prurido;
- Erupções;
- Urticária.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Não se deve administrar a ivermectina ao mesmo tempo com:
- Recomenda-se cautela no uso concomitante com drogas que deprimem o SNC.



**IVERMECTINA
RECEVTINA ®**
Comprimido – 6 mg
Creme dermatológico – 10 mg/g

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade ao medicamento ou componentes da fórmula;
- Pacientes com meningite ou outras disfunções do SNC;
- Crianças com peso inferior a 15 kg ou menores de 5 anos.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Ivermectina de 2018. Acesso em 18 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

PRAZIQUANTEL
CESTOX®

Comprimido – 150 e 500 mg

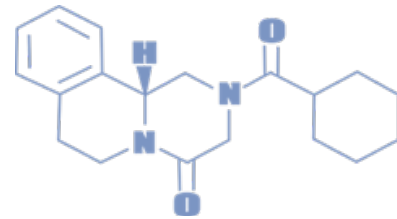
INDICAÇÕES

- É a primeira escolha no tratamento da esquistossomose causada por todas as espécies de *Schistosoma*;
- Tratamento de clonorquíase e opistorquíase e outras infecções por trematódeos;
- É eficaz nas fases adultas e de larvas de todos estes cestódeos, incluindo a cisticercose, infecção por *Cysticercus cellulosae*, estágio larval ou tissular da *Taenia solium*;
- Tratamento de infecções provocadas pelo *Cysticercus cellulosae*, com localização no sistema nervoso central (neurocisticercose), no tecido subcutâneo e na musculatura estriada esquelética;
- É eficaz nas formas adultas de *Taenia solium* e *Taenia saginata*, bem como em outros cestódeos (*Diphyllobothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Hymenolepis nana*) e trematódeos.

CLASSE

Anti-helmíntico.

MECANISMO DE AÇÃO



Provoca aumento da atividade muscular, seguido de contração e paralisia espástica. Esse efeito potencialmente reversível desfaz a ligação dos vermes com os tecidos do hospedeiro, resultando, no rápido deslocamento das veias mesentéricas para o fígado ou promovendo a expulsão de cestódeos intestinais para o meio ambiente.

Provoca vacuolização e vesiculação do tegumento de parasitas suscetíveis. Esse efeito resulta em liberação do conteúdo do parasita, ativação do mecanismo de defesa do hospedeiro e destruição dos vermes. Desregulando os mecanismos que controlam o fluxo de cátions das membranas celulares dos vermes, ocasionando despolarização nas células do parasita. Perturba o metabolismo glicídico dos vermes, ocasionando redução na captação de glicose e liberação aumentada de lactato.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → Rápida e completa;
2. Concentração máxima → 1-2h;
3. Meia-vida → 0,8-3h forma inalterada;



PRAZIQUANTEL
CESTOX®

Comprimido – 150 e 500 mg

4-6h metabólitos;

4. Ligação as proteínas plasmáticas → ~ 80%;
5. Metabolismo → metabolismo de primeira passagem, com formação de muitos derivados hidroxilados e conjugados inativos, reduzindo a biodisponibilidade do fármaco;
6. Excreção → 70% via renal, predominantemente na forma de metabólitos, nas primeiras 24h. A maior parte restante, é metabolizada no fígado e eliminada na bile.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

I) Neurocisticercose

DOSE → 50 mg/kg ao dia, divididos em 3 doses diárias.

Duração do tratamento: durante 15 dias, podendo ser necessário repetir o tratamento após 3 meses.

II) Cisticercose

DOSE → 50 mg/kg ao dia, divididos em 3 doses diárias.

Duração do tratamento: durante 14 dias.

III) Esquistossomose

DOSE → 50 mg/kg ao dia.

Duração do tratamento: dose única.

IV) Infecções intestinais por *Taenia saginata* e *Taenia solium*

DOSE → 5 a 10 mg/kg ao dia.

Duração do tratamento: dose única.

V) Infecção por *Hymenolepis nana*

DOSE → 15 a 25 mg/kg ao dia.

Duração do tratamento: dose única.

VI) *Diphyllobothrium latum* e *Dipylidium caninum*

DOSE → 25 mg/kg ao dia.

Duração do tratamento: dose única.

Crianças (acima de 4 anos):

I) Esquistossomose

DOSE → 60 mg/kg ao dia, divididos em 3 doses diárias

Duração do tratamento: dose única.



PRAZIQUANTEL CESTOX[®]

Comprimido – 150 e 500 mg

REAÇÕES ADVERSAS

- Inapetência;
- Cefaleia;
- Tonturas;
- Obnubilação;
- Dor abdominal;
- Náusea;
- Vômito;
- Urticária;
- Erupções cutâneas pruriginosas;
- Fraqueza;
- Cansaço;
- Aumento da temperatura corporal;
- Eosinofilia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a praziquantel ao mesmo tempo com:

- Bebidas alcoólicas não devem ser consumidas juntamente, nem no dia seguinte ao uso do medicamento;
- Determinados antiepilépticos, glicocorticoides ou cloroquina podem ocasionar níveis plasmáticos reduzidos de praziquantel, pois são agentes que induzem o sistema microsomal hepático (citocromo P450);
- Rifampicina, um potente indutor do citocromo P450, uma vez que não podem ser esperados níveis plasmáticos terapêuticamente eficazes de praziquantel;
- A administração simultânea de agentes que inibem o sistema microsomal hepático (citocromo P450), tais como cimetidina ou cetoconazol pode ocasionar níveis plasmáticos aumentados e um tempo de retenção prolongado de praziquantel.



PRAZIQUANTEL
CESTOX[®]

Comprimido – 150 e 500 mg

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade comprovada ao praziquantel ou a qualquer um dos componentes da fórmula;
- Cisticercose ocular, pois a destruição do parasita no olho pode causar lesão irreversível;
- Portador de insuficiência hepática e/ou renal grave;
- Menores de 04 anos de idade;
- Associação com a rifampicina e cetocozazol.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Praziquantel de 2018. Acesso em 13 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



DIETILCARBAMAZINA CITRATO DIETILCARBAMAZINA

Comprimido – 50 mg

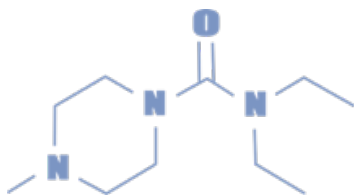
INDICAÇÕES

- Filaríase linfática;
- Doença parasitária causada por *Wuchereria bancrofti*;
- Loíase, causada por *Loa loa*;
- Oncocercose por *Onchocerca volvulus*;
- Toxocaríase (larva migrans visceral) proveniente dos vermes *Toxocara canis* e/ou *Toxocara cati*;
- Eosinofilia pulmonar tropical de origem filarial por *Wuchereria bancrofti*.

CLASSE

Antifilarial.

MECANISMO DE AÇÃO



A dietilcarbamazina leva à alteração do metabolismo do ácido aracdônico na microfilária e nas células endoteliais do hospedeiro.

Essas modificações levam a uma vasoconstrição, que amplifica a adesão endotelial, propiciando à imobilização do parasito circulante, aumentando a aderência e a ativi-

dade citotóxica das plaquetas e granulócitos do hospedeiro.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → Rápida pelo trato digestivo;
2. Concentração máxima → 1-2h;
3. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 5-13h, sendo 2 a 3h na presença de urina ácida e, cerca de 10 h em urina alcalina;
4. Metabolismo → Rápido e extenso. Dietilcarbamazina-N-óxido é o principal metabólito;
5. Excreção → Por vias urinárias, com cerca de 50% composto por fármaco inalterado, em urina ácida. E, via fecal correspondendo a menos de 5%.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

I) Loíase

DOSE → 8 a 10 mg/kg/dia.

Duração do tratamento: 2 a 3 semanas.

II) Oncocercose

DOSE → 0,5 mg/kg, em 1 tomada, no primeiro dia e 2 vezes no segundo dia; a seguir, 1 mg/kg, 3 vezes no terceiro dia e 2 a



DIETILCARBAMAZINA CITRATO DIETILCARBAMAZINA

Comprimido – 50 mg

3 mg/kg em 2 doses fracionadas.

Duração do tratamento: 14 dias.

III) Toxocaríase

DOSE → 6 mg/kg/dia.

Duração do tratamento: 7 a 10 dias.

Adultos e crianças acima de 10 anos:

IV) Filaríase linfática

DOSE → inicialmente 1 mg/kg, até 6 mg/kg/dia dividida a cada 12 horas.

Duração do tratamento: dose única no primeiro dia, aumentado gradualmente nos próximos 3 dias até a dose máxima ao dia por 12 a 21 dias.

V) Eosinofilia pulmonar tropical por *Wuchereria bancrofti*

DOSE → inicialmente 6 a 8 mg/kg/dia, dividido em 3 doses.

Duração do tratamento: 14 a 21 dias.

Crianças menores de 10 anos e maiores de 5 anos (mais de 15 kg):

VI) *Wuchereria bancrofti*

DOSE → inicialmente 3 a 4 mg/kg/dia, dividido em 3 doses.

Duração do tratamento: 14 a 21 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- Distúrbios no trato gastrointestinal: náuseas, vômitos, diarreia, constipação intestinal.
- Sonolência;
- Dores de cabeça;
- Febre;
- Dores escrotais;
- Mialgia;
- Leucocitose;
- Anorexia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não se deve administrar a dietilcarbamazina ao mesmo tempo com:

- Bebida alcoólica, pois pode aumentar sua toxicidade ao fígado;
- Alcalinizantes urinários podem reduzir a perda de dietilcarbamazina na urina, enquanto os acidificantes aumentam a



DIETILCARBAMAZINA CITRATO DIETILCARBAMAZINA

Comprimido – 50 mg

perda, diminuindo os seus efeitos terapêuticos;

- Medicamentos à base de acetazolamida;
- Crianças menores de 5 anos de idade ou com menos de 15 kg.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Hipersensibilidade comprovada a dietilcarbamazina ou a qualquer um dos componentes da fórmula;
- Linfangite aguda;
- Filaríase;
- Infecção simultânea por *Onchocerca volvulus* ou *Loa loa*;
- Hipertensão arterial e/ou doença renal grave.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

- BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.
- DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.
- RANG, H. P. *et al.* Rang & Dale Farmacologia. 8. ed. Rio de Janeiro: Elsevier, 2016.



OXAMNIQUINA MANSIL®

Suspensão oral – 50 mg/ml

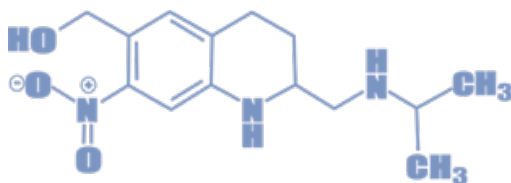
INDICAÇÕES

- É utilizado como segunda escolha ao praziquantel;
- Indicado como tratamento de infecções pelo *Schistosoma mansoni*, principalmente por ter atividade esquistomicida.

CLASSE

Anti-helmíntico e esquistossomicidas.

MECANISMO DE AÇÃO



Atua tanto como esquistomicida quanto impossibilitando que as fêmeas liberem seus ovos. Age, principalmente, na fase inicial da infecção, ou seja, logo após a infecção pelo *Schistosoma mansoni*.

Não há consenso sobre o mecanismo de ação da oxamniquina na literatura, mas há especulações que a sua farmacodinâmica envolve a alquilação no DNA do *Schistosoma*.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → É melhor tolerado quando administrado após a ingestão de alimentos. Bem absorvido por via oral;
2. Concentrações plasmáticas → pico entre 1 e 1,5 hora;
3. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 1 a 2,5 horas;
4. Metabolismo → É amplamente transformado em metabolitos ácidos inativos, que são excretados na urina;
5. Excreção → excretada inalterado na urina.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 15 mg/kg.

Duração do tratamento: dose única.

Peso corporal (Kg)	Nº de cápsulas (250mg)
Até 33	2
34 – 50	3
51 – 66	4
67 – 83	5
84 – 100	6

Crianças (até 12 anos):

DOSE → 20 mg/kg em 2 doses de 10 mg/kg em um único dia com intervalo de 3 – 8



OXAMNIQUINA
MANSIL®

Suspensão oral – 50 mg/ml

horas.

Duração do tratamento: dose única.

REAÇÕES ADVERSAS

- Tontura;
- Sonolência;
- Delírio;
- Alucinações.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Não foram avaliadas de maneira sistêmica.

CONTRAINDICAÇÕES

O medicamento é contraindicado em casos de:

- Em casos de hipersensibilidade a oxamniquina.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Oxamniquina de 2004. Acesso em 01 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:



CAPÍTULO 3

ANTIFÚNGICOS

DAVI DA SILVA MARTINS
TIAGO RIBEIRO
ELLEN ÁGATTA MARINHO SILVA
JÚLIO ARAÚJO RENDEIRO
EDUARDA BATISTA LOGRADO
CARLA NOGUEIRA SOARES
AYNIERE SOUSA SOARES
PRISCILA XAVIER DE ARAÚJO



ITRACONAZOL
SPORANOX®
Cápsula – 100 mg
Solução oral – 10 mg/mL

INDICAÇÕES

- Candidíase vulvovaginal, dermatomicoses;
- Pitiríase versicolor;
- Candidíase oral;
- Ceratite fúngica;
- Aspergilose;
- Candidíase sistêmica;
- Criptococose;
- Histoplasmose e outras micoses sistêmicas;
- Profilaxia de infecções fúngicas em indivíduos imunodeprimidos.

