

Состав

действующее вещество: aciclovir;

1 таблетка содержит ацикловира 200 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, моногидрат; целлюлоза микрокристаллическая; натрия крахмалгликолят (тип А); повидон; магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого или почти белого цвета, круглой формы, с двояковыпуклой поверхностью и риской с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Противовирусные средства для системного применения. Противовирусные средства прямого действия. Ацикловир. Код АТХ J05A B01.

Фармакодинамика

Ацикловир является синтетическим аналогом пуринового нуклеозида с ингибиторной активностью *in vivo* и *in vitro* относительно вируса герпеса человека, который включает вирус простого герпеса I и II типа, вирус ветряной оспы и опоясывающего герпеса, вирус Эпштейна-Барр и цитомегаловирус. В культуре клеток ацикловир оказывает наибольшую активность против вируса простого герпеса I типа и далее, по мере уменьшения активности, против вируса простого герпеса II типа, вируса ветряной оспы и опоясывающего герпеса, вируса Эпштейна-Барр и цитомегаловируса.

Ингибиторная активность ацикловира против вышеупомянутых вирусов является высокоселективной. Фермент тимидинкиназа в нормальной неинфицированной клетке не использует ацикловир в качестве субстрата, поэтому токсическое действие относительно клеток организма-хозяина минимальное. Тем не менее тимидинкиназа, закодированная в вирусах простого герпеса, вирусах ветряной оспы, опоясывающего герпеса и вирусах Эпштейна-Барр, превращает ацикловир на монофосфат ацикловира – аналог нуклеозида, который потом превращается последовательно на дифосфат и трифосфат с помощью ферментов клетки. След

за встраиванием в вирусную ДНК ацикловира трифосфат взаимодействует с вирусной ДНК-полимеразой, результатом чего является прекращение синтеза цепи вирусной ДНК.

При длительных или повторных курсах лечения тяжелых больных со сниженным иммунитетом возможны случаи уменьшенной чувствительности отдельных штаммов вируса, которые не всегда отвечают на лечение ацикловиром.

Большинство клинических случаев нечувствительности связаны с дефицитом вирусной тимидинкиназы, однако существуют сообщения о повреждении вирусной тимидинкиназы и ДНК. *In vitro* взаимодействие отдельных вирусов простого герпеса с ацикловиром может также приводить к формированию менее чувствительных штаммов. Взаимозависимость между чувствительностью отдельных вирусов простого герпеса *in vitro* и клиническими результатами лечения ацикловиром до конца не выяснена.

Применение ацикловира вместе с антиретровирусными препаратами уменьшает летальность больных с развитой стадией ВИЧ-инфекции, а также, при условии предыдущего применения в течение 1 месяца ацикловира для внутривенного введения, уменьшает летальность больных после трансплантации костного мозга.

Фармакокинетика

Ацикловир только частично абсорбируется в кишечнике. Средняя пиковая стабильная концентрация (C_{ssmax}) в плазме крови после приема дозы 200 мг с 4-часовым интервалом составляет 3,1 мкмоль (0,7 мкг/мл), а уровень в плазме крови (C_{ssmin}) – 1,8 мкмоль (0,4 мкг/мл). Соответствующие уровни C_{ssmax} после доз 400 мг и 800 мг с 4-часовым интервалом составляют 5,3 мкмоль (1,2 мкг/мл) и 8 мкмоль (1,8 мкг/мл), а соответствующие уровни C_{ssmin} были 2,7 мкмоль (0,6 мкг/мл) и 4 мкмоль (0,9 мкг/мл).

У взрослых конечный период полувыведения при внутривенном введении ацикловира составляет приблизительно 2,9 часа. Большинство препарата выводится в неизменном виде почками. Почечный клиренс ацикловира существенно выше клиренса креатинина, что указывает на то, что выведение препарата почками осуществляется путем не только гломерулярной фильтрации, а и тубулярной секреции.

9-карбоксиметоксиметилгуанин является единственным важным метаболитом ацикловира, который может быть определен в моче, и составляет приблизительно 10-15 % применяемой дозы. Если ацикловир применяется через 1 час после приема 1 г пробенецида, конечный период полувыведения и площадь

под кривой «концентрация/время» увеличиваются на 18 % и 40 % соответственно.

У больных с хронической почечной недостаточностью средний конечный период полувыведения составляет 19,5 часа. Средний период полувыведения ацикловира во время гемодиализа составляет 5,7 часа. Уровень ацикловира в плазме крови во время диализа снижается приблизительно на 60 %.

Концентрация препарата в цереброспинальной жидкости составляет приблизительно 50 % соответствующей концентрации в плазме крови. Уровень связывания с белками плазмы крови относительно низкий (от 9 до 33 %), и при взаимодействии с другими лекарственными средствами он не изменяется.

При одновременном применении ацикловира и зидовудина для лечения ВИЧ-инфицированных больных не было выявлены никаких изменений фармакокинетики этих препаратов.

