

Roxitromycin

DEKLARATION

Roxitromycin (J01FA06) är ett makrolidantibiotikum avsett för oralt bruk.

RAFS BEDÖMNING

Roxitromycin är ett alternativt förstahandsmedel vid behandling av pneumoni orsakad av *Mycoplasma pneumoniae*, *Chlamydophila psittaci* eller *Chlamydophila pneumoniae*. Roxitromycin har otillräcklig aktivitet mot *Haemophilus influenzae* och uppvisar en dålig penetration till mellanörat och är därför endast rekommenderat för behandling av akut mediaotit vid verifierad penicillinallergi typ 1. Makrolidanvändning skall om möjligt undvikas vid infektioner orsakade av pneumokocker och betahemolytiska streptokocker pga. risk för selektion av resistenta bakteriestammar

FARMAKODYNAMIK

Roxitromycin hämmar bakteriers proteinsyntes genom bindning till ribosomer. Roxitromycin har ett antibakteriellt spektrum som mycket liknar det hos erytromycin.

Aktivitet roxitromycin

- **God aktivitet:** stafylokocker, streptokocker (inklusive pneumokocker), *Moraxella catarrhalis*, *Mycoplasma pneumoniae*, *Chlamydia trachomatis*, *Chlamydophila pneumoniae* och *Chlamydophila psittaci*, *Ureaplasma urealyticum*, *Listeria monocytogenes*, *Arcanobacterium haemolyticum*, *Legionella pneumophila*, *Bordetella pertussis*.
- **Lägre aktivitet (nativ population i I-grupp):** -
- **Otillräcklig aktivitet:** *Haemophilus influenzae*, enterokocker, *Mycoplasma hominis*, Enterobacteriaceae, *Pseudomonas*, *Acinetobacter*, anaeroba bakterier.

MIC-distributioner för roxitromycin kan hittas på EUCASTs webbsidor: (<http://217.70.33.99/Eucast2/SearchController/search.jsp?action=init>)

BRYTPUNKTER

- **Icke-artrelaterade brytpunkter:** Data saknas.
- **Kliniska brytpunkter (Artrelaterade brytpunkter som korrelerar till klinisk behandlingseffekt):** stafylokocker, streptokocker, pneumokocker, *M. catarrhalis*.

MIC- och zonbrytpunkter redovisas i separat tabell (<http://www.srga.org/MICTAB/Brytpunktstabeller%20RAF-M%20v1.1.xls>).

RESISTENSUTVECKLING

- **Resistensmekanismer:** Det finns två huvudsakliga resistensmekanismer: Den vanligaste kallas av ermB genen, vilket leder till minskad bindning av alla makrolider till 23S ribosomen och korsresistens för makrolider (inklusive telitromycin), linkosamider samt streptogramin B (MLS_B). Den andra resistensmekanismen kallas av mefA genen, vilket leder till efflux av makrolider (i viss utsträckning även av telitromycin).
 - **Korsresistens:** väsentligen total korsresistens mellan alla makrolider och azitromycin. Viss korsresistens mellan makrolider och linkosamider (klindamycin), s.k. MLS-resistens.
 - **Resistens sällsynt (<1%):** Moraxella catarrhalis, Mycoplasma pneumoniae, Chlamydia trachomatis, Chlamydophila pneumoniae och Chlamydophila psittaci.
 - **Resistens förekommer (1-10%):** Streptococcus pyogenes (GAS), streptokocker grupp C och G, pneumokocker, Helicobacter pylori, Staphylococcus aureus
 - **Resistens vanlig (>10%):** Koagulasnegativa stafylokocker
 - **Internationella trender:** Pneumokocker är resistenta i allt högre utsträckning (>40%) i allt fler länder. Flera länder har haft epidemier med makrolidresistenta Streptococcus pyogenes (GAS).
-

FARMAKOKINETIK

- **Biotillgänglighet (% av given dos):** <50%. Födointag ger varierande påverkan för olika salter. För erytromycinbas ses ringa påverkan
 - **Maximal serumkoncentration (mg/L):** 1-3 mg/L.
 - **Skenbar distributionsvolym:** 0.6 - 1.0 L/kg
 - **Serumproteinbindning:** 70%
 - **Halveringstid:** 2 timmar.
 - **Metabolism och elimination:** erytromycin metaboliseras i levern och utsöndras huvudsakligen med faeces. Endast en liten del utsöndras via urinen.
 - **Aktiva metaboliter:** inga kända.
 - **Viktig interaktion:** Alfentanil, alprazolam, bromokriptin, ciklosporin, cimetidin, digoxin, disopyramid, ergotamin, felodipin, fenytoin, karbamazepin, kinidin, klozapim, loratadin, metylprednisolon, midazolam, nitrazepam, takrolimus, teofyllin, terfenadin, toremifen, triazolam, valproinsyra, warfarin, zopiklon
-

Uppdaterad 2010-12-16