CLASSE

Antifúngico fungistático sintético do grupo dos triazóis.

MECANISMO DE AÇÃO

Atuam na inibição da 14-alfa-esterol-demetilase, prejudicando assim a síntese dos ergosterol, levando ao acúmulo de 14alfa-metil-3,6-diol, o qual é um composto tóxico, não permitindo o crescimento e comprometendo a síntese enzimática do patógeno.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → em cápsulas bem absorvido no estado pós-prandial e solução oral

- sobre melhor absorção em jejum;
2. Metabolização → hepática;
3. Ligação as proteínas plasmáticas → maior que 99%;
4. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 30 a 40 horas.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

I) Candidíase vulvovaginal

DOSE → 200 mg duas vezes ao dia por 1 dia ou 200 mg uma vez ao dia por 3 dias.

II) Dermatomicose

DOSE → 200 mg uma vez ao dia por 7 dias ou 100 mg uma vez ao dia por 15 dias.

III) Pitiríase versicolor

DOSE → 200 mg ao dia por 7 dias.

IV) Candidíase oral

DOSE → 100 mg uma vez ao dia por 15 dias.

V) Onicomicose

DOSE → Tratamento contínuo – 200 mg uma vez ao dia por 3 meses;

Pulsoterapia – 200 mg duas vezes ao dia



ITRACONAZOL SPORANOX[®] Cápsula – 100 mg Solução oral – 10 mg/mL

durante uma semana com intervalo de três semanas sem medicamento.

REAÇÕES ADVERSAS

- Efeito gastrintestinais como diarreia, cólicas abdominais, anorexia e náuseas;
- Cefaleia;
- Hipertrigliceridemia;
- Granulocitopenia;
- Hepatite (raro);
- Reações alérgicas (síndrome de Stevens-Johnson). Existe associação com lesão hepática.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- O itraconazol é metabolizado pela CY-P3A4. A coadministração com indutores desta enzima pode diminuir a sua biodisponibilidade;
- A coadministração com inibidores pode aumentar sua biodisponibilidade.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Itraconazol de 2019. Acesso em 10 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Uso contra-indicado: ergotamina, midazolam, domperidona, sinvastatina, lovastatina, metadona, quinidina.

Uso não recomendado: fentanila, isoniazida, rifampicina, carbamazepina, fenibarbital, fenitoína.

CONTRAINDICAÇÕES

Em caso de hipersensibilidade ao fármaco.

Na coadministração com substratos da CY-P3A4. Pois pode acarretar prolongamento do intervalo QT e a taquiarritmias ventriculares.

Não pode ser administrado em pacientes com diagnóstico de disfunção ventricular ou insuficiência cardíaca congestiva, todavia o risco benefício pode ser calculado em casos de infecções graves.

Não pode ser administrado em grávidas.

Anotações:



FLUCONAZOL

ZOLTEC[®]

Cápsula – 100 e 150 mg

Solução oral – 10 mg/mL

INDICAÇÕES

- Candidíase vaginal aguda e recorrente;
- Balanites causados por *Candida*;
- Profilaxia para reduzir a incidência de candidíase vaginal recorrente (três ou mais episódios por ano);
- Dermatomicoses: *Tinea pedis*, *Tinea corporis*, *Tinea cruris*, *Tinea unguium* (onicomicoses).

CLASSE

Antifúngico fungistático sintético do grupo dos triazóis.

MECANISMO DE AÇÃO

Atuam na inibição da 14-alfa-esterol-de-metilase, prejudicando assim a síntese dos ergosterol, levando ao acúmulo de 14alfa-metil-3,6-diol, o qual é um composto tóxico, não permitindo o crescimento e comprometendo a síntese enzimática do patógeno.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → completa pelo trato gastrointestinal;
2. Concentrações plasmáticas → iguais;
3. Biodisponibilidade → não é alterada na presença de alimento;

4. Excreção → renal;

5. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 25 a 30 horas;

6. Ligação as proteínas plasmáticas → 11 a 12%.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

I) Dermatomicose

DOSE → dose única semanal de 150 mg por 2 a 4 semanas.

II) Onicomicose

DOSE → dose única semanal de 150mg até a unha infectada ter sido totalmente substituída, durando o processo de 3 a 6 meses.

III) Candidíase vulvovaginal e balanite

DOSE → dose única de 150 mg.

IV) Prevenção de candidíase recorrente

DOSE → dose mensal de 150 mg.

REAÇÕES ADVERSAS

- Efeito gastrintestinais como dor abdominal, diarreia, náuseas e vômitos;
- Cefaleia;



FLUCONAZOL

ZOLTEC®

Cápsula – 100 e 150 mg

Solução oral – 10 mg/mL

- Aumento das enzimas hepáticas;
- Rash cutâneo.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- O Fluconazol é um inibidor das enzimas hepáticas CYP3A4, CYP2C9, CYP2C19, alterando o metabolismo de outros fármacos, ou o próprio metabolismo do fluconazol sendo modificado por outros medicamentos.

Uso contra-indicado: Eritromicina, cisaprida, terfenadina, astemizol, pimizida, quinidina.

O uso concomitante requer atenção e ajustes de dose: hidroclorotiazida, rifampicina, amitriptilina, nortriptilina, anfotericina B, anticoagulantes, azitromicina, bloqueadores do canal de cálcio, celecoxibe, inibidores da HMG-CoA redutase, losartana, AINES, contraceptivos orais, prednisona, zidovudina e vitamina A.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Fluconazol de 2020. Acesso em 15 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

Não deve ser usado em pacientes com sensibilidade a fórmula.

A coadministração com a terfenadina pois há interação com as doses múltiplas de fluconazol.

Além da coadministração de fármacos que prolongam o intervalo QT e são metabolizados com as enzimas CYP3A4, como cisaprida, eritromicina e quinidina e entre outros.

Anotações:



CETOCONAZOL

Shampoo – 20 mg/mL

INDICAÇÕES

- Tratamento de dermatite seborreica do couro cabeludo em adultos causadas por fungos e leveduras como *Trichophyton*, *Epidermophyton*, *Microsporum spp*, *Candida spp.*, *Pityrosporum*.
- Alivia prurido e descamação, que geralmente ocorrem em casos de dermatite seborreica.

CLASSE

Antifúngico fungistático sintético do grupo dos imidazóis.

MECANISMO DE AÇÃO

Atuam na inibição da 14-alfa-esterol-demetilase, prejudicando assim a síntese dos ergosterol, levando ao acúmulo de 14alfa-metil-3,6-diol, o qual é um composto tóxico, não permitindo o crescimento e comprometendo a síntese enzimática do patógeno.

FARMACOCINÉTICA

O uso tópico do fármaco, mesmo que seja de maneira crônica, não apresenta absorção percutânea e assim ausência de alguma ação sistêmica.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via tópica.

Lavar as áreas afetadas com o cetoconazol shampoo, deixar agir e enxaguar após um período de ação de 3-5 minutos.

I) Dermatite seborreica

DOSE → 2 vezes por semana por 2 a 4 semanas.

II) Profilaxia de dermatite seborreica

DOSE → 1 vez por semana ou 1 vez a cada 2 semanas.

REAÇÕES ADVERSAS

- As reações adversas são incomuns devido a ínfima quantidade de medicamento absorvida;
- Acne;
- Alopecia;
- Dermatite por contato;
- Pele seca;
- Textura anormal do cabelo;
- Exantema;
- Sensação de queimação da pele;
- Distúrbio cutâneo;
- Esfoliação cutânea;



CETOCONAZOL

Shampoo – 20 mg/mL

- Eritema em local de aplicação;
- Irritação em local de aplicação;
- Hipersensibilidade em local de aplicação.
- Prurido em local de aplicação, pústulas em local de aplicação, reação em local de aplicação.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não há nenhuma interação medicamentosa conhecida com o uso do cetoconazol shampoo.

CONTRAINDICAÇÕES

Somente quando o paciente apresenta hipersensibilidade ao fármaco e a fórmula.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Cetoconazol de 2019. Acesso em 25 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:



NITRATO DE MICONAZOL

Loção – 20 mg/g – Frasco com 30 ml

Creme – 20 mg/g – Bisnaga de 28 g

Creme vaginal – 20 mg/g – 14 bisnagas contendo 5 g para 14 aplicadores

Gel oral – 20 mg/g – Bisnaga de 40 g

Pó – 20 mg/g – Frasco de 30 g

INDICAÇÕES

Loção, Creme e Pó:

- Micoses superficiais por dermatófitos: *Tinea capitis*, *Tinea barbae*, *Tinea corporis*, *Tinea cruris*, *Tinea pedis* (pé-de-atleta), *Tinea unguium* e *Tinea versicolor*;
- Onicomicoses: causadas pelo *Trycho-phyton*, *Epidermophyton* e *Microsporum*;
- Micoses superficiais por leveduras: *Candida spp.* candidíase cutânea e candidíase intertriginosa (frieira).

Creme vaginal:

- *Candida spp.*: Candidíase vaginal e perianal.

Gel oral:

- *Candida spp.*: Candidíase oral e esofágica.

CLASSE

Antifúngico imidazol.

MECANISMO DE AÇÃO

O miconazol é um antifúngico imidazol de amplo espectro com uso tópico tendo ativi-

dade contra dermatófitos, leveduras e outros fungos.

Atua na inibição da biossíntese do ergosterol na membrana celular fúngica, alterando sua permeabilidade e prejudicando o crescimento do patógeno (atividade fungistática).

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → no uso tópico persiste até 72 horas após uma aplicação;
2. Biodisponibilidade → no uso tópico 1 a 2%;
3. Concentração plasmática → 2 horas;
4. Ligação as proteína plasmáticas → 88,2%;
5. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → 57 horas;
6. Excreção → fecal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via tópica.

a) Loção, Creme e Pó

Lavar e secar o local antes da aplicação, cobrindo área um pouco maior que a região afetada.

DOSE → Aplicar 2 vezes ao dia cobrindo toda área afetada por 2 semanas.



NITRATO DE MICONAZOL

Loção – 20 mg/g – Frasco com 30 ml

Creme – 20 mg/g – Bisnaga de 28 g

Creme vaginal – 20 mg/g – 14 bisnagas contendo 5 g para 14 aplicadores

Gel oral – 20 mg/g – Bisnaga de 40 g

Pó – 20 mg/g – Frasco de 30 g

Obs.: Em infecções das plantas dos pés manter o tratamento por 4 semanas.

b) Creme vaginal

Não é necessário interromper as aplicações durante o período menstrual. Utilizar um aplicador preenchido com o conteúdo da bisnaga, aproximadamente 5g, inserido profundamente no canal vaginal.

DOSE → Aplicar uma vez ao dia ao deitar por 14 dias consecutivos.

c) Gel oral

A aplicação pode ser feita com o uma haste flexível com algodão nas pontas ou com gaze envolvendo o dedo indicador, espalhando a quantidade de gel necessária para cobrir toda a área afetada.

Lactentes:

DOSE → Aplicar 1,25 ml quatro vezes ao dia após as refeições, sendo que o gel deve ser mantido na boca o maior tempo possível.

Crianças e Adultos:

DOSE → Aplicar 2,5 ml quatro vezes ao dia após as refeições, sendo que o gel deve ser mantido na boca o maior tempo possível. O tratamento deverá ser mantido por pelo menos uma semana após o desapareci-

mento dos sintomas.

REAÇÕES ADVERSAS

- Loção, Creme e Pó:
- Irritação ou queimação no local da aplicação;
- Erupção cutânea por reação alérgica.

Creme vaginal:

- Prurido;
- Ardência e irritação genital;
- Cefaleia.

Gel oral:

- Disgeusia (alteração do paladar);
- Xerostomia (boca seca);
- Desconforto bucal;
- Náuseas e vômito.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Loção, Creme, Pó e Creme vaginal:

- A administração tópica e na mucosa vaginal possui pouca absorção sistêmica, mas pode interagir com fármacos que possuem vias enzimáticas



NITRATO DE MICONAZOL

Loção – 20 mg/g – Frasco com 30 ml

Creme – 20 mg/g – Bisnaga de 28 g

Creme vaginal – 20 mg/g – 14 bisnagas contendo 5 g para 14 aplicadores

Gel oral – 20 mg/g – Bisnaga de 40 g

Pó – 20 mg/g – Frasco de 30 g

Gel Oral:

Já a administração bucofaríngea produz níveis séricos consideráveis, sendo o miconazol um forte inibidor das enzimas hepáticas CYP3A4 e CYP2C9, aumentando e prolongando o efeito dos seguintes fármacos:

- Anticoagulantes cumarínicos: Varfarina;
- Inibidores de HMG-CoA redutase como sinvastatina e lovastatina;
- Hipoglicemiantes orais, como sulfonilureias;
- Bloqueadores de canal de cálcio, como di-hidropiridinas e verapamil;
- Triazolam, midazolam e fenitoína.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade ao fármaco.