Показания

1. Лечение вирусных инфекций кожи и слизистых оболочек, вызванных вирусом простого герпеса, включая первичный и рецидивирующий генитальный герпес.
2. Супрессия (профилактика рецидивов) инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, у больных с нормальным иммунитетом.
3. Профилактика инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, у больных с иммунодефицитом.
4. Лечение инфекций, вызванных вирусом *Varicella zoster* (ветряная оспа и опоясывающий герпес).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к ацикловиру, валацикловиру или к другим компонентам препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Клинически важного взаимодействия ацикловира с другими лекарственными средствами не было выявлено.

Ацикловир выделяется главным образом в неизменном виде почками путем канальцевой секреции, поэтому любые лекарственные средства, имеющие аналогичный механизм выделения, могут увеличивать концентрацию ацикловира

в плазме крови. Пробенецид и циметидин удлиняют период полувыведения ацикловира и площадь под кривой «концентрация/время». При одновременном применении с иммуносупрессаном мофетила микофенолатом при лечении больных после трансплантации органов также повышается в плазме крови уровень ацикловира и неактивного метаболита мофетила микофенолата, но вследствие широкого терапевтического индекса ацикловира корректировать дозу не нужно.

Особенности применения

Ацикловир выводится из организма главным образом путем почечного клиренса, поэтому больным с почечной недостаточностью дозу нужно уменьшать (см. «Способ применения и дозы»). У больных пожилого возраста также большая вероятность нарушения функции почек, поэтому для этой группы пациентов тоже может быть необходимым уменьшение дозы. Обе эти группы (больные с почечной недостаточностью и больные пожилого возраста) являются группами риска возникновения неврологических побочных реакций и потому должны находиться под тщательным контролем для выявления этих побочных реакций. По полученным данным, такие реакции являются вообще обратными при прекращении лечения препаратом.

Нужно обращать особое внимание на поддержку адекватного уровня гидратации больных, получающих высокие дозы ацикловира.

Препарат содержит лактозу, поэтому его не следует применять пациентам с наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

При решении вопроса о возможности управления автомобилем и другими механизмами нужно принимать во внимание клинический статус пациента и профиль побочных действий препарата. Клинических исследований влияния ацикловира на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами не проводилось. Кроме того, фармакология ацикловира не дает оснований ожидать какого-либо отрицательного влияния.

Применение в период беременности или кормления грудью

Не выявлено увеличения количества врожденных пороков у детей, матери которых применяли ацикловир в период беременности. Однако применять

таблетки ацикловира нужно тогда, когда потенциальная польза препарата для матери превышает возможный риск для плода.

При пероральном приеме 200 мг ацикловира 5 раз в сутки ацикловир проникает в грудное молоко. Поэтому назначать ацикловир женщинам, кормящим грудью, нужно с осторожностью, с учетом соотношения риск/польза.

Способ применения и дозы

Таблетку нужно глотать целой, запивая водой. При применении высоких доз ацикловира нужно поддерживать адекватный уровень гидратации организма.

Взрослые

Лечение инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

Для лечения инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, необходимо принимать таблетки Ацикловир-Астрафарм в дозе 200 мг 5 раз в сутки с приблизительно 4-часовым интервалом, за исключением ночного периода.

Лечение должно длиться 5 дней, но в случае тяжелой первичной инфекции оно может быть продолжено.

Для больных с тяжелым иммунодефицитом (например, после трансплантации костного мозга) или для больных со сниженной абсорбцией в кишечнике дозу можно удвоить до 400 мг или применять соответствующую дозу для внутривенного введения.

Лечение нужно начинать как можно раньше после начала развития инфекции. В случае рецидивирующего герпеса лучше всего начинать лечение в продромальный период или после появления первых признаков поражения кожи.

Профилактика рецидивов (супрессивная терапия) инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

У больных с нормальным иммунитетом для предотвращения рецидивов инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, таблетки Ацикловир-Астрафарм в дозе 200 мг принимают 4 раза в сутки с 6-часовым интервалом.

Для удобства большинство пациентов могут принимать 400 мг препарата 2 раза в сутки с 12-часовым интервалом.

Лечение будет эффективным даже после уменьшения дозы таблетированного препарата Ацикловир-Астрафарм до 200 мг, которую принимают 3 раза в сутки с

8-часовым интервалом или даже 2 раза в сутки с 12-часовым интервалом.

У некоторых больных радикальное улучшение наблюдается после приема суточной дозы препарата Ацикловира-Астрафарм 800 мг.

Для наблюдения за возможными изменениями естественного течения заболевания терапию ацикловиром нужно периодически прерывать с интервалом 6-12 месяцев.

Профилактика инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

Для профилактики инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, больным с иммунодефицитом таблетки препарата Ацикловир-Астрафарм в дозе 200 мг нужно принимать 4 раза в сутки с 6-часовым интервалом. Для больных со значительным иммунодефицитом (например, после трансплантации костного мозга) или для больных со сниженной абсорбцией в кишечнике дозу можно удвоить до 400 мг или применять соответствующую дозу для внутривенного введения.

