Ацикловир (таблетки)



Код АТХ:

- J05AB01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ацикловир

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки	**1 таб.**
ацикловир	200 мг

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противовирусный препарат - синтетический аналог ациклического пуринового нуклеозида, обладающего высоко избирательным действием на вирусы герпеса. В инфицированных вирусом клетках под действием вирусной тимидинкиназы происходит фосфорилирование и дальнейшая последовательная трансформация ацикловира в моно-, ди- и трифосфат. Ацикловиртрифосфат встраивается в цепочку вирусной ДНК и блокирует ее синтез посредством конкурентного ингибирования вирусной ДНК-полимеразы.

In vitro ацикловир эффективен против вируса простого герпеса - Herpes simplex 1 и 2 типов; против вируса Varicella zoster, вызывающего ветряную оспу и опоясывающий лишай; более высокие концентрации требуются для ингибирования вируса Эпштейна-Барр. Умеренно активен в отношении цитомегаловируса.

In vivo ацикловир терапевтически и профилактически эффективен, прежде всего, при вирусных инфекциях, вызываемых вирусом Herpes simplex 1 и 2 типов. Предупреждает образование новых элементов сыпи, снижает вероятность кожной диссеминации и висцеральных осложнений, ускоряет образование корок, снижает боль в острой фазе опоясывающего герпеса.

Фармакокинетика

После приема внутрь биологическая доступность составляет 15-30%, при этом создаются дозозависимые концентрации, достаточные для эффективного лечения вирусных заболеваний. Пища не оказывает значительного влияния на всасывание ацикловира. Ацикловир хорошо проникает во многие органы, ткани и жидкости организма. Связывание с белками плазмы составляет 9-33% и не зависит от его концентрации в плазме. Концентрация в спинномозговой жидкости составляет около 50% от его концентрации в плазме. Ацикловир проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, накапливается в грудном молоке. После приема внутрь 1 г/сут концентрация ацикловира в грудном молоке составляет 60-410% от его концентрации в плазме (в организм ребенка с молоком матери ацикловир поступает в дозе 0.3 мг/кг/сут).

C_{max} препарата в плазме крови после приема внутрь по 200 мг 5 раз/сут - 0.7 мкг/мл, C_{min}- 0.4 мкг/мл; время достижения C_{max} в плазме - 1.5-2 ч. Метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивного соединения 9-карбоксиметоксиметилгуанина. Выводится почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции: около 84% выводится почками в неизменном виде, 14% - в форме метаболита. Почечный клиренс ацикловира составляет 75-80% от общего плазменного клиренса.$T_{1/2}$ у взрослых людей с нормальной функцией почек составляет 2-3 ч. У больных с тяжелой почечной недостаточностью $T_{1/2}$ - 20 ч, при гемодиализе - 5,7 ч, при этом концентрация ацикловира в плазме уменьшается до 60% от исходного значения. Менее 2% ацикловира выводится из организма через кишечник.

Показания к применению:

— лечение инфекций кожи и слизистых оболочек, вызываемых вирусами Herpes simplex 1 и 2 типов, как первичных, так и вторичных, включая генитальный герпес;

— профилактика обострений рецидивирующих инфекций, вызываемых Herpes simplex 1 и 2 типов, у пациентов с нормальным иммунным статусом;

— профилактика первичных и рецидивирующих инфекций, вызываемых вирусами Herpes simplex 1 и 2 типов, у больных с иммунодефицитом;

— в составе комплексной терапии пациентов с выраженным иммунодефицитом: при ВИЧ-инфекции (стадия СПИД, ранние клинические проявления и развернутая клиническая картина) и у пациентов, перенесших трансплантацию костного мозга;

— лечение первичных и рецидивирующих инфекций, вызываемых вирусом Varicella zoster(ветряная оспа, а также опоясывающий лишай - Herpes zoster).

Относится к болезням:

- Ветряная оспа
- Ветрянка
- Герпес
- Инфекции
- Лишай
- Опоясывающий лишай

Противопоказания:

— период лактации;

— детский возраст до 3 лет (для данной лекарственной формы).

