

Ацикловир - инструкция по применению

Торговое название

Ацикловир

Международное непатентованное название

Ацикловир

Лекарственная форма

Таблетки, 200 мг

Состав

Одна таблетка содержит

активное вещество - ацикловир 200 мг,

вспомогательные вещества: повидон, кальция стеарат, крахмал картофельный.

Описание

Таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрические, с риской с одной стороны и фаской.

Фармакотерапевтическая группа

Противовирусные препараты для системного применения. Нуклеозиды и нуклеотиды. Ацикловир.

Код АТХ J05AB01

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Биодоступность ацикловира при приеме 200 мг внутрь составляет 15-30%. Пища значительного влияния на всасывание препарата не оказывает. При назначении ацикловира внутрь в дозе 200 мг 5 раз в сутки максимальная концентрация составляет 0.7 мкг/мл. Связь с белками плазмы – 9-33%. Хорошо проникает в органы и ткани, в том числе в головной мозг, почки, легкие, печень, водянистую влагу, слезную жидкость, кишечник, мышцы, селезенку, грудное молоко, матку, слизистую оболочку и секрет влагалища, сперму, амниотическую жидкость, содержимое герпетических пузырьков. Проходит через гематоэнцефалический барьер; концентрация в

спинномозговой жидкости составляет 50% от таковой в крови. Проникает через плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком. Метаболизируется в печени с образованием 9-карбоксиметоксиметилгуанина. Период полувыведения составляет 3.3 ч. Выводится, в основном, почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции, причем 14% – в неизменном виде. Менее 2% препарата выводится с калом.

У пожилых людей клиренс ацикловира с возрастом снижается параллельно со снижением клиренса креатинина, однако период полувыведения ацикловира изменяется незначительно. У пациентов с хронической почечной недостаточностью период полувыведения ацикловира составлял в среднем 19.5 ч. При проведении гемодиализа средний период полувыведения ацикловира был 5.7 ч, а концентрация ацикловира в плазме снижалась приблизительно на 60%.

Фармакодинамика

Ацикловир – противовирусный препарат, синтетический аналог нуклеозида тимидина. В инфицированных клетках, содержащих вирусную тимидинкиназу, происходит фосфорилирование и превращение в

ацикловира монофосфат. Под влиянием гуанилатциклазы ацикловира монофосфат преобразуется в дифосфат и под действием нескольких клеточных ферментов – в трифосфат. Высокая избирательность действия и низкая токсичность для человека обусловлены отсутствием тимидинкиназы для образования ацикловира трифосфата в интактных клетках макроорганизма. Ацикловира трифосфат, встраиваясь в синтезируемую вирусом ДНК, блокирует размножение вируса. Специфичность и весьма высокая селективность действия также обусловлены преимущественным накоплением препарата в клетках, пораженных вирусом герпеса. Высокоактивен в отношении вирусов Herpes simplex 1 и 2 типа, Varicella zoster, вируса Эпштейна-Барр. Умеренно активен в отношении цитомегаловируса. При герпесе предупреждает образование новых элементов сыпи, снижает вероятность кожной диссеминации и висцеральных осложнений, ускоряет образование корок, снижает боль в острой фазе опоясывающего герпеса. Оказывает иммуностимулирующее действие.

Показания к применению

- лечение герпетической инфекции кожи и слизистых оболочек, вызванных вирусом простого герпеса, включая первичный и рецидивирующий генитальный герпес, в том числе у пациентов с нарушением иммунитета
- лечение инфекций, вызванных вирусами Varicella zoster (ветряная оспа и опоясывающий герпес)
- профилактика рецидивов инфекций, вызванных вирусом Herpes simplex 1 и 2 типа, Varicella zoster у пациентов с нормальным иммунным статусом и с иммунодефицитом

Способ применения и дозы

Ацикловир таблетки можно принимать во время еды, поскольку прием пищи

не нарушает в значительной степени его абсорбцию. Таблетки следует запивать полным стаканом воды.

Взрослые

Лечение инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

Рекомендуемая доза Ацикловира составляет по 200 мг (1 таблетка) 5 раз в сутки каждые 4 часа, за исключением ночного времени. Обычно курс лечения составляет 5 дней, но может быть продлен при тяжелых первичных инфекциях.

В случае выраженного иммунодефицита (например, после трансплантации костного мозга) или при нарушении всасывания из кишечника доза Ацикловира может быть увеличена до 400 мг (2 таблетки) 5 раз в сутки. Лечение необходимо начинать как можно раньше после возникновения инфекции; при рецидивах препарат рекомендуется назначать уже в продромальном периоде или при появлении первых элементов сыпи.

Профилактика рецидивов инфекций, вызванных вирусом простого герпеса с нормальным иммунным статусом

Для профилактики рецидивов инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, рекомендуемая доза Ацикловира составляет по 200 мг 4 раза в сутки (каждые 6 часов).

Многим пациентам подходит более удобная схема терапии по 400 мг 2 раза в сутки (каждые 12 часов).