Durante as primeiras semanas da gravidez e durante a amamentação.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Miconazol de 2019. Acesso em 18 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:



NISTATINA CANDITRAT[®]

Suspensão oral – 100.000 UI/mL – Frasco com 50 ml

INDICAÇÕES

- Tratamento da candidíase da cavidade bucal e do trato digestivo superior;
- Esofagite por *Candida albicans* - encontrada em pacientes imunodeprimidos.

CLASSE

Antibiótico antifúngico.

MECANISMO DE AÇÃO

A nistatina é um antibiótico antifúngico poliênico de uso tópico, que age na ligação dos esteroides da membrana celular dos fungos. Com a alteração na permeabilidade da membrana celular, ocorre o extravasamento do conteúdo citoplasmático e a morte do patógeno.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → não significativa no trato gastrointestinal;
2. Excreção → fecal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Lactentes:

DOSE → 1 ou 2 mL quatro vezes ao dia, devendo-se colocar uma parte da dose em cada lado da boca.

Adultos e crianças:

DOSE → 1 a 6 mL quatro vezes ao dia, fazendo bochechada e mantendo por alguns minutos até a substância ser totalmente deglutida.

REAÇÕES ADVERSAS

- Diarreia;
- Náuseas;
- Vômitos.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- A nistatina não é absorvida através da pele e mucosas e por isso não interage com medicamentos e/ou substâncias.



NISTATINA
CANDITRAT[®]

Suspensão oral – 100.000 UI/mL – Frasco com 50 ml

CONTRAINDICAÇÕES

Em caso de hipersensibilidade ao fármaco.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Nistatina de 2016. Acesso em 09 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



CAPÍTULO 4

ANTIPROTOZOÁRIOS

CÉSAR AUGUSTO MEDEIROS PAIVA RODRIGUES
KLEBER HENRIQUE DA SILVA BEZERRA
MATHEUS LEITE DE OLIVEIRA
ELLEN ÁGATTA MARINHO SILVA
JÚLIO ARAÚJO RENDEIRO
EDUARDA BATISTA LOGRADO
AYNIERE SOUSA SOARES
ANDERSON BENTES DE LIMA
PRISCILA XAVIER DE ARAÚJO



DIFOSFATO DE CLOROQUINA CLOROQUINA QUINACRIS® Comprimido – 150 e 250 mg

INDICAÇÕES

- Profilaxia e tratamento da malária causado pelos plasmódios *vivax*, *ovale* e *malariae*;
- Tratamento de amebíase hepática;
- Artrite reumatoide;
- Lúpus eritematoso sistêmico;
- Lúpus discoide;
- Sarcoidose;
- Doenças de fotossensibilidade, porfiria cutânea tardia e erupções polimórficas graves.

CLASSE

Antimalárico.

MECANISMO DE AÇÃO

A cloroquina mata os esquizontes com muita facilidade. Também é ativa contra os gametócitos de *P. vivax*, *P. ovale* e *P. malariae* e, em menor quantidade, contra os de *P. falciparum*. Pelo que se conhece, ela age ao se acumular no vacúolo alimentar do parasito. Isso impede a conversão da heme em hemozoína, causando toxicidade na célula por aumento na concentração de heme.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → bem absorvido, forma rápida, no trato gastrointestinal;
2. Distribuição → lenta;
3. Concentração plasmática máxima → 1 a 2 horas;
4. Ligação a proteínas plasmáticas → moderada (60%);
5. Biotransformação → hepática, citocromo P450;
6. Excreção → renal;
7. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 30 a 60 dias.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

I) Tratamento das infecções pelo *P. vivax* ou *P. ovale*

Cloroquina em 3 dias, associado a primaquina em 7 dias.

Crianças:

4 – 8 anos (15-24 kg)

DOSE → 150 mg/dia durante os três dias.

9-11 anos (25-34 kg)

DOSE → 2 comprimidos de 150 mg durante os três dias.

12-14 anos (35-49 kg)

DOSE → 3 comprimidos de 150 mg no pri-



DIFOSFATO DE CLOROQUINA CLOROQUINA QUINACRIS® Comprimido – 150 e 250 mg

meio dia, 2 comprimidos no segundo e terceiro dia.

Adultos adolescentes:

Entre 50 e 69 kg

DOSE → 4 comprimidos de 150 mg no primeiro dia, 3 comprimidos no segundo e terceiro dia.

Entre 70 e 79 kg

DOSE → 4 comprimidos de 150 mg no primeiro dia, 3 comprimidos no segundo e terceiro dia.

II) Amebíase hepática

Adultos:

DOSE → 600 mg no primeiro e segundo dia, seguidos de 300 mg/dia por duas a três semanas.

Crianças:

DOSE → 10 mg/kg durante 10 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- Prurido, coloração azul-escura da boca, pele e unhas, branqueamento dos cabelos, queda de cabelos e exantema cutâneo.
- Vômitos, náuseas, dor abdominal e estomatite;
- Cefaleia;
- Transtorno de acomodação visual, visão

turva e opacidade da córnea;

- Anorexia, fadiga;
- Alterações eletrocardiográficas – alargamento do intervalo QRS e anormalidade da onda T;
- Uso prolongado pode causar ototoxicidade, miopatias e neuropatias periféricas;
- Em doses altas absorvidas de maneira rápida podem causar hipotensão grave e parada cardiorrespiratória.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Quando associada com uma série de medicamentos, a cloroquina aumenta as chances de convulsão. Entre eles os anticonvulsivantes e a mefloquina;

Aumenta o risco de toxicidade da ciclosporina e digoxina.

CONTRAINDICAÇÕES

Em casos de hipersensibilidade.

Quando o paciente apresentar previamente alterações na retina.

Em regiões onde há resistência à cloroquina no tratamento da malária e para tratar em casos de plasmódio *falciparum*.

Não é recomendada a utilização em pacientes com epilepsia e miastenia gravis, nem em pacientes com psoríase e porfiria cutânea tardia.



DIFOSFATO DE CLOROQUINA
CLOROQUINA
QUINACRIS®
Comprimido – 150 e 250 mg

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Farmanguinhos cloroquina de 2021. Acesso em 09 de março de 2021.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



CLORIDRATO MEFLOQUINA MEFLOQUINA

Comprimido – 250 mg

INDICAÇÕES

- Tratamento da malária resistente à cloquina;
- Pode ser associada com artesunato.

CLASSE

Antimalárico. Aminoquinolinas.

MECANISMO DE AÇÃO

Age contra os esquizontes durante seu percurso na corrente sanguínea e é pouco ativa contra as fases hepáticas do parasito. O seu mecanismo de ação é desconhecido, no entanto, um mecanismo secundário proposto na literatura é o que a mefloquina se associa com a hemozoína do eritrócito, sendo uma sugestão de proximidade com o mecanismo de ação da cloroquina.

FARMACOCINÉTICA

Absorção → boa, favorecida pela presença de alimentos;

Concentração plasmática máxima → 17 horas;

Ligação a proteínas plasmáticas → 98%

Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 20 dias;

Excreção → fecal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

I) Profilaxia para malária

DOSE → 250 mg por semana

Iniciar pelo menos 1 semana (preferencialmente 2 a 3 semanas) antes da viagem e manter até 4 semanas após o retorno.

REAÇÕES ADVERSAS

- Episódios neuropsiquiátricos;
- Náuseas, vômitos, perda de equilíbrio e tonturas.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- A mefloquina aumenta o risco de convulsões em pacientes que já fazem tratamento usando o valproato de sódio;
- É recomendado que se tenha cautela ao utilizar a mefloquina junto com fármacos que alteram a condução cardíaca.



CLORIDRATO MEFLOQUINA MEFLOQUINA

Comprimido – 250 mg

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade, ao fármaco.

Não utilizar em crianças com peso inferior a 5 kg ou em lactentes menores de 6 meses.

É contraindicada para os pacientes com história de convulsões, distúrbios neuropsiquiátricos graves e em pessoas com depressão ativa.

Não deve ser administrado a pacientes com histórico de terapia recente com halofantrina.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de LFM-MEFLOQUINA de 2015. Acesso em 09 de março de 2021.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



DIFOSFATO DE PRIMAQUINA PRIMAQUINA

Comprimido – 5 e 15 mg

INDICAÇÕES

- Tratamento de malária por *Plasmodium vivax* e *Plasmodium ovale*;
- Bloqueia a transmissão do *Plasmodium falciparum*;
- Pode ser empregada no tratamento de pneumonia por *Pneumocystis carinii*.

CLASSE

Antimalárico.

MECANISMO DE AÇÃO

A primaquina age nos estágios hepáticos primários do *Plasmodium sp.* Essa efetividade pode se dar pela formação de intermediários de oxirredução, formando espécies reativas de oxigênio e alterando o fluxo de elétrons da mitocôndria do parasita.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → Trato digestivo;
2. Biodisponibilidade → 96%;
3. Concentração plasmática → 3 horas;
4. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → 6 horas;
5. Metabolismo → hepático;
6. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral. Após as refeições.

I) Tratamento da malária não complicada em adultos e crianças a partir dos 6 meses

DOSE → 0,25 mg/kg por 14 dias ou 0,5 mg/kg/dia.

II) Tratamento de pneumocistose

DOSE → 15 - 30 mg, por via oral, uma vez ao dia, combinada a clindamicina, durante 21 dias;

REAÇÕES ADVERSAS

- Desconforto abdominal;
- Irritação gástrica;
- Fadiga;
- Febre;
- Anemia hemolítica;
- Metahemoglobinemia;
- Cefaleia;
- Prurido;
- Náuseas e vômitos.



DIFOSFATO DE PRIMAQUINA PRIMAQUINA

Comprimido – 5 e 15 mg

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Quinacrine aumenta o potencial de toxicidade da primaquina.

CONTRAINDICAÇÕES

Em casos de hipersensibilidade a primaquina.

Este medicamento é contraindicado em portadores de deficiência de glicose-6- fosfato-desidrogenase (G6PD).

Durante a gravidez, pois pode causar destruição dos glóbulos vermelhos do sangue, doença do sangue e risco de destruição dos glóbulos vermelhos do sangue em feto deficiente de glicose-6-fosfato-desidrogenase (G6PD), por isso mulheres grávidas devem fazer uso de cloroquina para tratamento de malária.

Não pode ser utilizado em puérperas até um mês de lactação e crianças menores de 6 meses.

Este medicamento é contraindicado em condições que predisõem a agranulocitose

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Farmanguinhos primaquina de 2021. Acesso em 09 de março de 2021.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

ou a granulocitopenia, portadores de artrite reumatoide ativa ou lúpus eritematoso sistêmico.

É contraindicado para administração por via parenteral, pois pode baixar a pressão arterial para valores abaixo do normal.

Anotações:



ISETIONATO DE PENTAMIDINA PENTAMINA PENTACARINAT® Pó para solução injetável – 300 mg

INDICAÇÕES

- É utilizado nos estágios iniciais da infecção causada por *T.brucei* gambiense;
- Em estágios tardios, é ineficaz, logo percebe-se que a eficácia só é encontrada nos estágios iniciais da doença;
- O medicamento abordado é um fármaco alternativo para o tratamento da leishmaniose cutânea, em caso da doença visceral;
- Utilização de forma profilática, contra a pneumonia causada por *Pneumocystis*;
- Indicação para o seu uso é quando o indivíduo é contra-indicado a usar o trimetoprima-sulfametoxazol, e os candidatos alternativos, atovaquona ou a combinação de clindamicina e primaquina não estão disponíveis.

CLASSE

Antiprotozoário.

MECANISMO DE AÇÃO

O fármaco parece agir de forma específica, ou seja, variando de parasita para parasita. Nome microrganismos *T.brucei*, o fármaco concentra-se em um sistema de captação de alta afinidade, o qual atinge concentração milimolares nas células sendo isso essencial para a sua eficácia. Além disso, o

transportador mais bem caracterizado é o de purinas P2.

FARMACOCINÉTICA

Concentração plasmática máxima → 1 a 14 dias;

Distribuição → rápida;

Ligação a proteínas plasmáticas → 69%;

Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 9 horas;

Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via intravenoso (infusão lenta), intramuscular ou inalação.

I) Leishmaniose visceral

DOSE → via intramusculares de 4 mg/kg em dias alternados.

II) Infecção de *Pneumocystis*

DOSE → 4 mg/kg/dia durante 14 dias por perfusão intravenosa lenta

III) Profilaxia

DOSE → 300 mg em solução de 5-10% nebulizador por 30 a 45 minutos uma vez ao mês.



