Состав

действующее вещество: ацикловир;

1 таблетка содержит ацикловир эквивалентно ацикловира безводной 400 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, магния стеарат для таблеток по 400 мг - эритрозин (Е 127), для таблеток по 800 мг - краситель индиго (Е 132).

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: розовые круглые плоские таблетки с насечкой с одной стороны диаметром примерно 12,7 мм (допускаются белые вкрапления).

Фармакотерапевтическая группа

Противовирусные средства для системного применения.

Код АТХ J05A B01.

Фармакодинамика

Ацикловир является синтетическим аналогом пуринового нуклеозида с ингибиторной активностью in vivo и in vitro в отношении вируса герпеса человека, включая вирус простого герпеса I и II типа, вирус ветряной оспы и опоясывающего герпеса, вирус Эпштейна-Барра и цитомегаловирус. В культуре клеток ацикловир проявляет наибольшую активность против вируса простого герпеса I типа и далее, с уменьшением активности, против вируса простого герпеса II типа, вируса ветряной оспы и опоясывающего герпеса, вируса Эпштейна-Барра и цитомегаловируса.

Ингибиторная активность ацикловира против вышеупомянутых вирусов является высокоселективной. Фермент тимидинкиназа в нормальной неинфицированной клетке не использует ацикловир как субстрат, поэтому токсическое действие в отношении клеток организма-хозяина минимальна. Однако тимидинкиназа, закодированная в вирусах простого герпеса, вирус ветряной оспы, опоясывающего герпеса и вирусом Эпштейна-Барра, превращает ацикловир в монофосфат ацикловира - аналог нуклеозида, который затем превращается последовательно на дифосфат и трифосфат с помощью ферментов клетки. Вслед

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

При длительных или повторных курсах лечения тяжелых больных со сниженным иммунитетом возможно уменьшение чувствительности отдельных штаммов вируса, которые не всегда отвечают на лечение ацикловиром. Большинство клинических случаев нечувствительности связанные с дефицитом вирусной тимидинкиназы, однако есть 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.

Фармакокинетика

Ацикловир только частично абсорбируется в кишечнике. Средняя пиковая стабильная концентрация (Cssmax) в плазме крови после приема дозы 200 мг с 4-часовым интервалом составляет 3,1 мкмоль (0,7 мкг / мл), соответственно уровень в плазме крови (Cssmin) будет 1,8 мкмоль (0, 4 мкг / мл). Соответствующие Cssmax уровне 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) и эквивалентные Cssmin уровне были 2,7 мкмоль (0 6 мкг / мл) и 4 мкмоль (0,9 мкг / мл).

У взрослых конечный период полувыведения при внутривенно введении ацикловира составляет примерно 2,9 часа. Большинство выводится в неизмененном виде почками. Почечный клиренс ацикловира существенно выше клиренс креатинина, что указывает на то, что выведение препарата почками осуществляется путем не только клубочковой фильтрации, а и канальцевой секреции.

9 карбоксиметоксиметилгуанин является единственным важным метаболитом ацикловира, который может быть определен в моче, и составляет примерно 10-15% дозы. Если ацикловир применять через 1 час после приема 1 г пробенецида, конечный период полувыведения (t1 / 2) и площадь под кривой «концентрация / время» (AUC) увеличиваются на 18% и 40% соответственно.

У больных с хронической почечной недостаточностью средний конечный уровень полувыведения составляет 19,5 часа. Средний уровень полувыведения ацикловира во время гемодиализа составляет 5,7 часа. Уровень ацикловира в

плазме крови во время диализа снижается примерно на 60%.

Концентрация в цереброспинальной жидкости составляет примерно 50% от соответствующей концентрации в плазме. Уровень связывания с белками плазмы относительно низкий (от 9 до 33%) и при взаимодействии с другими лекарственными средствами не меняется.

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

Показания

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

Противопоказания

Повышенная чувствительность к ацикловиру, валацикловиру или другим компонентам препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Клинически важного взаимодействия ацикловира с другими лекарственными средствами не выявлено.

Ацикловир выделяется главным образом в неизмененном виде почками путем канальцевой секреции, поэтому любые препараты, имеющие аналогичный механизм выделения, могут увеличивать концентрацию ацикловира в плазме. Пробенецид и циметидин увеличивают t1 / 2 ацикловира и AUC. При одновременном применении с иммуносупрессантами у больных после трансплантации органов также повышается уровень ацикловира и неактивного метаболита иммуносупрессивного препарата в плазме, но, учитывая широкий терапевтический индекс ацикловира, корректировать дозы.

Экспериментальное исследование пяти мужчин указывает на то, что сопутствующая терапия ацикловиром увеличивает AUC полностью введенного теофиллина примерно на 50%. Рекомендуется измерять концентрацию в плазме при одновременной терапии ацикловиром.

