

## Абакавир Канон



### Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Абакавир](#)

### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)  
[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>  
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

#### Форма выпуска, описание и состав

**Таблетки, покрытые пленочной оболочкой** желтого цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской; на поперечном разрезе - белого или почти белого цвета.

	<b>1 таб.</b>
абакавира сульфат	702.8 мг,
что соответствует содержанию абакавира	600 мг

Вспомогательные вещества: карбоксиметилкрахмал натрия - 58 мг, кремния диоксид коллоидный - 11 мг, магния стеарат - 11 мг, повидон К-30 - 46 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 391.2 мг.

**Состав пленочной оболочки:** Опадрай II желтый - 38 мг, в том числе: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) - 12.92 мг, лактозы моногидрат - 10.64 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) - 4.56 мг, титана диоксид - 7.98 мг, краситель железа оксид желтый - 1.9 мг.

- 10 шт. - упаковки ячейковые контурные (алюминий/ПВХ) (3) - пачки картонные.
- 10 шт. - упаковки ячейковые контурные (алюминий/ПВХ) (6) - пачки картонные.
- 10 шт. - упаковки ячейковые контурные (алюминий/ПВХ) (9) - пачки картонные.
- 30 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
- 60 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
- 90 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

### Фармакологические свойства:

#### Фармакодинамика

Противовирусное средство, синтетический карбоциклический аналог нуклеозидов. Внутри клетки абакавир превращается при участии клеточных ферментов в активный метаболит карбовир трифосфат. Карбовир трифосфат является аналогом деоксигуанозин-5'-трифосфата (дГТФ). Карбовир трифосфат ингибирует активность ВИЧ-1 обратной транскриптазы, что обусловлено конкуренцией с естественным субстратом дГТФ и нарушением его встраивания в вирусную ДНК. Потеря 3'-ОН группы во встроенном аналоге нуклеозида предотвращает формирование 5'- и 3'-фосфорноэфирных связей, необходимых для элонгации цепочки ДНК. В результате этого прекращается рост вирусной ДНК.

#### Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбция высокая, биодоступность - 83%.  $C_{max}$  - 3 мкг/мл,  $T_{max}$  - 1-1.5 ч. AUC (в течение 12 ч после приема) - 6 мкг/мл/ч. Пища замедляет всасывание абакавира и снижает  $C_{max}$ , но не влияет на AUC. Проникает через ГЭБ, концентрация абакавира в спинномозговой жидкости составляет 30-44% от таковой в плазме. Связывание с белками плазмы низкое. Метаболизируется в печени с участием ацетальдегидрогеназы и образованием глюкуронидных конъюгатов (5'-карбоновая кислота и 5'-глюкуронид).  $T_{1/2}$  - 1.5 ч. Выводится почками - 83% в виде метаболитов и 2% в неизмененном виде; остальная часть выводится через кишечник. Не кумулирует.

## Показания к применению:

Лечение ВИЧ-инфекции (в составе комбинированной терапии).

## Относится к болезням:

- [ВИЧ-инфекция](#)
- [Инфекции](#)

## Противопоказания:

Нарушения функции печени умеренной и тяжелой степени; детский возраст младше 3 месяцев и масса тела менее 14 кг; повышенная чувствительность к абакавиру.

## Способ применения и дозы:

В комбинации с другими противовирусными средствами внутрь взрослым по 300 мг 2 раза/сут, детям в возрасте от 3 месяцев до 16 лет - по 8 мг/кг 2 раза/сут.

## Побочное действие:

*Со стороны кожи и придатков кожи:* сыпь (обычно макуло-папулезная или уртикарная); очень редко - многоформная экссудативная эритема, включая синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз.

*Со стороны пищеварительной системы:* потеря аппетита, тошнота, рвота, диарея, боль в животе, изъязвление слизистой оболочки рта, повышение активности ферментов печени, печеночная недостаточность.

*Со стороны дыхательной системы:* одышка, кашель, боль в горле, респираторный дистресс-синдром взрослых, дыхательная недостаточность.

*Со стороны нервной системы:* головная боль, парестезии, сонливость.

*Со стороны системы кроветворения и лимфатической системы:* лимфопения.

*о стороны мочевыделительной системы:* повышение концентрации креатинина в сыворотке, почечная недостаточность.

