

Ацикловир-АКОС



Код АТХ:

- [J05AB01](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Ацикловир](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской и риской.

	1 таб.
ацикловир	200 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, тальк, крахмал картофельный.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противовирусное (антигерпетическое) средство - синтетический аналог пуринового нуклеозида, который обладает способностью ингибировать *in vitro* и *in vivo* репликацию вирусов Herpes simplex типа 1 и 2, вируса Varicella zoster, вируса Эпштейна-Барра и цитомегаловируса.

Высокоактивен в отношении вирусов Herpes simplex 1 и 2 типа; вируса, вызывающего ветряную оспу и опоясывающий лишай (Varicella zoster); вируса Эпштейна-Барр (виды вирусов указаны в порядке возрастания величины минимальной подавляющей концентрации ацикловира). Умеренно активен в отношении цитомегаловируса. В инфицированных клетках, содержащих вирусную тимидинкиназу, происходит фосфорилирование и превращение ацикловира в ацикловира монофосфат. Под влиянием гуанилатциклазы ацикловира монофосфат преобразуется в дифосфат и под действием нескольких клеточных ферментов - в трифосфат. Высокая избирательность действия именно на вирусы и низкая токсичность для человека обусловлены тем, что ацикловир не является субстратом для фермента тимидинкиназы неинфицированных клеток, поэтому он малотоксичен для клеток млекопитающих.

Ацикловир трифосфат ингибирует синтез (репликацию) ДНК вируса тремя механизмами: 1) конкурентно замещает дезоксирибозин трифосфат в синтезе ДНК; 2) "встраивается" в синтезируемую цепь ДНК и прекращает ее удлинение; 3) угнетает фермент ДНК-полимеразу вируса. В результате блокируется размножение вируса в организме человека. Специфичность и весьма высокая селективность действия ацикловира также обусловлены преимущественным его накоплением именно в клетках, пораженных вирусами. При герпетической инфекции 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.

Фармакокинетика

После приема внутрь частично всасывается в кишечник, из-за низкой липофильности абсорбция после перорального приема 200 мг - 20 % (15-30 %), однако при этом создаются дозозависимые концентрации, достаточные для эффективного лечения вирусных заболеваний. Пища не оказывает значительного влияния на всасывание ацикловира. С увеличением дозы биодоступность снижается.

C_{max} после назначения внутрь 200 мг 5 раз в сутки - 0,7 мкг/мл, C_{min} - 0,4 мкг/мл, $T_{C_{max}}$ - 1,5-2 часа. Связь с белками плазмы - 9-33 %. Проникает через гематоэнцефалический барьер. Хорошо проникает в органы и ткани (в т.ч. 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); концентрация в спинномозговой жидкости - 50 % от таковой в крови. Ацикловир проникает через плаценту, с грудным молоком выделяется в незначительных концентрациях. После приема внутрь в дозе 200 мг 5 раз/сут ацикловир определяется 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 с молоком матери в дозе до 0,3 мг/кг/сут). Метаболизируется в печени с образованием метаболита - 9-карбоксиметоксиметилгуанина.

Выводится почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции: при приеме внутрь - большая часть в неизменном виде (62-91 % дозы) и в виде метаболита (в среднем 14 %). Менее 2 % выводится через желудочно-кишечный тракт; следовые количества определяются в выдыхаемом воздухе.

При однократном сеансе гемодиализа в течение 6 ч концентрация ацикловира в плазме уменьшается примерно на 60 %; при перитонеальном диализе клиренс ацикловира значительно не изменяется.

$T_{1/2}$ при приеме внутрь у взрослых - 3,3 ч, у детей и подростков от 1 года до 18 лет - 2,6 ч. Скорость выведения с возрастом замедляется, но $T_{1/2}$ активного препарата увеличивается незначительно.

У больных с тяжелой хронической почечной недостаточностью $T_{1/2}$ — до 20 ч. $T_{1/2}$ при почечной недостаточности (у взрослых в зависимости от значений клиренса креатинина (КК)): при КК 80 мл/мин - 2,5 ч, 50-80 мл/мин - 3 ч, 15-50 мл/мин - 3,5 ч; при анурии - 19,5 ч, во время проведения гемодиализа - 5,7 ч, при постоянном амбулаторном перитонеальном диализе - 14-18 ч.

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

Показания к применению:

Лечение и профилактика инфекций, вызванных вирусами Herpes simplex типов 1 и 2 и Varicella zoster:

- простой герпес кожи и слизистых оболочек (первичный и рецидивирующий);
- генитальный герпес (первичный и рецидивирующий);
- опоясывающий лишай (опоясывающий герпес);
- ветряная оспа (в первые 24 часа после появления типичной сыпи);
- у больных с выраженным иммунодефицитом (в т.ч. после трансплантации, при приеме иммунодепрессивных лекарственных средств, у ВИЧ-инфицированных пациентов, на фоне химиотерапии).

Относится к болезням:

- [Ветряная оспа](#)
- [Ветрянка](#)
- [Герпес](#)
- [Инфекции](#)
- [Лишай](#)
- [Опоясывающий лишай](#)

Противопоказания:

— гиперчувствительность к ацикловиру (в т.ч. к валацикловиру);

— детский возраст до 3 лет.

С осторожностью: беременность, период лактации, дегидратация и почечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи, запивать полным стаканом воды.

Взрослым для лечения *простого герпеса кожи и слизистых оболочек* - по 200 мг 5 раз в сутки (каждые 4 ч в период бодрствования, за исключением ночного сна) в течение 5 дней, при необходимости длительность лечения может быть продлена. При лечении пациентов с иммунодефицитом разовая доза препарата должна быть увеличена до 400 мг, длительность курса - 10 дней и более.