Продолжительность профилактики зависит от длительности периода риска.

Лечение ветряной оспы и опоясывающего герпеса

Для лечения инфекций, вызванных вирусами ветряной оспы и опоясывающего герпеса, нужно принимать таблетки Ацикловир-Астрафарм в дозе 800 мг 5 раз в сутки с 4-часовым интервалом, за исключением ночного периода. Лечение должно длиться 7 суток.

Больным с тяжелым иммунодефицитом (например, после трансплантации костного мозга) или больным со сниженной абсорбцией в кишечнике лучше применять внутривенное введение.

Лечение нужно начинать как можно раньше после начала заболевания, результат будет лучше, если лечение начать сразу же после появления высыпаний.

Дети

Для лечения и профилактики инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, детям с иммунодефицитом с 2 лет можно применять дозы как для взрослых.

Для лечения ветряной оспы у детей с 6 лет назначают 800 мг ацикловира 4 раза в сутки, дети с 2 до 6 лет могут получать 400 мг ацикловира 4 раза в сутки. Продолжительность лечения составляет 5 дней.

Более точно дозу препарата можно рассчитать по массе тела ребенка – 20 мг/кг массы тела в сутки (не превышать 800 мг), которую распределяют на 4 приема.

Специальных данных относительно применения ацикловира для профилактики (предотвращение рецидивов) инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, или для лечения инфекций, вызванных вирусом опоясывающего герпеса, у детей с нормальным иммунитетом нет.

Детям до 2 лет данную лекарственную форму препарата не применяют.

Пациенты пожилого возраста

Нужно иметь в виду возможность нарушения функции почек у больных пожилого возраста, и дозу препарата для них нужно соответственно изменить (см. раздел Почечная недостаточность). Необходимо поддерживать адекватный уровень гидратации организма.

Почечная недостаточность

Ацикловир нужно с осторожностью назначать больным с почечной недостаточностью. Необходимо поддерживать адекватный уровень гидратации организма.

При профилактике и лечении инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, у больных с почечной недостаточностью рекомендованные пероральные дозы не приводят к накоплению ацикловира, уровень которого превышал бы безопасный уровень, установленный для внутривенного введения. Тем не менее для больных с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина < 10 мл/мин) рекомендуется установить дозу 200 мг 2 раза в сутки с интервалом приблизительно 12 часов.

При лечении инфекций, вызванных вирусом *Varicella zoster* (ветряная оспа и опоясывающий герпес) для больных со значительно сниженным иммунитетом рекомендуется при тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина < 10 мл/мин) установить дозу 800 мг 2 раза в сутки с приблизительно 12-часовым интервалом, а для больных с умеренной почечной недостаточностью (клиренс креатинина в пределах 10-25 мл/мин) – 800 мг 3 раза в сутки с интервалом приблизительно 8 ч.

Дети

Препарат в данной лекарственной форме не применяют детям до 2 лет.

Передозировка

Симптомы: при случайной повторной передозировке перорального ацикловира в течение нескольких дней возникают гастроэнтерологические (такие как тошнота и рвота) и неврологические симптомы (головная боль и спутанность сознания).

Неврологическими проявлениями передозировки могут быть спутанность сознания, галлюцинации, возбуждение, судороги и кома.

Лечение: больного нужно тщательно обследовать для выявления симптомов интоксикации. Рекомендуется промывание желудка, симптоматическое лечение. В связи с тем, что уровень ацикловира в крови хорошо элиминируется с помощью гемодиализа, его нужно применять в случае передозировки.

Побочные реакции

Со стороны системы крови: анемия, тромбоцитопения, лейкопения.

Со стороны иммунной системы: анафилаксия.

Со стороны центральной нервной системы: головная боль, головокружение, возбужденность, спутанность сознания, тремор, атаксия, дизартрия, галлюцинации, психотические симптомы, судороги, сонливость, энцефалопатия, кома.

Вышеприведенные неврологические реакции являются вообще обратными и обычно возникают при применении больным с почечной недостаточностью или другими факторами риска.

Со стороны дыхательной системы: одышка.

Со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота, диарея, боль в животе.

Со стороны гепатобилиарной системы: обратное повышение уровня билирубина и печеночных ферментов, желтуха, гепатит.

Со стороны кожи: зуд, высыпания (включая светочувствительность), крапивница, ускоренное диффузное выпадение волос (поскольку выпадение волос может быть связано с большим количеством болезней и принимаемых пациентом лекарственных средств, четкой связи с ацикловиром выявлено не было); ангионевротический отек.

Со стороны мочевыделительной системы: увеличение уровня мочевины и креатинина крови, острая почечная недостаточность, боль в почках.

Боль в почках может ассоциироваться с почечной недостаточностью и кристаллурией.

Общие расстройства: повышенная утомляемость, лихорадка.

Срок годности

5 лет.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере; по 2 блистера в коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ООО «АСТРАФАРМ».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 08132, Киевская обл., Киево-Святошинский р-н, г. Вишневое, ул. Киевская, 6.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).