С *осторожностью:* беременность; лицам пожилого возраста и пациентам, принимающим большие дозы ацикловира, особенно на фоне дегидратации; нарушение функции почек; неврологические нарушения или неврологические реакции на прием цитотоксических лекарственных средств (в т.ч. в анамнезе).

Способ применения и дозы:

Ацикловир принимают во время или сразу после приема пищи и запивают достаточным количеством воды. Режим дозирования устанавливают индивидуально в зависимости от степени тяжести заболевания.

Лечение инфекций кожи и слизистых оболочек, вызываемых Herpes simplex 1 и 2 типов

Взрослые

Ацикловир назначают по 200 мг 5 раз/сут в течение 5 дней с 4-часовым интервалами в течение дня и с 8-часовым интервалом на ночь. В более тяжелых случаях заболевания курс лечения может быть продлен по назначению врача

до 10 дней. В составе комплексной терапии при выраженном иммунодефиците, в т.ч. при развернутой клинической картине ВИЧ-инфекции, включая ранние клинические проявления ВИЧ-инфекции и стадию СПИД; после трансплантации костного мозга или при нарушении всасывания из кишечника назначают по 400 мг 5 раз/сут.

Лечение необходимо начинать как можно раньше после возникновения инфекции; при рецидивах ацикловир назначают в продромальном периоде или при проявлении первых элементов сыпи.

Профилактика рецидивов инфекций, вызываемых Herpes simplex 1 и 2 типов у **пациентов с нормальным иммунным статусом**

Рекомендованная доза составляет по 200 мг 4 раза/сут (каждые 6 ч) или 400 мг 2 раза/сут (каждые 12 ч). В ряде случаев оказываются эффективными более низкие дозы - по 200 мг 3 раза/сут (каждые 8 ч) или 2 раза/сут (каждые 12 ч).

Профилактика инфекций, вызываемых Herpes simplex 1 и 2 типов, у **пациентов с иммунодефицитом**.

Рекомендуемая доза составляет по 200 мг 4 раза/сут (каждые 6 ч). В случае выраженного иммунодефицита (например, после трансплантации костного мозга) или при нарушении всасывания из кишечника дозу увеличивают до 400 мг 5 раз/сут. Продолжительность профилактического курса терапии определяется длительностью периода существования риска инфицирования.

Лечение инфекций, вызываемых вирусом Varicella zoster(ветряная оспа)

Взрослые

Назначают по 800 мг 5 раз/сут каждые 4 ч днем и с 8-часовым интервалом на ночь. Продолжительность курса лечения 7-10 дней.

Дети

Назначают по 20 мг/кг 4 раза/сут в течение 5 дней (максимальная разовая доза 800 мг), **детям от 3-х до 6 лет**: по 400 мг 4 раза/сут, **старше 6 лет**: по 800 мг 4 раза/сут в течение 5 дней.

Лечение необходимо начинать при появлении самых ранних признаков или симптомов ветряной оспы.

Лечение инфекций, вызываемых вирусом Herpes zoster (опоясывающий лишай)

Взрослые

Назначают по 800 мг 4 раза/сут каждые 6 ч в течение 5 дней. **Детям в возрасте старше 3 лет** препарат назначают в той же дозе, что и взрослым.

Лечение и профилактика инфекций, вызываемых Herpessimplex 1 и 2 типов, **пациентов детского возраста с иммунодефицитом и нормальным иммунным статусом**.

Дети от 3-х лет до 6 лет - 400 мг раза/сут; **старше 6 лет** - 800 мг 4 раза/сут. Более точную дозу определяют из расчета 20 мг/кг массы тела, но не более 800 мг раза/сут. Курс лечения составляет 5 дней. Данные о профилактике рецидивов инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса, и лечении опоясывающего герпеса у детей с нормальными показателями иммунитета отсутствуют.

Для лечения **детей старше 3 лет** назначают по 800 мг ацикловира 4 раза/сут каждые 6 ч (как и для лечения **взрослых с иммунодефицитом**).