Взрослым для лечения *генитального герпеса* - по 200 мг 5 раз в сутки (каждые 4 ч в период бодрствования, за исключением ночного сна) в течение 10 дней, при необходимости длительность лечения может быть продлена. При лечении пациентов с иммунодефицитом разовая доза препарата должна быть увеличена до 400 мг. Лечение необходимо начинать как можно раньше после возникновения инфекции; при рецидивах препарат рекомендуется назначать уже в продромальном периоде или при появлении первых элементов сыпи.

Для профилактики рецидивов инфекций, вызванных вирусом простого герпеса (в т.ч. у больных с иммунодефицитом), препарат назначают по 200 мг 4 раза в сутки (каждые 6 часов). Пациентам с нормальным иммунным статусом для профилактики простого герпеса кожи и слизистых оболочек возможно назначать по 400 мг 2 раза в сутки (каждые 12 часов). В случае выраженного иммунодефицита (после трансплантации костного мозга или при нарушении всасывания из кишечника) - по 400 мг 5 раз в сутки.

Рецидивирующий генитальный герпес (менее 6 эпизодов в год): прерывистая терапия - по 200 мг 5 раз в сутки в течение 5 дней. Рецидивирующий генитальный герпес (более 6 эпизодов в год): длительная подавляющая терапия - по 400 мг 2 раза в день или по 200 мг 3-5 раз в сутки (длительность курса до 12 месяцев).

Продолжительность профилактического курса терапии определяется длительностью периода, когда существует риск инфицирования.

При лечении *опоясывающего лишая (опоясывающего герпеса)* - по 800 мг 5 раз в сутки (каждые 4 ч в период бодрствования, за исключением ночного сна) в течение 7-10 дней. Максимальная разовая доза на прием - 800 мг.

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

Детям в возрасте старше 3 лет препарат назначают в той же дозе, что и взрослым.

Лечение *ветряной оспы*: **взрослым и детям старше 6 лет** - по 800 мг 4 раза в сутки; **детям 3-6 лет** - по 400 мг 4 раза в сутки. Более точно дозу можно определить из расчета 20 мг/кг, но не более чем по 800 мг 4 раза в сутки. Курс лечения - 5 дней.

У пациентов **с нарушениями функции почек** необходима коррекция доз и режима дозирования в зависимости от величины клиренса креатинина и вида инфекции. Для лечения инфекции, вызванной Herpes simplex, при клиренсе креатинина менее 10 мл/мин суточную дозу препарата следует уменьшить до 400 мг, разделив ее на 2 приема (с интервалами между ними не менее 12 ч, т.е. по 200 мг 2 раза в сутки). При лечении инфекций, вызванных Varicella zoster, и при поддерживающей терапии больных с выраженным иммунодефицитом - пациентам с клиренсом креатинина 10-25 мл/мин назначают препарат в дозе 2.4 г/сут в 3 приема с интервалом 8 ч (по 800 мг 3 раза в сутки). У пациентов с КК менее 10 мл/мин суточную дозу уменьшают до 1.6 г, кратность приема 2 раза в сутки с интервалом 12 ч (по 800 мг 2 раза в сутки).

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, боли в животе; редко - обратимое повышение уровня билирубина и активности печеночных ферментов.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - анемия, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - повышение уровня мочевины и креатинина в крови; очень редко - острая почечная недостаточность.

Со стороны ЦНС: головная боль; редко - обратимые неврологические нарушения, такие, как головокружение, спутанность сознания, галлюцинации, сонливость, парестезии, судороги, кома. Обычно эти побочные эффекты наблюдались у пациентов с почечной недостаточностью, которые принимали препарат в дозах, превышающих

рекомендуемые.

Аллергические реакции: сыпь, фотосенсибилизация, крапивница, зуд; редко - одышка, ангионевротический отек, анафилаксия. Лихорадка, лимфоаденопатия, периферические отеки, нарушение зрения, ажитация, миалгия.

Прочие: быстрая утомляемость; редко - алопеция.

У пациентов, получавших антиретровирусные препараты, дополнительный прием ацикловира не вызывал значимого усиления токсических эффектов.

Передозировка:

Пероральный прием 20 г ацикловира не приводил к развитию специфических симптомов.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата при беременности возможно в том случае, когда предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода.

С осторожностью: период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Усиление эффекта отмечается при одновременном назначении иммуностимуляторов. Другие нефротоксические лекарственные средства - повышение риска нефротоксического действия.

Особые указания и меры предосторожности:

Длительное или повторное лечение ацикловиром больных со сниженным иммунитетом может привести к появлению штаммов вирусов, нечувствительных к его действию. У большинства выделенных штаммов вирусов, нечувствительных к ацикловиру, обнаруживается относительная нехватка вирусной тимидинкиназы; были выделены штаммы с измененной тимидинкиназой или с измененной ДНК-полимеразой. In vitro действие ацикловира на изолированные штаммы вируса Herpes simplex может вызвать появление менее чувствительных штаммов.

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований безопасности применения препарата в период беременности не проведено. Применение показано только в тех случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

В ходе терапии высокими пероральными дозами препарата следует обеспечить достаточное поступление жидкости в организм пациента.

В период лактации препарат назначается только в случае крайней необходимости и коротким курсом, в связи с незначительным проникновением ацикловира в грудное молоко грудное вскармливание не прекращается, но продолжается с большой осторожностью под строгим наблюдением врача.

Ацикловир не предупреждает передачу герпеса половым путем, поэтому в период лечения необходимо воздерживаться от половых контактов, даже при отсутствии клинических проявлений.

При нарушениях функции почек

С осторожностью при почечной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 3 лет. **Детям в возрасте старше 3 лет** препарат назначают в той же дозе, что и взрослым.

Условия хранения:

Список Б. Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Aciklovir-AKOS>