*Со стороны костно-мышечной системы:* часто - гиперлактатемия; редко - лактацидоз, накопление/перераспределение жировой ткани, миалгии, рабдомиолиз, артралгии, повышение активности КФК.

*Прочие:* лихорадка, чувство усталости, недомогание, отеки, лимфаденопатия, артериальная гипотензия, конъюнктивит, анафилактические реакции.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и хорошо контролируемых клинических исследований безопасности применения абакавира при беременности и в период лактации не проведено.

При необходимости применения при беременности следует взвесить ожидаемую пользу терапии для матери и потенциальный риск для плода.

Неизвестно, выделяется ли абакавир с грудным молоком. При необходимости применения в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

По данным фармакокинетических исследований, применение абакавира в дозе 600 мг 2 раза/сут в комбинации с метадонном снижает  $C_{max}$  абакавира в сыворотке на 35%, увеличивает время достижения  $C_{max}$  в сыворотке на 1 ч, но не изменяет AUC. Клиническая значимость этих изменений невелика. В этом же исследовании установлено, что абакавир повышает системный клиренс метадона на 22%. В большинстве случаев эти изменения также расцениваются как клинически незначимые, однако в определенных ситуациях может потребоваться изменение дозы метадона.

Ретиноиды, например изотретиноин, элиминируются с участием алкогольдегидрогеназы, поэтому могут вступать во взаимодействие с абакавиром, однако в настоящее время специальных исследований не проводилось.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

Симптомы повышенной чувствительности могут появиться в любое время после начала лечения абакавиром, однако чаще всего они возникают в течение первых 6 недель.

Если при развитии реакции гиперчувствительности пациенты продолжают принимать абакавир, то клинические проявления становятся более выраженными и могут принимать угрожающий жизни характер. В большинстве случаев симптомы исчезают при прекращении приема абакавира.

Имеются сообщения о развитии лактацидоза, гепатомегалии и жировой дистрофии печени, в т.ч. с летальным исходом, вследствие антиретровирусной терапии аналогами нуклеозидов, включая абакавир, ламивудин и зидовудин, принимаемых как по отдельности, так и в комбинации. В большинстве случаев эти осложнения возникают у женщин.

Симптомы, указывающие на лактацидоз, включают общую слабость, снижение аппетита, быстрое похудание неясной этиологии, нарушения со стороны ЖКТ и нарушения со стороны дыхательной системы (одышка и тахипноэ).

Применение абакавира у любого пациента требует осторожности, особенно при наличии факторов риска поражения печени. При появлении клинических или лабораторных признаков лактацидоза или гепатотоксичности (может проявляться гепатомегалией и жировой дистрофией печени даже в отсутствие выраженного повышения активности aminotransferаз) лечение абакавиром необходимо прекратить.

Комбинированная антиретровирусная терапия может сопровождаться развитием синдрома липодистрофии. При клиническом обследовании пациентов в период лечения необходимо обращать внимание на перераспределение подкожно-жировой клетчатки. Лабораторное обследование должно включать определение концентрации липидов в сыворотке и концентрации глюкозы в крови. При нарушении липидного обмена назначают соответствующее лечение.

При наличии у ВИЧ-инфицированных пациентов с тяжелым иммунодефицитом бессимптомных или малосимптомных оппортунистических инфекций на момент начала антиретровирусной терапии (АРТ) проведение такой терапии может привести к усилению симптоматики оппортунистических инфекций или другим тяжелым последствиям. Обычно эти реакции возникают в течение первых недель или месяцев после начала АРТ. Типичными примерами являются цитомегаловирусный ретинит, генерализованная или очаговая инфекция, вызванная микобактериями, и пневмония, вызванная *Pneumocystis jirovecii* (ранее *P. carinii*). Появление любых симптомов воспаления требует немедленного обследования и, при необходимости, лечения.

Применение абакавира не исключает возможности развития оппортунистических инфекций или других осложнений ВИЧ-инфекции, поэтому пациенты должны оставаться под наблюдением врача, имеющего опыт лечения этих заболеваний.

С осторожностью следует назначать антиретровирусную терапию, включая препараты, содержащие абакавир, пациентам с возможным риском возникновения ИБС. Необходимо принятие всех мер для минимизации всех модифицируемых факторов риска (таких как артериальная гипертензия, дислипидемия, сахарный диабет и курение).

**Источник:** [http://drugs.thead.ru/Abakavir\\_Kanon](http://drugs.thead.ru/Abakavir_Kanon)