Особенности применения

Ацикловир выводится из организма главным образом путем почечного клиренса, поэтому больным с почечной недостаточностью дозу следует уменьшать (см. Раздел «Способ применения и дозы»). У больных пожилого возраста также большая вероятность нарушения функции почек, поэтому для этой группы пациентов тоже может потребоваться уменьшение дозы. Обе эти группы (больные с почечной недостаточностью и пациенты пожилого возраста) являются группами риска возникновения неврологических побочных реакций, поэтому должны находиться под пристальным контролем для выявления таких побочных реакций. По полученным данным, такие реакции является в общем оборотными в случае прекращения лечения (см. Раздел «Побочные реакции»). Длительные или повторные курсы лечения ацикловиром лиц с очень ослабленным иммунитетом могут привести к выделению вирусных штаммов с пониженной чувствительностью, которые могут не отвечать на длительное лечение ацикловиром.

Следует обращать особое внимание на поддержание адекватного уровня гидратации больных, получающих высокие дозы ацикловира.

Риск поражения почек увеличивается при одновременном применении с другими нефротоксичными препаратами.

Имеющиеся данные клинических исследований недостаточны для того, чтобы сделать вывод, что лечение ацикловиром снижает частоту осложнений, связанных с ветряной оспой, в иммунокомпетентных пациентов.

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

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

При решении вопроса о возможности управления автомобилем и другими механизмами следует 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 каких негативное влияние.

Применение в период беременности или кормления грудью

В пострегистрационный реестре наблюдения за беременными задокументировано результаты применения беременным различных фармацевтических форм ацикловира. Не выявлено увеличение количества врожденных пороков у детей, матери которых применяли ацикловир во время беременности, по сравнению с общей популяцией.

При пероральном приеме 200 мг ацикловира 5 раз в день ацикловир проникает в грудное молоко в концентрациях, составляющих 0,6-4,1% от соответствующего уровня ацикловира в плазме крови. Ребенок, которого кормят таким молоком, потенциально может усвоить ацикловир в дозе до 0,3 мг / кг массы тела в сутки. Поэтому назначать ацикловир кормящим грудью, нужно с осторожностью, учитывая соотношение риск / польза.

Информация о влиянии ацикловира на женскую фертильность отсутствует.

В исследовании 20 пациентов мужского пола с нормальным числом сперматозоидов при пероральном применении в дозе до 1 г в сутки в течение шести месяцев не было выявлено клинически значимого влияния на количество сперматозоидов, моторику или морфологию.

Способ применения и дозы

Таблетки следует принимать целиком, запивая водой. Для достижения необходимой дозировки применяют таблетки с соответствующим содержанием действующего вещества. При применении высоких доз ацикловира следует поддерживать адекватный уровень гидратации организма.

Взрослые

Лечение инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

Для лечения инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, необходимо принимать ацикловир в дозе 200 мг 5 раз в день с приблизительно 4-часовым интервалом, за исключением ночного времени суток.

Лечение должно продолжаться 5 дней, но в случае тяжелой первичной инфекции оно может быть продлено.

У больных с тяжелым иммунодефицитом (например, после трансплантации костного мозга) или у больных со сниженной абсорбцией ацикловира 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, ацикловир в дозе 200 мг следует принимать 4 раза в сутки с приблизительно 6-часовым интервалом.

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

Лечение будет эффективным даже после уменьшения дозы таблетированного ацикловира до 200 мг, которые следует принимать пациентам 3 раза в сутки с 8-часовым интервалом или даже 2 раза в сутки с 12-часовым интервалом.

У некоторых больных значительное улучшение наблюдается после приема суточной дозы ацикловира 800 мг.

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

Профилактика инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

Для профилактики инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, у больных с иммунодефицитом таблетки ацикловира 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 у больных со сниженной абсорбцией в кишечнике дозу можно удвоить до 400 мг или применять соответствующую дозу для внутривенного введения.

Продолжительность профилактики зависит от продолжительности периода риска.

Лечение ветряной оспы и опоясывающего герпеса

Для лечения инфекций, вызванных вирусами ветряной оспы и опоясывающего герпеса, нужно принимать таблетки Медовир в дозе 800 мг 5 раз в день с 4-часовым интервалом, за исключением ночного времени суток. Лечение должно продолжаться 7 дней.

Больным с тяжелым иммунодефицитом (например, после трансплантации костного мозга) или больным с пониженной 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 в возрасте от 2 лет с иммунодефицитом можно применять дозы как для взрослых.

