

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

METRONIDAZOL

- Formula Molecular:** $C_6H_9N_3O_3$
- Peso Molecular:** 171,15
- Datos Físico-Químicos:** Polvo cristalino blanco o amarillento. Poco soluble en agua, en acetona en etanol al 96% y en cloruro de metileno. Punto de fusión: 158 – 160 °C.
- Propiedades y usos:** El metronidazol es un antibiótico nitroimidazólico activo contra protozoos, helmintos, y bacterias anaerobias. Actúa alterando el DNA de los gérmenes susceptibles e impidiendo su síntesis.
- El metronidazol es rápidamente absorbido después de su administración por vía oral con una biodisponibilidad aproximada del 100%. La biodisponibilidad vía rectal es del 60-80%, y vía vaginal del 20-25%. Se distribuye ampliamente en la mayoría de tejidos y fluidos, incluida la bilis, saliva, huesos, fluido seminal, secreciones vaginales, leche materna, etc... La mayor parte es excretada en orina sobretodo en forma de metabolitos, y en pequeña cantidad en heces. Atraviesa la barrera placentaria y pasa rápidamente a la circulación fetal. Se une como máximo en un 20% a las proteínas plasmáticas. Es metabolizado en el hígado por oxidación de la cadena lateral y formación del glucurónido. La semivida de eliminación es de unas 8 h.
- Es activo contra *Trichomonas vaginalis*, *Entamoeba histolytica*, *Giardia lamblia*, *Gardnerella vaginalis*, *Helicobacter pylori*, *Balantidium coli*, *Blastocystis hominis*, *Bacteroides*, *Clostridium*, y algunas espiroquetas.
- Está indicado en:
- Tricomoniasis: es un agente de elección en infecciones genitales por tricomonas en hombres y mujeres.
 - Vaginitis inespecífica.
 - Amebiasis: también es un agente de elección para esta patología.
 - Balantidiasis.
 - Giardiasis.
 - Infecciones dentales agudas.
 - Acné rosácea.
 - Úlceras por decúbito.
 - Gingivitis ulcerativa necrosante aguda o infección de Vincent.
 - Úlceras gastroduodenales: en combinación con otros fármacos.
 - Infecciones anaerobias de la cavidad abdominal.
 - Colitis pseudomembranosa.
 - Dermatitis perioral.
 - Profilaxis de algunas infecciones quirúrgicas.

Se administra por vía oral (en cápsulas o comprimidos), vía rectal (supositorios), vía vaginal (óvulos o comprimidos vaginales), y por

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

vía tópica (geles o cremas).

Por vía oral puede administrarse con la comida o después de las comidas.

Por vía tópica se incorpora a geles o a emulsiones de signo O/W o W/O.

Dosificación:

-Tricomoniasis y vaginitis inespecíficas: dosis única de 2 g vía oral, o bien 200-250 mg / 8 h o 400-500 mg / 12 h durante 7 días. También se pueden administrar óvulos de 500 mg durante 20 días.

-Amebiasis y balantidiasis: 400-800 mg / 8 h vía oral durante 5-10 días (en niños normalmente 35-50 mg/Kg/día en varias tomas).

-Giardiasis e infecciones dentales agudas: 2 g / 24 h vía oral durante 3 días, o 400 mg / 8 h durante 5 días, o 500 mg / 12 h durante 7-10 días (en niños normalmente 15 mg/Kg/día en varias tomas).

-Acné rosácea: 200 mg / 12 h vía oral y al 0,75 – 2 % vía tópica.

-Úlceras por decúbito: 400 mg / 8 h vía oral durante 7 días, y también al 1% vía tópica.

-Gingivitis ulcerativas necrosantes agudas e infecciones dentales: 200 mg / 8 h vía oral durante 3 días.

-Úlceras gastroduodenales: 400 mg / 8-12 h durante 7 días.