ISETIONATO DE PENTAMIDINA PENTAMINA PENTACARINAT® Pó para solução injetável – 300 mg

REAÇÕES ADVERSAS

- Hipotensão, taquicardia e cefaleia;
- Hipoglicemia;
- Pancreatite;
- Hiperglicemia;
- Diabetes
- Nefrotóxico;
- Exantemas cutâneos; tromboflebite, anemia;
- Neutropenia, elevação das enzimas hepática;
- Abscessos estéreis.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Efeito aditivo de nefrotoxicidade quando administrados juntamente com outros fármacos nefrotóxicos.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Pentamidina. Acesso em 09 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade e em grávidas ou em puérperas analisar risco benefício.

Anotações:



BENZNIDAZOL

Comprimido – 12,5 e 100 mg

INDICAÇÕES

- Tratamento da tripanossomíase americana causada por *T. cruzi*;
- Fase aguda, o fármaco em questão reduz a carga parasitológica, na doença de chagas agudo e em 80% dos casos apresenta a cura parasitológica;
- Fase crônica, a cura parasitologia ocorre em até 50% dos pacientes, ou seja, o fármaco é mais eficaz na fase aguda.

CLASSE

Tripanocida.

MECANISMO DE AÇÃO

É um medicamento tripanocidas, nas formas amastigotas e tripomastigota. O medicamento é ativado por uma nitroreductase mitocondrial dependente de NADH, o qual promove a geração intracelular de radicais nitro aniônicos, os quais as pesquisas mostram como sendo o responsável pelo efeito tripanocida. A transferência de elétrons gera uma cadeia de radicais aniônicos (peróxido de hidrogênio e radical hidroxila), o qual resulta em lesões celulares, inativação enzimática e lesão de DNA.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → via digestiva rápida;
2. Concentração plasmática máxima → 2 a 4 horas;
3. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 12 horas;
4. Excreção → renal e fecal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos (acima de 13 anos):

DOSE → 5-7 mg/kg/dia, fracionada em duas doses por 60 dias.

Crianças (até 12 anos):

DOSE → 10 mg/kg/dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Reações de hipersensibilidade;
- Náuseas, vômitos;
- Mialgias e fraqueza;
- Neuropatias periféricas;
- Distúrbios gastrointestinais;
- Dores de cabeça;
- Distúrbios psiquiátricos;
- Parestesias, polineurites e excitabilidade



BENZNIDAZOL

Comprimido – 12,5 e 100 mg

do sistema nervoso central;

- Diminuição do número de espermatozoides;
- Leucopenia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Evitar ingestão com bebidas alcoólicas;
- Uso juntamente com aspirina pode aumentar o risco de sangramento;
- Efeito anticoagulante, pode ser potencializado quando utilizado juntamente com benznidazol.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade ao fármaco.

Contraindicação relativa: insuficiência hepática, renal ou hematológica, ou doenças neurológicas.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Benznidazol. Acesso em 09 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:



ANTIMONIATO DE MEGLUMINA

GLUCANTIME®

Solução injetável – 300 mg/mL

INDICAÇÕES

- Tratamento de Leishmaniose tegumentar americana ou cutâneo-mucosa;
- Tratamento da Leishmaniose visceral ou calazar.

CLASSE

Antiprotozoário. Antileishmaníase.

MECANISMO DE AÇÃO

Várias enzimas *Leishmania* spp. são inibidas seletivamente, além disso tem a tendência de inibir a fosfofrutoquinase, dessa forma, inibindo a formação de adenosina trifosfato.

FARMACOCINÉTICA

1. Excreção → em 24 horas, é eliminada em fases;
2. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → 2 horas e 76 horas.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via parenteral.

A ampola de 5ml corresponde a 405 mg de antimônio pentavalente. Para calcular a dosagem, deve-se considerar mg/Kg/dia/Sb+5, recomenda-se não ultrapassar 3

ampolas.

I) Leishmaniose Visceral

DOSE → 20mg/Kg/dia, durante 20 dias seguidos.

Obs.: Caso ocorra recorrência pode-se repetir a mesma dosagem.

II) Leishmaniose Tegumentar

DOSE → 20 mg de Sb+5/Kg/dia durante 30 dias seguidos, de preferência em ambiente hospitalar.

Na forma difusa, prefere-se usar a dose de 20mg de Sb+5/Kg/dia durante 20 dias.

Obs.: Caso não seja cicatrizado em 3 meses, deve-se repetir a dosagem, e caso não haja resposta deve-se utilizar uma droga de segunda escolha.

III) Lesões nas mucosas

DOSE → 20 mg de Sb+5/Kg/dia durante 30 dias seguidos, de preferência em ambiente hospitalar.

Obs.: Caso não haja cicatrização completa no período de 3 meses do término do tratamento, o esquema deve-se ser repetido, apenas uma vez.



ANTIMONIATO DE MEGLUMINA

GLUCANTIME®

Solução injetável – 300 mg/mL

REAÇÕES ADVERSAS

- Dores articulares;
- Dores musculares;
- Dor abdominal;
- Cefaleia;
- Mal-estar geral;
- Dispneia;
- Erupção cutânea;
- Edema facial;
- Alterações nos testes das funções hepática, renal e pancreática;
- Alterações no eletrocardiograma - inversão da onda T e o prolongamento do intervalo QT antecedem o início de uma arritmia grave.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Fármacos que aumentam o intervalo QT como quinidina, procainamida, disopiramida, sotalol, amiodarona e entre outros.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Antimoniato de Meglumina de 2014. Acesso em 25 de julho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade e em pacientes com insuficiência renal, cardíaca ou hepática.

Anotações:



QUININA

QUININA LABESFAL®
Comprimido – 300 mg

INDICAÇÕES

- Tratamento de malária causada por *P. falciparum* multirresistente ou resistente a cloroquina.

CLASSE

Antiparasitário. Antimalárico.

MECANISMO DE AÇÃO

Age ao se acumular no vacúolo alimentar do parasito. Isso impede a conversão da heme em hemozoína, causando toxicidade na célula por aumento na concentração de heme.

Adicional de intercalar-se no DNA, impedindo a sua replicação.

FARMACOCINÉTICA

1. Ligação a proteínas plasmáticas → 70%;
2. Distribuição → ampla;
3. Metabolização → hepática;
4. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 8 a 21 horas;
5. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral e intravenosa.

Adultos:

DOSE → 600 mg a cada 8 horas por 3, 7 ou 10 dias por via oral.

20 mg/kg por injeção intravenosa, seguidos de 10 mg/kg de infusão intravenosa durante 4 horas, de 8 em 8 horas.

Crianças:

DOSE → 10 mg/kg a cada 8 horas por 3, 7 ou 10 dias por via oral.

20 mg/kg por injeção intravenosa, seguidos de 10 mg/kg, em infusão intravenosa durante 4 horas, de 12 em 12 horas.

REAÇÕES ADVERSAS

- Chichonismo (zumbido, surdez, cefaleia, náuseas, vômitos, distúrbios visuais);
- Prolongamento do intervalo QT;
- Coagulação intravascular disseminada;
- Trombocitopenia;
- Hepatotoxicidade;
- Nefrite intersticial;
- Síndrome hemolítico-urêmica;
- Exantema;
- Hipoglicemia;



QUININA

QUININA LABESFAL[®]
Comprimido – 300 mg

- Distúrbio gastrointestinal.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Ranolazina, aurotioglicose e astemizol: aumenta o efeito da quinina;
- Rifapentina: diminui o efeito da quinina;
- Ciclosporina: diminui o efeito da quinidina;
- Digoxina e mefloquina: aumenta o efeito da quinidina.

CONTRAINDICAÇÕES

Em casos de hipersensibilidade.

Caso tenha distúrbios visuais, rash, perda de audição e zumbido, o fármaco deve ser descontinuado.

Em pacientes com deficiência da enzima glucose-6-fosfato desidrogenase a utilização não é recomendada.

Em pacientes que apresentaram efeitos hematológicos adversos em administrações prévias de quinina pode ocorrer purpura

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Quinina de 2016. Acesso em 09 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

trombocitopenica durante a terapia.

Contraindicada também em pacientes com zumbido ou nevrite óptica ou com história de febre dos pântanos.

Anotações:



PIRIMETAMINA

DARAPRIM[®]
Comprimido – 25 mg

INDICAÇÕES

- Profilaxia da malária;
- Supressor contra infecções por *Plasmodium vivax*;
- Tratamento da malária;
- Toxoplasmose.

CLASSE

Antimalárico. Antiprotozoário. Antitoxoplasmótico.

MECANISMO DE AÇÃO

Reduz a produção de ácidos nucleicos ao inibir a di-hidrofolato redutase, impedindo a conversão de di-hidrofolato para tetra-hidrofolato (ácido fólico).

FARMACOCINÉTICA

1. Ligação a proteínas plasmáticas → 84%.
2. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → longo, 96 horas.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

I) Profilaxia da malária

Adultos e crianças (acima de 10 anos):

DOSE → 1 comprimido por semana.

Crianças (menores de 10 anos):

DOSE → $\frac{1}{2}$ comprimido a cada semana (5 a 10 anos).

$\frac{1}{4}$ comprimido a cada semana (menores de 5 anos).

II) Malária

Deve ser administrada concomitantemente com sulfonamidas (p. ex. sulfadiazina).

Jovens (acima de 14 anos), adultos e idosos:

DOSE → 2 ou 3 comprimidos de pirimetamina com 1.000 a 1.500 mg de sulfadiazina em dose única.

Crianças (menores de 14 anos):

DOSE → 2 comprimidos de pirimetamina e 1.000 mg de sulfadiazina em dose única (9 a 14 anos);

1 comprimido de pirimetamina e 500 mg



PIRIMETAMINA

DARAPRIM[®]
Comprimido – 25 mg

de sulfadiazina em dose única (4 a 8 anos).
½ comprimido de pirimetamina e 250 mg de sulfadiazina em dose única (menos de 4 anos).

REAÇÕES ADVERSAS

- Rash cutâneo;
- Náuseas, cólicas, vômitos e diarreia;
- Distúrbios do ritmo cardíaco;
- Ulceração bucal;
- Pigmentação da pele;
- Depressão.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Pode deprimir ainda mais o metabolismo do folato em pacientes que estejam recebendo tratamento de inibidores de folato;
- Anemia megaloblástica quando associado a trimetoprima/sulfonamida;
- Hepatotoxicidade quando administrados

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Pirimetamina de 2014. Acesso em 14 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

juntamente com lorazepam;

- Exacerbações dos efeitos mielossuppressores de agentes citostáticos;
- Convulsões após administração concomitante com metotrexato, daunorubicina, arabinosídeo, citosina e indivíduos com leucemia mieloide aguda.

CONTRAINDICAÇÕES

Histórico de hipersensibilidade.

Anotações:



METRONIDAZOL

Comprimido – 250 e 400 mg
Gel vaginal – 100 mg/g

INDICAÇÕES

- Giardíase;
- Amebíase;
- Tricomoníase;
- Vaginites por *Gardnerella vaginalis*;
- Infecções causadas por bactérias anaeróbicas.

CLASSE

Imidazóis. Amebicidas. Tricomonicidas. Antianaeróbios.

MECANISMO DE AÇÃO

O produto da redução do metronidazol tem propriedades citotóxicas (de vida curta), interage com o DNA, inibindo a síntese do ácido nucléico, causando a morte da célula.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção máxima → 1 a 2 horas;
2. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 8 a 10 horas;
3. Ligação a proteínas plasmáticas → baixa, 20%;
4. Biotransformação → hepática;
5. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral e tópica.

I) Giardíase

Crianças:

DOSE → 5 mL, 2 vezes ao dia, por 5 dias (1 a 5 anos);

5 mL, 3 vezes ao dia, por 5 dias (5 a 10 anos);

250 mg, 3 vezes ao dia durante 5 dias.

II) Amebíase

Crianças:

DOSE → 20 mg (0,5 mL)/kg, 4 vezes ao dia, por 5 a 7 dias;

20 mg (0,5mL)/kg, 4 vezes ao dia, por 7 a 10 dias;

500 mg, 4 vezes ao dia durante 5 a 7 dias (intestinal);

500 mg, 4 vezes ao dia por 7 a 10 dias (hepática).

III) Tricomoníase

DOSE → Administração preferencialmente a noite, 1 vez por dia e durante 10 a 20 dias. (Apresentação em gel).

2 g em dose única ou 250 mg, uma vez ao dia durante 10 dias.



METRONIDAZOL

Comprimido – 250 e 400 mg
Gel vaginal – 100 mg/g

Obs.: tratar o parceiro sexual com dose única e de uso tópico concomitante da medicação.

IV) Vaginite e uretrite por *Gardnerella vaginalis*

DOSE → 2 g, em dose única no primeiro e terceiro dia de tratamento;

500 mg, duas vezes ao dia por 7 dias.

Obs.: Parceiro sexual deve ser tratado com dose única de 2 g.