Для лечения ветряной оспы у детей старше 6 лет следует назначать 800 мг Медовир 4 раза в сутки, детям в возрасте от 2 до 6 лет можно назначать 400 мг Медовир 4 раза в день. Продолжительность лечения составляет 5 дней.

Точнее дозу рассчитывают по массе тела ребенка - 20 мг / кг массы тела в сутки (превышать 800 мг) Медовир, разделенную на 4 приема.

Специальных данных по применению Медовир для профилактики (предотвращения 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 применять.

Пациенты пожилого возраста

Следует иметь в виду возможность нарушения функции почек у пациентов пожилого возраста дозу препарата для них нужно соответственно изменить (см. «Почечная недостаточность»). Необходимо поддерживать адекватный уровень гидратации организма.

Почечная недостаточность

Медовир следует с осторожностью назначать больным с почечной недостаточностью. Необходимо поддерживать адекватный уровень гидратации организма.

Для профилактики и лечения 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 внутривенно введения. Однако у больных с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 10 мл / мин) рекомендуется установить дозу 200 мг 2 раза в сутки с интервалом примерно 12 часов.

Для лечения инфекций, вызванных вирусами Varicella zoster (ветряная оспа и опоясывающий герпес), у больных со значительно сниженным иммунитетом рекомендуется при тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 10 мл / мин) установить дозу 800 мг 2 раза в сутки с примерно 12-часовым интервалом , а у больных с умеренной почечной недостаточностью (клиренс креатинина в пределах 10-25 мл / мин) - 800 мг 3 раза в сутки с интервалом примерно 8 часов.

Дети

Таблетки Медовир можно применять детям в возрасте от 2 лет.

Передозировка

Симптомы. Ацикловир только частично абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Имеющиеся данные о случайном прием пациентами до 20 г ацикловира без возникновения токсического эффекта. При случайном повторном передозировке приема ацикловира в течение нескольких дней возникают гастроэнтерологические (такие как тошнота и рвота) и неврологические симптомы (головная боль и спутанность сознания).

При передозировке ацикловира, что вводили внутривенно, появляется почечная недостаточность, которая проявляется повышением уровня креатинина сыворотки крови, азота мочевины крови. Неврологическими проявлениями передозировки могут быть спутанность сознания, галлюцинации, возбуждение, судороги и кома.

Лечение. Больного нужно тщательно обследовать для выявления симптомов интоксикации. Поскольку ацикловир из крови хорошо выводится с помощью гемодиализа, последний следует применять в случае передозировки.

Побочные реакции

Со стороны крови и лимфатической системы: очень редко - анемия, тромбоцитопения, лейкопения.

Со стороны иммунной системы: редко - анафилаксия.

Психические расстройства и расстройства со стороны нервной системы: часто - головная боль, головокружение очень редко - возбуждение, спутанность сознания, тремор, атаксия, дизартрия, галлюцинации, психотические симптомы, судороги, сонливость, энцефалопатия, кома.

Вышеприведенные неврологические реакции является в общем обратимыми и обычно возникают у больных с почечной недостаточностью или другими факторами риска (см. Раздел «Особенности применения»).

Со стороны респираторной системы и органов грудной клетки: редко - одышка.

Со стороны гастроэнтерологической системы: часто - тошнота, рвота, диарея, боль в животе.

Со стороны пищеварительной системы: редко - обратимое повышение уровня билирубина и печеночных ферментов очень редко - желтуха, гепатит.

Со стороны кожи и подкожных тканей: часто - зуд, сыпь (включая светочувствительность) нечасто - крапивница, учащенное диффузное выпадение волос; редко - ангионевротический отек. Поскольку выпадение волос может быть связано с большим количеством болезней и лекарств, четкой связи с ацикловиром не выявлено.

Со стороны почек и мочевыделительной системы: редко - повышение уровня мочевины и креатинина крови очень редко - острая почечная недостаточность, боль в почках. Боль в почках может быть ассоциирован с почечной недостаточностью и кристаллурия.

Общие нарушения: часто - утомляемость, лихорадка.

Сообщение о подозреваемых побочные реакции

Сообщение о подозреваемых побочные реакции после регистрации лекарственного средства важны. Они позволяют проводить непрерывный мониторинг соотношения польза / риск по препарата. Медицинские работники должны сообщать о любых подозреваемые побочные реакции.

В случае возникновения побочных реакции и вопросов безопасности применения лекарственного средства обращайтесь через форму обратной связи сайта: www.ukraine.medochemie.com

Срок годности

5 лет.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° С в оригинальной упаковке в недоступном для детей месте.

Несовместимость. Данных нет.

Упаковка

10 таблеток по 400 мг в блистере. По 1 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Медокеми ЛТД (Центральный Завод).

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

1-10 ул. Константинуполес, Лимассол, 3011, Кипр

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.