



اسپیرامایسین

دکتر علی اکبر ساری صراف، دکتر شاهرخ ابراهیمی
شرکت داروسازی تهران شیمی

- اسپیرامایسین I با فرمول $C_{43}H_{73}N_4O_{14}$ بمیزان ۶۳٪
 - اسپیرامایسین II با فرمول $C_{45}H_{76}N_4O_{15}$ بمیزان ۲۴٪
 - اسپیرامایسین III با فرمول $C_{36}H_{58}N_4O_{15}$ بمیزان ۱۲٪
- بصورت پودر بی شکل سفید تا زرد روشن و دارای بوی خاص می باشد. به نسبت ۱ به ۵۰ در آب و به راحتی در اتانول و کلروفرم حل

اسپیرامایسین آنتی بیوتیکی است از خانواده ماکرولیدها که از رشد گونه های خاصی از استرپتومیسس آمبوفاسینس (*Streptomyces Ambofaciens*) بدست می آید و مخلوطی از مواد ضدباکتری به شرح زیر می باشد:

می‌گردد.

هر واحد از اسپیرامایسین معادل با ۰/۰۰۰۳۶۲۵ میلی‌گرم از اولین فرآورده فرانس بین‌المللی (۱۹۶۲) است. بعبارت دیگر در ۱ میلی‌گرم از فرآورده فوق ۳۲۰۰ واحد اسپیرامایسین وجود دارد.

مکانیسم اثر

این دارو دارای طیف ضد میکروبی شبیه به اریترومایسین و کلیندامایسین است. در غلظتهای سرمی دارای خاصیت باکتریوستاتیک بوده ولی غلظت آن در بعضی بافتها ممکن است به حدی برسد که اثر باکتریوسیدی اعمال نماید. مکانیسم اثر آن دقیقاً تعیین نشده است ولی مشخص گردیده که با اثر در زیر واحد ۵۰S ریبوزوم باکتریها در عمل ترانس لوکیشن دخالت کرده و پروتئین سازی را مهار می‌نماید.

فارماکوکینتیک

جذب آن از دستگاه گوارش نامنظم بوده و حدود ۲۰ الی ۵۰ درصد دوز خوراکی آن جذب می‌شود. حداکثر غلظت پلاسمایی ۲ الی ۴ ساعت بعد از دوز خوراکی حاصل می‌گردد. حداکثر غلظت پلاسمایی پس از مصرف خوراکی ۱ گرم از دارو حدود ۱ میکروگرم در میلی‌لیتر بوده و این غلظت ۶-۴ ساعت دوام می‌یابد. مصرف همزمان آن با غذا بطور مشخصی بهره‌دهی بیولوژیک دارو را کم می‌کند. غذا حداکثر غلظت دارو در سرم را به حدود ۷۰٪ کاهش داده و زمان رسیدن به حداکثر غلظت را ۲ ساعت به تأخیر می‌اندازد.

اسپیرامایسین بطور گسترده در بدن توزیع شده و در ریه، لوزه، برنشه‌ها و سینوسها به غلظت بالایی می‌رسد ولی بمیزان کم در مایع مغزی نخاعی نفوذ می‌نماید. غلظت باکتریوستاتیک آن در سرم بین ۰/۱ تا ۳ میکروگرم در میلی‌لیتر و غلظت باکتریوسید آن در بافتها بین ۸ تا ۶۴ میکروگرم در میلی‌لیتر می‌باشد. نیمه عمر توزیعی آن از راه خوراکی کوتاه و حدود ۳/۷۲ ± ۱۰/۲ دقیقه است.

نیمه عمر حذف آن بطور متوسط ۵ تا ۸ ساعت می‌باشد. دارو عمدتاً از راه صفرا دفع می‌گردد بطوریکه غلظت صفراوی آن ۱۵ تا ۴۰ برابر بیش از غلظت سرمی آن است. پس از ۳۶ ساعت تنها حدود ۲٪ از کل داروی خورده شده از طریق ادرار دفع می‌شود.

موارد مصرف

اسپیرامایسین از طریق خوراکی مثل اریترومایسین بر علیه میکروارگانیزمهای حساس استفاده گردیده است. اسپیرامایسین همچنین در عفونتهای پروتوزوایی مانند کریپتوسپورییدیوزیس (cryptosporidiosis) و توکسوپلاسموز (toxoplasmosis) مصرف می‌شود.

عوارض جانبی

اسپیرامایسین به ندرت عوارض جانبی شدید تولید می‌کند. عوارضی که معمولاً پس از مصرف خوراکی ایجاد می‌شود شامل تهوع، استفراغ، اسهال و سوءهاضمه بوده و معمولاً سریع و پس از ۱ ساعت از مصرف خوراکی

ظاهر می‌گردند.

عوارض جانبی کمتر عادی این دارو پس از مصرف خوراکی شامل ایجاد خستگی، خون‌دماغ شدن، عرق کردن، احساس سنگینی در سینه و احساس خنکی در دهان و حلق می‌باشد. کولیت حاد در ۱٪ بیماران مشاهده گردیده است.

موارد منع مصرف

حساسیت به آنتی‌بیوتیک‌های ماکرولیدی.

موارد احتیاط

پیدایش مقاومت باکتریایی بدنبال مصرف اسپیرامایسین گزارش گردیده است. این مقاومت ممکن است بصورت مقاومت متقاطع بین اسپیرامایسین و اریترومایسین و اولتاندومایسین باشد. در بیماران با بدکاری کبدی بدلیل احتمال ایجاد سمیت کبدی بایستی با احتیاط مصرف گردد.

نکات قابل توصیه

به دلیل تأثیر غذا بر روی جذب آن، دارو بایستی حداقل ۲ ساعت قبل یا ۲ ساعت بعد از غذا مصرف شود. بیمار بایستی دوره کامل درمان را استفاده کند.

مصرف در بارداری

بی‌ضرری دارو در حاملگی ثابت نشده است. دارو از جفت عبور می‌کند ولی غلظت آن در خون جنین کمتر از خون مادر است (در طبقه‌بندی FDA جزو داروهای گروه B می‌باشد).

مصرف در شیردهی

اسپیرامایسین در شیر با غلظت زیادی ظاهر می‌شود.

مقدار مصرف

بزرگسالان: ۴-۲ گرم در روز و معمولاً در دو دوز منقسم.

اطفال: ۱۰۰-۵۰ میلی‌گرم به ازای هر کیلوگرم وزن بدن در روز در ۲-۳ دوز منقسم.

بسته‌بندی و نگهداری

در ایران اسپیرامایسین به صورت قرص‌های ۵۰۰ میلی‌گرمی (معادل ۱/۵ میلیون واحد بین‌المللی) در بسته‌های صد عددی عرضه شده است. این دارو باید در بسته‌های نفوذناپذیر در برابر هوا نگهداری شود.

منابع:

1. Budavari S. - J.O' Neil M. - Smith A. - E. Heckelman P. : The Merck Index 11th ed. U.S.A. Merck & Co. , Inc. 1989: 1380 - 1381
2. E.F. Reynolds J. : Martindale, the 'Extra pharmacopoeia 29th ed. London the pharmaceutical press, 1989 : 296 - 297
3. USP DI, Drug Information for the health care professional Vol. 1B, 12th ed. Rockville : United States pharmacopoeial convention, Inc. 1992 : V50-V51
4. Moffat A.C. - Jackson J.V. - Moss M.S. : Clarke's Isolation and Identification of Drugs, 2th ed. London The pharmaceutical press, 1986 : 973