REAÇÕES ADVERSAS

- Febre, rash cutâneo, prurido, rubor, urticária, erupções pustulosas;
- Síndrome de Stevens-Johnson;
- Quadros graves de necrólise epidérmica tóxica;
- Aumento de enzimas do fígado, lesão hepática, hepatite, levando a quadros de icterícia;
- Agranulocitose, neutropenia, trombocitopenia;
- Diplopia, miopia, visão borrada, diminuição da acuidade e qualidade visual;
- Confusão mental, alucinações, humor depressivo;
- Angioedema, choque anafilático;
- Dor epigástrica, náusea vômito, diar-

reia, mucosite oral, gosto metálico no paladar, anorexia;

- Pancreatite reversível, mudança da coloração da língua;
- Sintomas neurológicos como neuropatia sensorial periférica, tontura, dor de cabeça, convulsão, síndrome cerebelar subaguda, efeitos sobre a marcha, equilíbrio e tremores;
- Meningite asséptica.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Álcool (ingerir no mínimo após 24 horas da última medicação);
- Dissulfiram, anticoagulantes orais (metronidazol aumenta o efeito desses);
- Lítio, Ciclosporina, Fenobarbital, 5-fluorouracil, Bulssufano.

CONTRAINDICAÇÕES

Com histórico de hipersensibilidade ao metronidazol.



METRONIDAZOL

Comprimido – 250 e 400 mg
Gel vaginal – 100 mg/g

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Metronidazol de 2013. Acesso em 09 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



ARTEMETER + LUMEFANTRINA COARTEM[®]

Comprimido – 20 + 120 mg

INDICAÇÕES

- Pessoas com mais de 5 kg com infecções por *Plasmodium falciparum*;
- Em casos de emergência, porém que não afetem cérebro, rim ou pulmões de crianças.

CLASSE

Antimaláricos.

MECANISMO DE AÇÃO

Derivado da artemisina, possui atividade provocando a alquilação e oxidação de macromoléculas do protozoário, além de promover a clivagem da ponte peróxido do fármaco pelo ferro do heme-reduzido também dentro do protozoário.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida;
2. Concentração plasmática → 2 horas;
3. Ligação a proteínas plasmáticas → 95%;
4. Metabolismo → primeira passagem, hepático;
5. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → 2 horas (arteméter) e 26 dias (lumefantrina);
6. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos e crianças (> 35 kg):

DOSE → 6 doses, cada uma com 4 comprimidos de 160 mg da associação, nos seguintes momentos:

1. Diagnóstico;
2. 8 horas após a primeira;
3. 24 horas após a primeira;
4. 36 horas após a primeira;
5. 48 horas após a primeira;
6. 60 horas após a primeira.

Crianças (entre 5 e 15 kg):

DOSE → 6 doses, cada uma com 1 comprimido de 160 mg da associação, nos seguintes momentos:

1. Diagnóstico;
2. 8 horas após a primeira;
3. 24 horas após a primeira;
4. 36 horas após a primeira;
5. 48 horas após a primeira;
6. 60 horas após a primeira.

Crianças (entre 15 e 25 kg):

DOSE → 6 doses, cada uma com 2 comprimidos de 160 mg da associação, nos se-



ARTEMETER + LUMEFANTRINA COARTEM[®]

Comprimido – 20 + 120 mg

guintes momentos:

1. Diagnóstico;
2. 8 horas após a primeira;
3. 24 horas após a primeira;
4. 36 horas após a primeira;
5. 48 horas após a primeira;
6. 60 horas após a primeira.

Crianças (entre 25 e 35 kg):

DOSE → 6 doses, cada uma com 3 comprimidos de 160 mg da associação, nos seguintes momentos:

1. Diagnóstico;
2. 8 horas após a primeira;
3. 24 horas após a primeira;
4. 36 horas após a primeira;
5. 48 horas após a primeira;
6. 60 horas após a primeira.

REAÇÕES ADVERSAS

- Perda de apetite;
- Distúrbios do sono, cefaleia, tontura;
- Taquicardia;
- Tosse;
- Dor de estômago, náusea, vômito, diarreia;
- Dores articulares e músculos, astenia, contrações musculares involuntárias;

- Prurido ou erupção na pele.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Anticoncepcionais;
- Outros antimaláricos;
- Antirretrovirais ou inibidores da protease;
- Erva de São João;
- Alguns medicamentos antiepiléticos;
- Cisaprida;
- Alguns anti-histamínicos não sedativos;
- Antidepressivos;
- Antiarrítmicos;
- Antifúngicos triazólicos;
- Rinfampicina e antibióticos das classes macrolídeos, fluoroquinolonas e amida-zóis.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade conhecida.

Pacientes com malária grave.

Primeiro trimestre de gestação.

Pacientes com histórico familiar de prolongamento congênito do intervalo QTc, ou morte súbita, ou com qualquer outra condição clínica conhecida por prolongar o intervalo QTc e pacientes utilizando medicamentos conhecidos por prolongar o inter-



ARTEMETER + LUMEFANTRINA COARTEM®

Comprimido – 20 + 120 mg

valo QTc.

Pacientes com conhecido distúrbio do balanço eletrolítico.

Pacientes utilizando medicamentos metabolizados pela enzima do citocromo CYP2D6 e utilizando medicamentos que são indutores fortes da CYP3A4.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Artemeter + Lumefantrina de 2013. Acesso em 19 de junho de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



ARTESUNATO + CLORIDRATO MEFLOQUINA

Comprimido – 25 + 55 mg / 100 + 220 mg

INDICAÇÕES

- Tratamento de malária aguda causada pelo *Plasmodium falciparum* ou quando este está associado ao *Plasmodium vivax*;
- Em pacientes com mais de 6 meses de idade e/ou mais de 5 kg.

CLASSE

Antimalárico. Antiprotozoário.

MECANISMO DE AÇÃO

A absorção do medicamento é seletiva às hemácias infectadas, agindo em todos os estágios assexuados e formas jovens do *Plasmodium falciparum*. Não está confirmado mas presume-se que sua ação decorre da inibição da Ca(2+)-ATPase(SERCA)PfA-TP6, no retículo endoplasmático do parasita e sua associação com a Mefloquina decorre da alta afinidade eritrocitária dessa, da sua atividade esquizocítica, bem como o aumento da acurácia em parasitas resistentes a cloroquina.

FARMACOCINÉTICA

1. Metabolismo → artesunato é metabolizado por esterases plasmáticas e intestinais no metabólito ativo, diidroar-

temisinina (DHA), absorvidos no trato gastrointestinal;

2. Ligação a proteína plasmática → albumina, 43% para DHA e 59% para artesunato e a mefloquina de 98%;
3. Metabolismo → mefloquina, metabolizada no fígado em carboxi-mefloquina;
4. Tempo $\frac{1}{2}$ vida → 15 a 33 dias;
5. Excreção → DHA é excretada principalmente pela urina e a mefloquina pelas fezes.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Crianças (5 a 8 kg ou 6 a 11 meses de idade):

DOSE → 1 comprimido de 75 mg por dia durante 3 dias.

Crianças (9 a 17 kg ou 1 a 5 anos):

DOSE → 2 comprimidos de 75 mg por dia durante 3 dias.

Crianças (18 a 29 kg ou 6 a 11 anos):

DOSE → 1 comprimido de 300 mg por dia durante 3 dias.



ARTESUNATO + CLORIDRATO MEFLOQUINA

Comprimido – 25 + 55 mg / 100 + 220 mg

Adultos e crianças (mais de 30 kg ou igual ou maior que 12 anos):

DOSE → 2 comprimidos de 300 mg por dia durante 3 dias.

Adultos (mais de 70 kg):

DOSE → 3 comprimidos de 300 mg por dia durante 3 dias.

REAÇÕES ADVERSAS

- Vômito, náusea, dor abdominal, diarreia, anorexia;
- Tontura, distúrbios do sono, cefaleia;
- Fadiga;
- Arritmia;
- Mialgia;
- Artralgia;
- Diminuição da audição;
- Recrudescência da malária;
- Hiperbilirrubinemia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Halofantrina (prolongamento acentuado do intervalo QT);
- Cloroquina e quinina, outros antimaláricos;
- Medicamentos que alterem o intervalo QTc;
- Também outros antimicrobianos, anti-convulsivantes de um modo geral (evitar ao máximo esse antimalárico em pacientes epiléticos) e vacina da febre tifóide.

CONTRAINDICAÇÕES

Não é recomendado para tratamento em crianças com menos de 6 meses de idade e/ou pesando menos que 5kg.

Não deve ser administrado a pacientes com histórico de terapia recente com halofantrina, histórico de doença psiquiátrica pois pode precipitar ou exacerbar esses distúrbios, epilepsia pois aumenta o risco de convulsões e hipersensibilidade conhecida.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Artesunato + Mefloquina de 2017. Acesso em 29 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



CAPÍTULO 5

ANTIRRETROVIRAIS

GABRIELA DA SILVA LEANDRO
HELLEN GONÇALVEZ DA SILVA
KAROLAINE GALVÃO PONTES
KESSIA CASTRO DE SOUSA
ELLEN ÁGATTA MARINHO SILVA
JÚLIO DE ARAÚJO RENDEIRO
EDUARDA BATISTA LOGRADO
AYNIERE SOUSA SOARES
PRISCILA XAVIER DE ARAÚJO



SULFATO DE ABACAVIR ABACAVIR ZIAGENAVIR®

Solução oral – 20 mg/mL
Comprimido – 300 mg

INDICAÇÕES

- Na terapêutica antirretroviral combinada, para tratamento da infecção pelo vírus da imunodeficiência humana (HIV) em adultos e crianças.

CLASSE

Inibidor Nucleosídico da Transcriptase Reversa (INTR).

MECANISMO DE AÇÃO

É um inibidor nucleosídico da transcriptase reversa (é um potente agente antiviral seletivo para os vírus HIV-1 e HIV-2) análogo da guanossina, e irá, de início, sofrer fosforilação levando a sua forma ativa carbovir 5-triforfato (TP), no meio intracelular. Esse se ligará a transcriptase reversa do HIV, ocasionando, conseqüentemente, a inibição do alongamento do DNA pró-viral, interrompendo o ciclo de replicação viral.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rapidamente absorvida e pode ser administrado com alimentos;
2. Biodisponibilidade → 83%;
3. Concentração máxima → 1,5 hora com os comprimidos e 1 hora com a solução oral;

4. Distribuição → boa penetração nos tecidos;
5. Ligação a proteínas plasmáticas → 50%;
6. Metabolismo → hepático;
7. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 1,5 hora;
8. Eliminação → renal e fecal (20%).

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos e crianças que pesam no mínimo 30 kg	300 mg (um comprimido) duas vezes ao dia ou de 600 mg (dois comprimidos) uma vez ao dia
Crianças que pesam entre 14 kg e 21 kg	Metade de um comprimido (150 mg) duas vezes ao dia
Crianças com mais de 21 kg e menos de 30 kg	Metade de um comprimido (150 mg) pela manhã e um comprimido inteiro (300 mg) à noite
Crianças com menos de 14 kg	Devem utilizar solução oral, e a dosagem recomendada é de 8 mg/kg duas vezes ao dia



SULFATO DE ABACAVIR ABACAVIR ZIAGENAVIR ®

Solução oral – 20 mg/mL
Comprimido – 300 mg

REAÇÕES ADVERSAS

- Febre;
- Náusea;
- Vômito;
- Anorexia;
- Dor de cabeça;
- Letargia;
- Erupções cutâneas.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Fármaco tem baixo potencial de interação medicamentosa com antirretrovirais inibidores da protease e de outras substâncias metabolizadas pelas principais enzimas do sistema P450;
- Quando utilizado juntamente com etanol esse fármaco não altera a ação do etanol, porém, seu efeito pode ser alterado, o que pode resultar no aumento de aproximadamente 41% da AUC do abacavir.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Abacavir de 2014. Acesso em 23 de abril de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

Pacientes com hipersensibilidade conhecida ao abacavir.

Pacientes com insuficiência hepática grave ou moderada.

Anotações:



RITONAVIR

NORVIR®

Comprimido – 100 mg

Solução oral – 80 mg/mL

INDICAÇÕES

- Utilizado em terapias conjuntas com outros antirretrovirais, ao tratamento do Vírus da Imunodeficiência Humana (HIV) quando infectado em adultos e crianças.

CLASSE

Antirretrovirais Inibidores das Proteases (IP).

MECANISMO DE AÇÃO

Inibem a atuação das proteases virais, impedindo, assim, a formação da proteína formada pelo DNA pró-viral que, sem ser clivada pelas proteases, não terá nenhum efeito. Seu mecanismo se dá por meio da competição com a aspartil protease viral que é constituída de monômeros essenciais para o processo de clivagem da proteína. É válido destacar que o local eleito de atuação dessa enzima é entre a fenilalanina e a prolina.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida, quando ingerido com alimento pode ter sua absorção aumentada, porém, sua biodisponibilidade diminui;
2. Ligação a proteínas plasmáticas → 98%;

3. Metabolismo → hepática, CYP3A4 e CYP2D6;

4. Excreção → fecal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 600 mg (6 comprimidos) 2 vezes/dia.

Iniciado com doses de, no mínimo, 300 mg 2 vezes ao dia durante o período de 3 dias, com aumentos de 100 mg (1 comprimido) 2 vezes ao dia, até atingir a dose máxima de 600 mg.