В ряде случаев оказываются эффективными более низкие дозы Ацикловира по 200 мг 3 раза в сутки (каждые 8 часов) или 2 раза в сутки (каждые 12 часов).

У некоторых пациентов прерывание инфекции может произойти при приеме суммарной суточной дозы 800 мг.

Лечение Ацикловиром следует периодически прерывать на 6-12 месяцев для выявления возможных изменений в течение заболевания.

Профилактика инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса у пациентов с иммунодефицитом

Для профилактики инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса, у пациентов с иммунодефицитом рекомендуемая доза Ацикловира составляет по 200 мг 4 раза в сутки (каждые 6 часов).

В случае выраженного иммунодефицита (например, после трансплантации костного мозга) или при нарушении всасывания из кишечника доза Ацикловира для приема внутрь может быть увеличена до 400

мг 5 раз в сутки. Продолжительность профилактического курса терапии определяется длительностью периода, когда существует риск инфицирования.

Лечение ветряной оспы и опоясывающего герпеса

Для лечения ветряной оспы и опоясывающего герпеса рекомендуемая доза Ацикловира составляет по 800 мг (4 таблетки) 5 раз в сутки; препарат принимают каждые 4 часа, за исключением периода ночного времени. Курс лечения составляет 7 дней.

Препарат следует назначать как можно раньше после начала инфекции, так как в этом случае лечение более эффективно.

Для лечения пациентов с выраженным иммунодефицитом (например, после трансплантации костного мозга) или у пациентов с нарушением всасывания из кишечника предпочтительнее применять ацикловир внутривенно.

Лечение ветряной оспы у иммунокомпетентных пациентов следует начинать в течение 24 часов после появления сыпи.

Дети

Детям младше 6 лет не рекомендуется назначение таблетированных форм препарата.

Дети старше 6 лет

Лечение инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

По 200 мг (1 таблетка) 5 раз в сутки (каждые 4 часа), за исключением периода ночного времени. Курс лечения составляет 5 дней.

В случае выраженного иммунодефицита (например, после трансплантации костного мозга) или при нарушении всасывания из кишечника доза может быть увеличена до 400 мг 5 раз в сутки.

Профилактика инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса у детей с иммунодефицитом

По 200 мг 4 раза в сутки (каждые 6 часов).

В случае выраженного иммунодефицита – по 200 мг 5 раз в сутки.

Лечение ветряной оспы

800 мг, принимаемые 4 раза в сутки.

Более точно дозу можно определить из расчета 20 мг/кг массы тела (но не более 800 мг) 4 раза в сутки. Курс лечения составляет 5 дней.

Профилактика рецидивов инфекций, вызванных вирусом простого герпеса и лечение опоясывающего герпеса у детей с нормальными показателями иммунитета

Данные отсутствуют.

Согласно имеющимся весьма ограниченным сведениям, для лечения детей старше 6 лет с выраженным иммунодефицитом (число клеток CD4+ < 200/мм³, ранние клинические проявления ВИЧ-инфекции и стадия СПИДа) можно применять такие же дозы Ацикловира, как для лечения взрослых.

Пациенты пожилого возраста

В пожилом возрасте происходит снижение клиренса ацикловира в организме параллельно со снижением клиренса креатинина.

Пациенты пожилого возраста должны получать достаточное количество жидкости на фоне приема высоких доз Ацикловира внутрь, при почечной недостаточности у них необходимо решить вопрос о снижении дозы Ацикловира.

Пациенты с почечной недостаточностью

У пациентов с почечной недостаточностью прием Ацикловира внутрь в рекомендуемых дозах с целью лечения и профилактики инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса, не приводит к кумуляции препарата до концентраций, превышающих установленные безопасные уровни. Однако, у пациентов с выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина

менее 10 мл/мин) дозу Ацикловира рекомендуется снижать до 200 мг (1 таблетка) 2 раза в сутки (каждые 12 часов).

При лечении ветряной оспы, опоясывающего герпеса, а также при лечении пациентов с выраженным иммунодефицитом рекомендуемые дозы Ацикловира составляют:

- *тяжелая почечная недостаточность* (клиренс креатинина менее 10 мл/мин): 800 мг (4 таблетки) 2 раза в сутки каждые 12 часов;

- *умеренная почечная недостаточность* (клиренс креатинина 10-25 мл/мин): 800 мг (4 таблетки) 3 раза в сутки каждые 8 часов.

Побочные действия

Очень часто (>1/10), часто (>1/100, <1/10), нечасто (>1/1 000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1 000), очень редко (<1/10 000). Данные побочные явления выражены, в основном, у пациентов с почечной недостаточностью.