-Infecciones anaerobias: 800 mg iniciales vía oral seguidos de 400 mg / 8 h durante 7 días. Vía intravenosa 500 mg / 8 h.

Efectos secundarios:

Los efectos adversos del metronidazol son función de la dosis y de la duración del tratamiento. Los más frecuentes son los desórdenes gastrointestinales, especialmente náuseas y sabor metálico, que acompañan algunas veces de dolor de cabeza, anorexia, y vómitos.

Así mismo puede darse diarrea, estreñimiento, sequedad de boca, lengua saburral, glositis, y estomatitis, asociándose con casos de colitis pseudomembranosa y pancreatitis.

Además puede aparecer neuropatía periférica, presentando habitualmente entumecimiento y hormigueo de las extremidades y ataques epilépticos. Otros síntomas en el SNC son debilidad, mareos, ataxia, somnolencia, insomnio, depresión, o confusión.

Puede originarse una moderada leucopenia transitoria, erupciones y prurito cutáneo, y reacciones anafilácticas.

Otros efectos secundarios incluyen trastornos uretrales y oscurecimiento de la orina, así como elevaciones en las enzimas hepáticas.

Por vía intravenosa puede provocar una tromboflebitis.

Por vía vaginal quemazón uretral, prurito vaginal, vaginitis, continencia urinaria, y cistitis.

Puede teñir la orina de color rojo o marrón, aunque esto no tiene trascendencia patológica.

Contraindicaciones:

Enfermedades del sistema nervioso central.

Evitar su administración durante el embarazo (especialmente en el primer trimestre) y durante la lactancia.

Precauciones:

Contraindicado en alergia a nitroimidazoles.

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Debe ser utilizado con precaución en pacientes con discrasias sanguíneas o trastornos del SNC.

Cuando la terapia supera los 10 días, se ha de suspender el tratamiento si aparecen signos de neuropatía periférica o toxicidad sobre el SNC.

Reducir dosis en pacientes con hepatopatías graves.

Por vía rectal el metronidazol se absorbe más lentamente y por tanto no se recomiendan los supositorios en caso de infecciones graves.

Durante el tratamiento debe evitarse beber alcohol ya que puede producirse una reacción antabús.

Interacciones:

El uso simultáneo de metronidazol y disulfiram puede provocar psicosis aguda o confusión mental.

Se han descrito reacciones cuando es administrado con preparaciones farmacéuticas conteniendo alcohol.

Puede potenciar el efecto y la toxicidad de anticoagulantes orales, fenitoína, litio, y 5-fluorouracilo, mientras que su acción y toxicidad puede aumentarse por cimetidina y reducirse por barbitúricos.

Observaciones:

Es termolábil y fotosensible.

Conservación:

En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Gel de metronidazol

Metronidazol 0,75 %
Gel neutro c.s.p. 50 g

Modus operandi:

Preparar el gel neutro, por ejemplo el de Carbopol. En un mortero triturar y humectar el metronidazol con un poco de propilenglicol, e incorporar el gel homogeneizando bien.

Crema de metronidazol

Metronidazol 2 %
Emulsión O/W c.s.p. 100 g

Modus operandi:

La emulsión O/W se puede preparar por ejemplo con Base O/W 1011. En un mortero triturar y humectar el metronidazol con un poco de propilenglicol, e incorporar la base homogeneizando bien.

Cápsulas de metronidazol

Metronidazol 250 mg
para 1 cápsula, nº 90

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Modus operandi:

Se pueden emplear cápsulas del número 2, sin necesidad de excipiente.

Bibliografía:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).
- *Formulación magistral de medicamentos*, COF de Vizkaia, 5ª ed. (2004).
- *Monografías Farmacéuticas*, C.O.F. de Alicante (1998).
- *La Formulación Magistral en la Oficina de Farmacia*, M.ª José Llopis Clavijo y Vicent Baixauli Comes (2007).
- *Formulario Magistral del C.O.F. de Murcia* (1997).