Crianças (maiores de 1 mês):

DOSE → 350 a 400 mg/m² duas vezes ao dia.

Não excedendo a dose de 600 mg (6 comprimidos) duas vezes ao dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Disgeusia;
- Cefaleia;
- Parestesia;
- Diarreia;
- Náusea;



RITONAVIR NORVIR®

Comprimido – 100 mg
Solução oral – 80 mg/mL

- Parestesia oral;
- Vômito;
- Fadiga;
- Urticária;
- Pancreatite.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Quetiapina, sua ação em conjunto com o ritonavir, que causa inibição da enzima CYP3A, pode potencializar os efeitos da quetiapina podendo levar a toxicidade;
- Corticoides, seu aumento sérico pode levar a Síndrome de Cushing e supressão adrenal;
- Inibidores de protease, tem-se o tipranavir que quando coadministrado com ritonavir foi associado com casos clínicos e descompensação hepática, podendo levar ao óbito;
- Deve-se redobrar os cuidados em pacientes com hepatite B crônica ou coinfeção por hepatite C.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Ritonavir de 2019. Acesso em 24 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

É contraindicado em paciente com hipersensibilidade ao ritonavir.

Quando em terapia conjunta com outros inibidores de protease, deve-se ter cautela quanto às contraindicações do outro fármaco.

Combinação com as seguintes substâncias: antagonistas alfa-1-adrenoreceptores (cloridrato de alfuzosina), antianginal (ranolazina), antiarrítmicos (amiodarona, bepridila, dronedarona, flecainida, propafenona, quinidina e encainida), antibióticos (ácido fusídico), antifúngicos (voriconazol), agentes antigotosos (colchicina), anti-histamínicos (astemizol, terfenadina).

Anotações:



TIPRANA VIR

ELODIUS®

Cápsula mole – 250 mg

Solução oral – 100 mg/mL

INDICAÇÕES

- Pacientes que já receberam tratamento, porém, desenvolveram resistência a um dos fármacos inibidores da protease. Podendo ser administrado tanto em adultos como em crianças.

CLASSE

Antirretrovirais Inibidores das Proteases (IP).

MECANISMO DE AÇÃO

Inibem a atuação das proteases virais, impedindo, assim, a formação da proteína formada pelo DNA pró-viral que, sem ser clivada pelas proteases, não terá nenhum efeito.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → limitada, por possuir um uma baixa biodisponibilidade oral seu esse fármaco deve ser administrado juntamente com o ritonavir. Quando ingerido com alimentos pode reduzir os efeitos colaterais gastrointestinais;
2. Concentrações plasmáticas máximas → são atingidas em 1 a 5 horas;
3. Ligação a proteínas plasmáticas → 99,9%;

4. Metabolismo → hepático, pelas enzimas CYP3A4;
5. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 5 a 6 horas;
6. Excreção → fecal (82%).

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 500 mg (duas cápsulas de 250 mg), coadministrados com 200 mg de ritonavir (baixa dose de ritonavir), 2/dia.

Crianças (maiores de 2 anos):

DOSE → 14 mg/kg com 6 mg/kg de ritonavir.

2 vezes ao dia para não exceder a dose máxima de 500 mg de ELODIUS coadministrado com 200 mg de ritonavir duas vezes ao dia

REAÇÕES ADVERSAS

- Perda de apetite;
- Cefaleia;
- Diarreia;
- Náusea;
- Vômito;
- Flatulência (gases);



TIPRANAVIR ELODIUS[®]

Cápsula mole – 250 mg
Solução oral – 100 mg/mL

- Distensão abdominal;
- Dor abdominal;
- Rash (manchas avermelhadas na pele);
- Coceira.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- A coadministração de tipranavir e de baixas doses de ritonavir com agentes metabolizados primariamente pelo CYP3A pode ocorrer alteração das concentrações plasmáticas de tipranavir ou dos outros agentes.

CONTRAINDICAÇÕES

Pacientes com alergia acentuada a qualquer componente da fórmula.

Pacientes com insuficiência hepática moderada ou grave.

Combinação de rifampicina com tipranavir/ritonavir.

Co-administração de tipranavir/ritonavir com fármacos altamente metabolizados no fígado.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Tipranavir de 2013. Acesso em 30 de março de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:

**ZIDOVUDINA****ZIDOVIR®**

Cápsula – 100 mg

Xarope – 10 mg/mL

Solução injetável – 10 mg/mL

INDICAÇÕES

- Tratar, em associação com outros antirretrovirais, pacientes com HIV, pode ser prescrita para adultos, crianças e gestantes;
- Pode ser utilizada, ainda, como agente profilático, associada a outros antirretrovirais, nos casos de pessoas que foram expostas ao HIV.

CLASSE

Antirretroviral, Inibidor Nucleosídico da Transcriptase Reversa (INTR).

MECANISMO DE AÇÃO

A zidovudina é um análogo da timidina com atividade antiviral contra o HIV-1, o HIV-2, o vírus linfotrópico T humano HTLV-1 e outros retrovírus.

Após a difusão para as células o medicamento é fosforilado pela timidinacina celular e assim vai inibir competitivamente a transcriptase reversa em relação ao trifosfato de timidina (TTP).

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida absorção;
2. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 3 a 4 horas;

3. Concentração plasmática máxima → em 1 hora;
4. Distribuição → atravessa a barreira hematoencefálica, atinge o líquido cefalorraquidiano e pode ser detectado no leite materno;
5. Metabolismo → hepático, sofre efeito de primeira passagem;
6. Biodisponibilidade → 64%, podendo ter interferência quando administrada junto com alimentos;
7. Excreção → renal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral e intravenosa.

Adultos e adolescentes:

DOSE → 600 mg/dia em doses divididas, 200 mg 3 vezes ao dia ou 300 mg 2 vezes ao dia.

Crianças:

DOSE → 90 a 180 mg/m² de superfície corporal de 8 em 8 horas ou 135 a 270 mg/m² de 12 em 12 horas (dose máxima: 600 mg/dia).

Neonatos e crianças (< 90 dias):

DOSE → 2 mg/kg de 6 em 6 horas.



ZIDOVUDINA

ZIDOVIR[®]

Cápsula – 100 mg

Xarope – 10 mg/mL

Solução injetável – 10 mg/mL

REAÇÕES ADVERSAS

- Fadiga;
- Mal-estar;
- Mialgia;
- Náusea;
- Anorexia;
- Cefaleia;
- Supressão da medula óssea;
- Granulocitopenia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Probenecida, ácido valproico, fluconazol e atovacona são fármacos que, por meio da inibição da glicuronosil transferase, podem aumentar as concentrações no plasma da Zidovudina, porém ainda não se sabe se essa interação modifica de forma significativa a atuação do fármaco, já que a sua concentração intracelular pode se manter a mesma.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Zidovudina de 2020. Acesso em 10 de agosto de 2020.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

CONTRAINDICAÇÕES

Pacientes com hipersensibilidade a zidovudina.

Risco na gravidez Classe C.

Pacientes com baixa contagem de neutrófilos.

Níveis anormais de hemoglobina.

Anotações:



EFAVIRENZ

EFAVIRENZO[®]
Comprimidos – 600 mg

INDICAÇÕES

- É indicado para o tratamento de portadores do HIV-1.

CLASSE

Inibidores não nucleosídicos da transcriptase reversa.

MECANISMO DE AÇÃO

É um inibidor não competitivo da transcriptase reversa do HIV tipo 1, no que diz respeito à matriz e trifosfato básicos ou nucleosídeos, com um pequeno componente de inibição competitiva.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → Possui absorção gastrointestinal;
2. Concentração plasmática → 5 horas;
3. Biodisponibilidade → aumenta na presença de alimentos ricos em gordura;
4. Ligação a proteínas plasmáticas → 99%;
5. Metabolização → hepática;
6. Excreção → não tem eliminação renal significativa;
7. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 40-55 horas.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos, adolescentes e crianças (≥ 40 quilos):

DOSE → 600 mg a cada 24 horas.

REAÇÕES ADVERSAS

- No sistema nervoso central, foram relatadas tontura, insônia e disforias;
- Erupções cutâneas;
- Síndrome de Stevens-Jhonson são raras;
- Cefaleia;
- Aumento das transaminases hepáticas.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Astemizol, cisaprida, terfenadina, midazolam, triazolam e derivados do ergot não podem ser administrados com o efavirenz devido aos efeitos adversos.



EFAVIRENZ

EFAVIRENZO[®]
Comprimidos – 600 mg

CONTRAINDICAÇÕES

Pacientes com hipersensibilidade aos seus componentes.

Não deve ser usado concomitante com terfenadina, astemizol, cisaprida, midazolam.

Crianças com menos de 3 anos e peso inferior a 13 quilos.

Não é recomendado seu uso durante a gravidez.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

EFAVIRENZ: comprimidos. Rio de Janeiro: Instituto de Tecnologia em Fármacos – Farmanguinhos, [200].

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



RALTEGRAVIR ISENTRESS

Comprimido – 400 mg
Comprimido mastigável – 25 mg

INDICAÇÕES

- Possui atividade tanto para o HIV-1 quanto para o HIV-2.

CLASSE

Inibidores da integrase.

MECANISMO DE AÇÃO

Liga-se a integrase, uma enzima viral essencial na replicação do HIV-1 e HIV-2. Através disso, o fármaco inibe a transferência de filamento, a terceira e última etapa de integração do pró-vírus, interferindo, assim na integração do DNA do HIV de transcrição reversa nos cromossomos da célula hospedeira.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → Após administração oral;
2. Concentração plasmática → pico em 1-3 horas;
3. Biodisponibilidade → as ingestas concomitantes com alimentos gordurosos aumentam sua biodisponibilidade em até 2 vezes;
4. Ligação a proteína plasmáticas → 83%;
5. Eliminação → bifásica e é feito por glicuronidação UGT 1A1, não interage com o citocromo P450, devido a isso, não interage tanto com outros fármacos.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 400 mg duas vezes ao dia.

Adolescentes e crianças:

Acima de 12 anos: 400 mg duas vezes ao dia.

6 a 11 anos: 400 mg duas vezes ao dia (acima de 25 kg).

2 a 5 anos: depende do peso do paciente, dose máxima 300 mg.

REAÇÕES ADVERSAS

- Astenia e fadiga;
- Diarreia e náuseas;
- Vertigem, tontura, sonolência e tremor;
- Extrassístoles ventriculares;
- Calafrios, edema de face e periférico;
- Hepatite;
- Aumento do peso ou redução do peso;
- Artralgia, mialgia, osteoporose e poliartrite.



RALTEGRAVIR ISENTRESS

Comprimido – 400 mg
Comprimido mastigável – 25 mg

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Por ser um substrato da UGT1A1, interage com indutores ou inibidores dessa enzima;
- Alguns medicamentos como o Atazanavir e Rifampicina devem ter uma atenção maior, pois interagem com esse substrato.

CONTRAINDICAÇÕES

Pacientes com hipersensibilidade conhecida a qualquer componente do medicamento.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

ISENTRESS: Raltegravir. Países Baixos: Merk Sharp & Dohme B.V.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



ETRAVIRINA

INTELENCE[®]
Comprimido – 100mg

INDICAÇÕES

- Para o HIV-1.

CLASSE

Antivirais. Inibidores da retrotranscriptase. Diarilpirimidínico.

MECANISMO DE AÇÃO

O fármaco é singular em inibir a transcriptase reversa que é resistente há outros IN-NTR disponíveis.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → absorvida rapidamente após administração oral. Recomenda-se que o fármaco seja administrado com alimento;
2. Concentrações plasmáticas máximas → entre 2,5-4 horas;
3. Ligação a proteínas plasmáticas → 99%, principalmente à albumina e a α 1-glicoproteína ácida;
4. Metabolização → hepática, gerando dois metabólitos metil e dimetil-hidroxilados produzidos pelas CYP 3A4, 2C9 e 2C19, contribuindo para uma maior eliminação desse fármaco;
5. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → terminal do fármaco.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 200 mg a cada 12 horas, após as refeições.

REAÇÕES ADVERSAS

- Exantema;
- Náuseas e diarreia;
- Aumento do colesterol, transaminases hepáticas, triglicerídeos e glicose.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- A Etravirina é um substrato indutor da CYP3A4 e um inibidor da CYP2C9 e CYP2C19, com isso apresenta inúmeras interações. Por exemplo, pode diminuir as concentrações de Itraconazol e de Cetoconazol, mas aumentar as de Vori-conazol.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade ao fármaco.



ETRAVIRINA

INTELENCE[®]
Comprimido – 100mg

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

INTELENCE: Etravirina. Itália: Janssen-Cilag.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014.
- 2 v.



FOSAMPRENAVIR

TELZIR®

Comprimido – 700 mg

Suspensão oral – 50 mg/mL

INDICAÇÕES

- Possui ação para o HIV-1 e HIV-2.

CLASSE

Inibidor não peptídico da protease.