Часто

- головная боль, головокружение
- тошнота, рвота, диарея, боли в животе
- зуд, сыпь, в том числе фотосенсибилизация
- быстрая утомляемость, повышение температуры

Нечасто

- крапивница, быстрое диффузное выпадение волос (связь с приемом препарата Ацикловир не доказана, чаще ассоциируется с множественными вариациями течения заболевания и большим количеством применяемых препаратов)

Редко

- одышка
- ангионевротический отек
- обратимое повышение уровня билирубина и активности печеночных ферментов
- повышение концентрации мочевины и креатинина в крови
- анафилаксия

Очень редко

- анемия, лейкопения, тромбоцитопения
- гепатит, желтуха
- острая почечная недостаточность, почечные боли (боль в почках может быть связана с почечной недостаточностью и кристаллурией)
- тревога, смятение, тремор, атаксия, дизартрия, галлюцинации, психотические симптомы, конвульсии, сонливость, энцефалопатия, кома (данные симптомы являются обратимыми и обычно наблюдаются у пациентов с почечной недостаточностью или другими предрасполагающими факторами)

Противопоказания

- повышенная индивидуальная чувствительность к ацикловиру, к валацикловиру, вспомогательным веществам препарата
- детский возраст до 6 лет

Ацикловир следует применять с осторожностью при дегидратации и почечной недостаточности.

Лекарственные взаимодействия

Усиление эффекта отмечается при одновременном назначении иммуностимуляторов.

Отмечалось увеличение в плазме крови площади под фармакокинетической кривой (AUC) для ацикловира и неактивного метаболита микофенолата мофетила, иммунодепрессанта, применяющегося в трансплантологии, при одновременном применении обоих препаратов. Однако коррекции дозы не требуется вследствие широкого диапазона терапевтических доз Ацикловира.

Пробенецид снижает канальцевую секрецию ацикловира, замедляя тем самым его выведение. При назначении ацикловира через 1 ч после приема 1 г пробенецида, период полувыведения ацикловира и площадь под кривой “концентрация в плазме - время” увеличивались на 18 и 40% соответственно. Ацикловир выводится в неизменном виде с мочой путем активной канальцевой секреции. Все препараты с аналогичным путем выведения могут повышать плазменную концентрацию ацикловира. Циметидин, будучи ингибитором микросомального окисления, увеличивает показатель AUC (площадь под кривой “концентрация в плазме - время”) ацикловира, снижает его почечный клиренс и повышает плазменную концентрацию. При одновременном применении ацикловира с нефротоксичными препаратами увеличивается риск развития нефротоксического действия (особенно у пациентов с нарушенной функцией почек). Ацикловир может угнетать метаболизм теофиллина.

При одновременном введении ацикловира и зидовудина ВИЧ-инфицированным пациентам фармакокинетические характеристики обоих препаратов практически не изменялись.

Особые указания

При лечении генитального герпеса следует избегать половых контактов, поскольку ацикловир не предупреждает передачу герпеса половым путем.

В период применения препарата необходимо контролировать функцию почек.

Риск почечной недостаточности повышается при одновременном применении других нефротоксичных лекарственных средств.

Пациенты, принимающие высокие дозы Ацикловира внутрь, должны получать достаточное количество жидкости.

Пожилые пациенты и пациенты с почечной недостаточностью имеют повышенный риск развития неврологических побочных эффектов, эти реакции, как правило, обратимы после прекращения лечения. Длительные

или повторные курсы лечения ацикловиром лиц с ослабленным

иммунитетом может привести к развитию штаммов вируса со сниженной чувствительностью к ацикловиру.

Беременность и период лактации

Анализ лечения Ацикловиром женщин в период беременности не выявил увеличения числа врожденных дефектов у их детей по сравнению с общей популяцией.

Однако, следует соблюдать осторожность при назначении Ацикловира женщинам в период беременности и оценивать предполагаемую пользу для матери и возможный риск для плода.

После приема Ацикловира внутрь в дозе 200 мг (1 таблетка) 5 раз в сутки ацикловир определялся в грудном молоке в концентрациях, составляющих 0,6-4,1 от плазменных концентраций. При таких концентрациях в грудном молоке дети, находящиеся на грудном вскармливании, могут получать ацикловир в дозе до 0,3 мг/кг/сут. Учитывая это, следует прекратить грудное вскармливание.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами или другими механизмами.

Передозировка

Симптомы: нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта (тошнота, рвота), головная боль, спутанность сознания, одышка, диарея, нарушение функции почек, летаргия, судороги, кома.

Лечение: поддержание жизненно важных функций, гемодиализ.

Форма выпуска и упаковка

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.
По 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

3 года

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

РУП «Белмедпрепараты», Республика Беларусь

Юридический адрес и адрес для принятия претензий:

220007, г. Минск, ул. Фабрициуса, 30,

т./ф.: (+375 17) 220 37 16,

e-mail: medic@belmedpreparaty.com.

Наименование и страна владельца регистрационного удостоверения

РУП «Белмедпрепараты», Республики Беларусь

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству продукции:

ТОО «КазБелМедФарм»

Юридический адрес: РК 050028, г. Алматы, ул. Бейсебаева д. 151

Фактический адрес: РК 050022, г. Алматы, ул. Абая 48 А 2 этаж

Номера телефонов/факса: 8(727) 383-93-74; 383-93-69

Электронный адрес: info@kmbf.kz