MECANISMO DE AÇÃO

Requer metabolismo em vivo para gerar o componente ativo amprenavir. Na ausência de metabolitos in vivo, o Fosamprenavir tem atividade insignificante em ensaios enzimáticos e antivirais in vitro. Portanto, esses ensaios são conduzidos usando-se amprenavir, um inibidor competitivo da protease do HIV. Ele bloqueia a capacidade da protease viral de clivar as poliproteínas precursoras necessárias para a replicação viral.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → Bem absorvido pelo trato gastrointestinal, pode ser administrado com ou sem alimento, entretanto na presença de alimentos gordurosos, sua absorção é diminuída, portanto deve ser evitado;
2. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 7-11 horas;
3. Metabolização → fígado pela CYP3A4 é deve ser utilizado com cautela em casos de insuficiência hepática.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral. Ingerir sem alimentos.

Adultos:

I) Pacientes não submetidos a tratamento anterior

DOSE → Fosamprenavir cálcico 28 mL (1400 mg) uma vez ao dia + ritonavir 100 mg, uma vez ao dia.

Fosamprenavir cálcico 14 mL (700 mg) duas vezes ao dia + ritonavir 100 mg, duas vezes ao dia.

II) Pacientes já submetidos ao tratamento com inibidores de protease:

DOSE → Fosamprenavir cálcico 14 mL (700 mg) duas vezes ao dia + ritonavir 100 mg, duas vezes ao dia.

Crianças:

4 semanas a < 2 anos de idade:

DOSE → Fosamprenavir 45 mg/kg + ritonavir 7 mg/kg, duas vezes ao dia.

Somente utilizar em bebês nascidos após 38 semanas ou mais de gestação e que tenham atingido idade pós-natal de 28 dias.

2 a < 3 anos de idade:

DOSE → Fosamprenavir 30 mg/kg + ritonavir 3 mg/kg, duas vezes ao dia.



FOSAMPRENAVIR

TELZIR®

Comprimido – 700 mg

Suspensão oral – 50 mg/mL

3 a < 6 anos de idade:

DOSE → Fosamprenavir 23 mg/kg + ritonavir 3 mg/kg, duas vezes ao dia.

≥ 6 anos de idade:

DOSE → Fosamprenavir 18 mg/kg + ritonavir 3 mg/kg, duas vezes ao dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Cefaleias;
- Náuseas e diarreias;
- Parestesias periorais;
- Depressão;
- Hipercolesterolemia;
- Hipertrigliceridemia;
- Exantema.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- São tanto indutor quanto inibidor da CYP3A4;
- As soluções de Amprenavir e Ritonavir não devem ser coadministradas;

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

TELZIR: Fosamprenavir Cálcico. Responsável Técnico Edinilson da Silva Oliveira. Rio de Janeiro: GlaxoSmithKline, 2017.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

- O Amprenavir, uma sulfonamida está contraindicado em casos de pacientes com histórico alérgico a sulfonamidas.

CONTRAINDICAÇÕES

Não é indicado em casos de hipersensibilidade.

Não pode ser administrado juntamente com produtos que tenham substratos do citocromo P450 (CYP3A4), pois podem resultar em inibição competitiva do metabolismo desses produtos e em reações adversas graves.

Há um aumento de reações adversas quando administrado juntamente com sildena-fila no tratamento de hipertensão arterial pulmonar.

Pode diminuir a concentrações plasmáticas quando administrado junto com a rifampicina.

Anotações:



LOPINAVIR

Comprimido – 200 e 100 mg, associado ritonavir

INDICAÇÕES

- Ação contra o HIV-1 e HIV-2.

CLASSE

Inibidor da protease do HIV peptidomimético.

MECANISMO DE AÇÃO

Inibir a multiplicação do HIV dentro das células, impedindo a ação da enzima protease. A inibição da prótese leva à formação de um vírus imaturo, não infeccioso, ou seja, que é capaz de entrar em outra célula para se multiplicar.

FARMACOCINÉTICA

1. Administração → Deve ser ingerido com alimentos para que tenha sua biodisponibilidade aumentada.
2. Ligação a proteínas plasmáticas → 98 a 99%;
3. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 5 a 6 horas;
4. Metabolização → hepática, pela CYP3A, inibida pelo Ritonavir. Os níveis séricos do fármaco podem estar elevados em pacientes com comprometimento hepático.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 400/100 mg (5 ml de solução oral), duas vezes ao dia com alimentação.

Crianças (6 meses a 12 anos):

7-15 quilos: 12/3ml/kg.

15 e 40 quilos: 10/2,5 mg/kg, 2 vezes ao dia.

Acima de 40 quilos: 400/100 mg/kg, 2 vezes ao dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Diarreia, dor abdominal, náuseas, vômitos e astenia;
- É comum aumento dos níveis séricos de colesterol e triglicerídeos.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Deve se evitar o uso concomitante de Fosamprenavir, devido a exposição alterada ao Lopinavir com níveis diminuídos de Amprenavir;
- Além disso o uso concomitante com Rifampicina está contraindicado;
- Como a solução oral de Lopinavir/Ri-



LOPINAVIR

Comprimido – 200 e 100 mg, associado ritonavir

tonavir contém álcool, a administração concomitante de dissulfiram é metronidazol é contraindicada.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade ao fármaco.

Não deve ser utilizado com outros fármacos que a depuração seja dependente do CYP3A.

Não deve ser administrado juntamente com colchicina, midazolam, cisaprida, lovastatina, sinvastatina, salmeterol, sildenafil e entre outros.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

KALETRA: Lopinavir/Ritonavir. Responsável Técnico Joyce M. C. Camargo. São Paulo: AbbVie.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



FUMARATO DE TENOVIR DESOPROXILA TENOVIR

Comprimido – 300 mg

INDICAÇÕES

- Pacientes maiores de 18 anos com as seguintes infecções:
- HIV-1;
- Em tratamento de hepatite B crônica.

CLASSE

Inibidores do nucleosídeo da transcriptase reversa.

MECANISMO DE AÇÃO

Atua no bloqueio da transcriptase reversa, reduzindo a carga viral e consequentemente aumentando a quantidade de células CD4.

Na hepatite B crônica atua no funcionamento da enzima ADN polimerase do VHB (vírus da hepatite B), que é utilizada em sua reprodução.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → administração oral em jejum. A administração concomitante de alimentos retarda em até 1 hora o pico da concentração plasmática;
2. Biodisponibilidade → 25%;
3. Concentração plasmática máxima → aproximadamente 1 hora;

4. Ligação às proteínas plasmáticas → até 7,2%;
5. Metabolismo → testes in vitro demonstraram que não há metabolização pelo citocromo P450;
6. Eliminação → 70%-80% do princípio ativo é eliminado de forma inalterada em até 72h, com eliminação predominantemente renal;
7. Tempo $\frac{1}{2}$ vida de eliminação → 17 horas.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 300 mg/dia.

Ajustar a dose em pacientes com insuficiência renal.

REAÇÕES ADVERSAS

- Erupção cutânea;
- Diarreia;
- Cefaléia;
- Dor;
- Depressão;
- Astenia;
- Náusea.



FUMARATO DE TENOVIR DESOPROXILA TENOVIR

Comprimido – 300 mg

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Danosina;
- Inibidores da protease do HIV-1;
- Agentes antivirais para Hepatite C;
- Drogas que afetem a função renal.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade à droga ou algum dos seus componentes.

Utilização de combinações medicamentosas que já possuam o princípio ativo deste medicamento.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

FUMARATO DE TENOVIR DESOPROXILA. Taboão da Serra, São Paulo: Blanver Farmoquímica, 2017. Disponível em: <http://funed.mg.gov.br/wp-content/uploads/2018/11/2.-Bula-de-fumarato-de-tenovir-desoproxila-para-o-Profissional.pdf>

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



LAMIVUDINA

EPIVIR[®]
Comprimido – 150 mg

INDICAÇÕES

- Tratamento de infecções pelo HIV na população adulta e pediátrica.

CLASSE

Inibidores do nucleosídeo da transcriptase reversa.

MECANISMO DE AÇÃO

Atua nas atividades dependentes de DNA e RNA da transcriptase reversa do HIV, inibindo a reprodução do HIV-1 e HIV-2. É ativa na resistência à azidovudina.

FARMACOCINÉTICA

1. Distribuição → baixa ligação às proteínas plasmáticas. Penetra no líquido cefalorraquidiano;
2. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida terminal → 5h a 7h;
3. Metabolização → menos que 10% é metabolizado no fígado;
4. Eliminação → predominantemente renal (>70%).

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos e adolescentes (acima de 12 anos):

DOSE → 300 mg ou 30 ml. Dose única ou duas vezes de 150mg (15ml).

Crianças (3 meses a 12 anos de idade):

DOSE → 4 mg/kg, com máximo de 300mg (30ml), fracionadas em duas doses.

Pacientes com comprometimento renal ajusta a dose.

REAÇÕES ADVERSAS

- Hiperlactemia;
- Cefaléia;
- Êmese e dispepsia;
- Trombocitopenia;
- Aumento da concentração de TGO e TGP.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Interação com outros fármacos é baixa, haja vista que o medicamento apresenta metabolismo limitado e ligação reduzida a proteínas plasmáticas, com eli-



LAMIVUDINA

EPIVIR[®]
Comprimido – 150 mg

minação quase completa na sua forma inalterada.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade a fórmula.

Não se recomenda o uso em monoterapia.

Ajustar dose em caso de insuficiência renal e suspender o uso em caso de pancreatite, acidose láctica, hepatomegalia grave, esteatose hepática e síndrome da reconstituição imune.

O uso na gravidez deve ser avaliado seu risco/benefício, porém na maioria dos casos é contraindicado.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

EPIVIR. Rio de Janeiro, Rio de Janeiro: GlaxoSmithKline Inc. Bula de remédio. Disponível em http://br.gsk.com/media/610463/l1205_epivir_com_rev_gds23_ipi11.pdf.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



MARAVIROQUE CELSENTRI®

Comprimido – 300 mg

INDICAÇÕES

- É indicado em associação com outros fármacos antirretrovirais no tratamento de paciente infectados somente com o HIV-1 CCR5-trópico.

CLASSE

Antagonistas do correceptor CCR.

MECANISMO DE AÇÃO

Liga-se seletivamente ao receptor de quimiocina humana CCR5, prevenindo a entrada do HIV-1 CCR5-trópico nas células.

FARMACOCINÉTICA

- Absorção → variável e com múltiplos picos. O pico da concentração plasmática é alcançado em 2h;
- Biodisponibilidade → 23%;
- Ligação a proteínas plasmáticas → 76% e possui afinidade pela albumina e pela alfa-1 glicoproteína ácida;
- Metabolismo → metabolizado principalmente pelo sistema do citocromo P450 a metabólitos que são essencialmente inativos contra o HIV-1;
- Eliminação → cerca de 20% eliminado via renal e 76% por via biliar. Aproxima-

damente 33% eliminado de forma inalterada e o restante na forma de metabólitos.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 150 mg ou 300 ou 600 mg a cada 12 horas.

Depende das interações com outros medicamentos administrados juntos.

MEDICAÇÕES COADMINISTRADAS	DOSE
Inibidores de protease (exceto tipranavir/ritonavir) Delavirdina Cetoconazol, itraconazol, claritromicina Outros inibidores potente da CYP3A (nefazodona, telitromicina)	150 mg de 12h em 12h
Efavirenz Rifampicina Etravirina Carbamazepina, fenobarbital e fenitoína	600 mg de 12h em 12h



MARAVIROQUE
CELSENTRI®

Comprimido – 300 mg

Outros medicamentos concomitantes, incluindo tipranavir/ritonavir, nevirapina, raltegravir, todos ITRNs e enfuvirtida	300 mg de 12h em 12h
-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	----------------------

REAÇÕES ADVERSAS

- Diminuição do peso;
- Insônia;
- Neuropatia periférica, tontura, parestesia, disgeusia e sonolência;
- Tosse;
- Dor abdominal, distensão abdominal, constipação, dispepsia;
- Aumento da ALT, AST e GGT;
- Rash, alopecia;
- Espasmo muscular, dor nas costas e nas extremidades;
- Astenia e fadiga.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Deve ter doses reajustadas quando administrado com outros antirretrovirais ou drogas metabolizadas pelo citocromo P450;
- Não é recomendado o uso concomitante com Erva-de-São-João (*Hypericum perforatum*) ou produtos contendo Erva-de-São-João.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade ao fármaco ou aos demais componentes da fórmula.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

CELSENTRI. Rio de Janeiro, Rio de Janeiro: GlaxoSmithKline Inc, 2017. Bula de remédio. Disponível em http://br.gsk.com/media/587270/bl_celsentri_com_rev_pds18_ipi06_l1028_l.pdf.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



NEVIRAPINA VIRAMUNE®

Comprimido – 200 mg

INDICAÇÕES

- Juntamente com outros agentes antirretrovirais para infecções pelo HIV-1.

CLASSE

Inibidor da transcriptase reversa não-nucleosídeo.

MECANISMO DE AÇÃO

Inibe a replicação do HIV interferindo com a atividade da transcriptase reversa da polimerase viral.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → 90% é rapidamente absorvida por meio oral;
2. Biodisponibilidade → entre 91% e 93%;
3. Concentração plasmática máxima → após 4 horas à administração de dose única de 200 mg;
4. Distribuição → atravessa a barreira placentária e é encontrada no leite materno;
5. Ligação a proteínas plasmáticas → aproximadamente 60%. No líquor apresenta 45% da quantidade plasmática;
6. Metabolismo → é transformada em metabólitos hidroxilados via citocromo

P450, por meio de metabolismo oxidativo, mediado pelas isoenzimas da família CYP3A;

7. Excreção → Principalmente via renal, por meio de metabólitos. Apenas 3% da dose eliminada não sofreu metabolização.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

ADULTOS			
Primeiros dias	14	200 mg	1x ao dia
Após		200 mg	2x ao dia
<i>Associação com no mínimo mais 3 antirretrovirais</i>			
PEDIÁTRICOS DE ATÉ 8 ANOS			
Primeiros dias	14	4 mg/kg	1x ao dia
Após		7 mg/kg	2x ao dia
PACIENTES PEDIÁTRICOS MAIORES QUE 8 ANOS			
Primeiros dias	14	4 mg/kg	1x ao dia
Após		4 mg/kg	2x ao dia



NEVIRAPINA VIRAMUNE®

Comprimido – 200 mg

REAÇÕES ADVERSAS

- Síndrome de Stevens-Johnson;
- Necrólise epidérmica tóxica;
- Hepatite grave/falência hepática;
- Hipersensibilidade (erupções cutâneas, febre, artralgia, mialgia).

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- As concentrações plasmáticas de medicamentos que sofrem metabolização hepática pela CYP3A ou CYP2B podem sofrer alterações se administrados durante o tratamento com Nevirapina;
- Não sofre alterações se coadministrada com alimentos, antiácidos ou agentes tamponantes alcalinos.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade ao princípio ativo ou aos demais componentes.

Não deve ser usado por pacientes com fun-

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

FARMANGUINHOS NEVIRAPINA. Rio de Janeiro, Rio de Janeiro: Fundação Oswaldo Cruz/ Farmanguinhos. Bula de remédio. Disponível em: http://www.anvisa.gov.br/datavisa/fila_bula/frmResultado.asp#

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

ção hepática gravemente comprometida.

Não deve ser reutilizado por pacientes que já apresentaram reações adversas graves.

Não deve ser administrado ou reutilizado por pacientes com níveis de ALT ou AST maiores em 5 vezes ao valor de referência.

Contraindicado nos casos de intolerância à galactose hereditária.

Não deve ser coadministrados fitoterápicos que contenham Erva de São João (*Hypericum perforatum*) durante o tratamento com a Nevirapina.

Anotações:

ATAZANAVIR
REYATAZ[®]

Comprimido – 150 e 300 mg

INDICAÇÕES

- Tratamento da infecção por HIV-1, em associação a outros medicamentos.

CLASSE

Inibidor de protease.

MECANISMO DE AÇÃO

O atazanavir bloqueia seletivamente o processamento de poliproteínas Gag e Gag-Pol virais em células infectadas pelo HIV-1, prevenindo deste modo a formação de vírus maduros.

FARMACOCINÉTICA

1. Ligação a proteínas plasmáticas → 86%, sendo a ligação protéica independente da concentração. O atazanavir liga-se à alfa-1-glicoproteína ácida (AAG) e à albumina em uma extensão similar (89% e 86%, respectivamente).
2. Metabolismo → Amplamente metabolizado em humanos. As principais vias de biotransformação em humanos consistem de monooxigenação e deoxigenação. Vias de biotransformação secundárias para atazanavir ou seus metabólitos consistem de glicuronidação, N-dealquilação, hidrólise e oxigenação com dehi-

drogenação;

3. Eliminação → fezes e urina;
4. Tempo de 1/2 vida → aproximadamente 7 horas, no estado de equilíbrio após uma dose diária de 400 mg, com uma refeição leve.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral. Ingeri junto com alimentos.

Adultos:

DOSE → 300 mg/dia, associado ao ritonavir.

400 mg/dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Náusea;
- Icterícia (13%) e diarreia (10%). Icterícia foi relatada dentro de alguns dias a alguns meses após início do tratamento e resultou em descontinuação do tratamento.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- É um inibidor do CYP3A4 (citocromo P450 3A4), e UGT1A1;
- A coadministração de sulfato de atazana-



ATAZANAVIR
REYATAZ[®]

Comprimido – 150 e 300 mg

vir e fármacos primariamente metabolizados pelo CYP3A4, como, bloqueadores de canal de cálcio, alguns inibidores de HMG-CoA redutase, imunossupressores e inibidores da fosfodiesterase (PDE5) ou UGT1A1 pode resultar em concentrações plasmáticas aumentadas do outro fármaco, o qual pode elevar ou prolongar seus efeitos terapêuticos e adversos.

CONTRAINDICAÇÕES

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

BRASIL, Ministério da Saúde - Agência Nacional de Vigilância Sanitária (ANVISA). Bula profissional de Atazanavir. Acesso em 19 de março de 2021.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12^o Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

ENFUVIRTIDA
FUZEON®

Pó liofilizado para solução injetável – 90 mg/ml

INDICAÇÕES

- Tratamento da infecção pelo VIH-1, em associação com outros medicamentos antirretrovíricos.

CLASSE

Análogos nucleosídeos inibidores da transcriptase inversa (reversa).

MECANISMO DE AÇÃO

Trata-se de um inibidor do rearranjo estrutural da gp41 do VIH-1, que se liga especificamente a nível extracelular a esta proteína viral, bloqueando a fusão entre o invólucro do vírus e a membrana celular da célula alvo, impedindo a entrada do ARN viral na célula alvo.

FARMACOCINÉTICA

1. Ligação a proteínas plasmáticas → 92%, liga-se predominantemente à albumina e em menor extensão a α -1-glicoproteína ácida;
2. Metabolismo → sofre catabolismo de seus aminoácidos constituintes com a reciclagem dos aminoácidos;
3. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 4 horas.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via subcutânea. Associar com outros antirretrovirais para melhor resultado.

Adultos:

DOSE → 90 mg a cada 12 horas.

Crianças (6 a 16 anos):

DOSE → 2 mg/kg, 2 vezes ao dia, uso contínuo. Dose máxima 180 mg/dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Vermelhidão;
- Inchaço;
- Comichão;
- Nódos negros;
- Espessamento da pele ou nódulos;
- Dor ou sensibilidade.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Não é um inibidor das enzimas CYP450 e não altera o metabolismo dos fármacos.



ENFUVIRTIDA
FUZEON®

Pó liofilizado para solução injetável – 90 mg/ml

CONTRAINDICAÇÕES

Casos de hipersensibilidade e para menores de 6 anos.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

ENFUVIRTIDA. Burgdorg, Suíça: r F. Hoffmann-La Roche Ltd, 2018. Bula de remédio. Disponível em: <http://www.sausedireta.com.br/catinc/drugs/bulas/fuzeon.pdf>.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.



DARUNAVIR
PREZISTA®

Comprimido – 75, 150, 300, 600 mg

INDICAÇÕES

- Está indicado, em associação com baixa dose de ritonavir, para o tratamento do HIV.

CLASSE

Pertence aos inibidores da protease.

MECANISMO DE AÇÃO

Seu mecanismo de ação é similar aos demais medicamentos pertencentes a classe dos inibidores da protease, os quais impedem a replicação viral na célula agindo no bloqueio da enzima protease.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rápida;
2. Concentração plasmática máxima → 4 horas;
3. Biodisponibilidade → 37% (600 mg);
4. Ligação a proteínas plasmáticas → 95%, liga a glicoproteína α -1-plasmática principalmente;
5. Metabolismo → oxidativo, pelo CYP hepático (CYP3A4);
6. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → 15 horas;
7. Excreção → renal e fecal.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos:

DOSE → 600 mg a cada 12 horas.

Deve ser sempre administrado com baixa dose de ritonavir (100 mg) como potenciador farmacocinético e em combinação com outros medicamentos antirretrovirais.

Crianças (acima de 6 anos):

20 a 30 kg

DOSE → 375 mg com 50 mg de ritonavir, duas vezes ao dia.

30 a 40 kg

DOSE → 450 mg com 60 mg de ritonavir, duas vezes ao dia.

Acima de 40 kg

DOSE → 600 mg com 100 mg de ritonavir, duas vezes ao dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Cefaleia;
- Distensão abdominal, dor abdominal, dispepsia, flatulência, náusea e vômitos;
- Lipodistrofia, prurido e erupção cutânea;
- Mialgia;
- Anorexia e diabetes mellitus;



DARUNAVIR
PREZISTA®

Comprimido – 75, 150, 300, 600 mg

- Astenia e fadiga.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Medicamentos que causam efeito redutor do darunavir no organismo:
- Antivirais usados no tratamento da Hepatite C (boceprevir, telaprevir);
- Anti-convulsivantes (fenobarbital, fenitoína);
- Esteroides (dexametasona);
- Medicamentos usados no tratamento de algumas infecções como a tuberculose (rifapentina).

CONTRAINDICAÇÕES

Contraindicado em casos de apresentação de hipersensibilidade ao medicamento pelo paciente, efeito pouco comum.

Em casos de mulheres grávidas, não existem estudos que comprovam seu efeito teratogênico, porém, é necessário analisar os riscos antes que prescreva ou mantenha o uso deste medicamento durante a gravidez e amamentação.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

DARUNAVIR. Gurabo, Porto Rico – EUA: Janssen Ortho LLC, 2019. Bula de remédio. Disponível em: <https://www.spharmus.com.br/wp-content/uploads/2019/10/prezista.pdf>.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Anotações:



DOLUTEGRAVIR TIVICAY[®] Comprimido – 50 mg

INDICAÇÕES

- Indicado para o tratamento de pacientes infectados pelo HIV, sejam adultos ou jovens, e que são virgens de tratamento antirretroviral ou que não sejam resistentes.

CLASSE

É um inibidor da integrase.

MECANISMO DE AÇÃO

Mecanismo similar aos demais inibidores da integrase, o qual age bloqueando a proteína integrase na fase de síntese do DNA, impedindo a replicação viral.

FARMACOCINÉTICA

1. Absorção → rapidamente absorvida por via oral;
2. Biodisponibilidade → 83%;
3. Concentração máxima sérica → aproximadamente 2h;
4. Distribuição → volume aparente de distribuição é estimado em 12,5 L;
5. Ligação a proteínas plasmáticas → 99%;
6. Metabolização → metabolizado primariamente via UGT1A1 com um componente menor da CYP3A;

7. Eliminação → eliminação na maioria pela urina e uma pequena parcela pelas fezes.
8. Tempo de $\frac{1}{2}$ vida → aproximadamente 14 horas.

POSOLOGIA E MODO DE USAR

Administração via oral.

Adultos sem resistência à inibidores de integrase e adolescentes (acima de 12 anos e peso > 40 kg):

DOSE → 50 mg/dia.

Adultos com resistência à inibidores de integrase:

DOSE → 50 mg duas vezes ao dia.

REAÇÕES ADVERSAS

- Distensão abdominal, doença do refluxo gastroesofágico e dispepsia;
- Sonolência;
- Pesadelos e distúrbios do sono;
- Hipertrigliceridemia e hiperglicemia.



DOLUTEGRAVIR
TIVICAY®
Comprimido – 50 mg

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- Efavirenz, etravirina, nevirapina, rifampicina, carbamazepina e tipranavir em combinação com ritonavir reduziram significativamente as concentrações plasmáticas de dolutegravir, mecanismo justificado pelo mecanismo de metabolização hepática envolvido nestes medicamentos.

CONTRAINDICAÇÕES

Pacientes com hipersensibilidade conhecida ao dolutegravir, abacavir ou lamivudina, ou a quaisquer dos excipientes e no uso concomitante ao dofetilida ou pilsicainida.

Anotações:

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

DOLUTEGRAVIR. Priory Street, Ware, Hertfordshire, SG12 0DJ, Inglaterra: Glaxo Operations UK Limited, 2017. Bula de remédio. Disponível em: https://br.gsk.com/media/577199/bl_triumeq_com_rev_gds06_ipi06_l0947.pdf.

BRUTON, Laurence L. *et al.* Goodman & Gilman: As Bases Farmacológicas da terapêutica. 12º Ed. 2012.

DELUCIA, R. Farmacologia Integrada / uso racional de medicamentos. Clube de Autores: São Paulo, 2014. - 2 v.

Esse material contém as principais informações acerca da farmacologia antimicrobiana, levando em conta a importância desta classe de medicações no tratamento de diversas patologias. Sabe-se que esses são medicamentos que podem possuir prescrições indiscriminadas, o que torna os microrganismos cada vez mais resistentes. Dessa forma, este e-book traz uma abordagem objetiva e concisa que auxiliará no manejo clínico de pacientes e nas prescrições de medicamentos, explanado os principais fármacos da classe de antimicrobianos, atribuindo a eles suas indicações, mecanismos de ação, farmacocinéticas, reações adversas, interações medicamentosas, posologias e contraindicações.