В **пожилом возрасте** происходит снижение клиренса ацикловира в организме параллельно со снижением клиренса креатинина. принимающие большие дозы препарата внутрь, должны получать достаточное количество жидкости. При почечной недостаточности необходимо решить вопрос о снижении дозы препарата.

Необходимо соблюдать осторожность при назначении ацикловира **пациентам с почечной недостаточностью**. У таких пациентов прием препарата внутрь в рекомендованных дозах с целью лечения и профилактики инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса, не приводит к кумуляции препарата до концентраций, превышающих установленные безопасные уровни. Однако, у **больных с выраженной почечной недостаточностью (КК меньше 10 мл/мин)** дозу ацикловира следует снизить до 200 мг 2 раза/сут с 12-часовыми интервалами.

При *лечении инфекций, вызываемых вирусом Varicella zoster, Herpes zoster*, а также при лечении **пациентов с выраженным иммунодефицитом** рекомендуемые дозы составляют:

— **терминальная почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин)** - по 800 мг 2 раза/сут каждые 12 ч;

— **тяжелая почечная недостаточность (КК 10-25 мл/мин)** - по 800 мг 3 раза/сут каждые 8 ч.

Побочное действие:

Препарат обычно хорошо переносится.

Использована следующая классификация нежелательных реакций в зависимости от частоты встречаемости: очень часто (>1/10), часто (>1/10, <1/100), иногда (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000).

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота, диарея; очень редко - гепатит, желтуха, в единичных случаях - абдоминальные боли.

Со стороны системы кроветворения: редко - преходящее незначительное повышение активности ферментов печени, небольшое повышение концентрации мочевины и креатинина, гипербилирубинемия; очень редко - лейкопения, эритропения, анемия, тромбоцитопения.

Со стороны ЦНС: часто - головная боль, головокружение; очень редко - возбуждение, спутанность сознания, тремор, атаксия, дизартрия, галлюцинации, психотические симптомы, судороги, сонливость, энцефалопатия, кома.

Обычно эти побочные эффекты наблюдались у пациентов с почечной недостаточностью или при наличии других провоцирующих факторов, и были, в основном, обратимыми.

Со стороны дыхательной системы: редко - одышка.

Аллергические реакции: анафилактические реакции, кожная сыпь, зуд, крапивница, синдром Лайелла, синдром Стивенса-Джонсона.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: часто - зуд, крапивница, сыпь, в том числе сенсибилизация, редко - алопеция, быстрое диффузное выпадение волос (поскольку такой тип алопеции наблюдается при различных заболеваниях и при терапии многими лекарственными средствами, связь ее с приемом ацикловира не установлена); очень редко синдром Лайелла, синдром Стивенса-Джонсона.

Прочие: часто - утомляемость, лихорадка; редко - периферические отеки, нарушение зрения, лимфаденопатия, миалгия, недомогание.

Передозировка:

Не зарегистрировано случаев передозировки при пероральном приеме ацикловира. Сообщалось о приеме внутрь 20 г ацикловира. *Симптомы:* ажитация, кома, судороги, летаргия. Возможна преципитация ацикловира в почечных канальцах, если его концентрация превышает растворимость в почечных канальцах (2.5 мг/мл).

Лечение: симптоматическое.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Ацикловир проникает через плацентарный барьер и накапливается в грудном молоке. Применение препарата при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости приема ацикловира в период лактации требуется прерывание грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение с пробенецидом приводит к увеличению среднего $T_{1/2}$ и снижению клиренса ацикловира.

Усиление эффекта ацикловира отмечается при одновременном назначении иммуностимуляторов.

При одновременном приеме с нефротоксичными препаратами повышается риск развития нарушения функций почек.

Особые указания и меры предосторожности:

Ацикловир применяется строго по назначению врача во избежание осложнений у взрослых и детей старше 3-х лет.

Длительность или повторное лечение ацикловиром больных со сниженным иммунитетом может привести в появлению штаммов вирусов, нечувствительных к его действию. У большинства выявленных 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.

С осторожностью препарат назначают пациентам с нарушением функции почек, больным пожилого возраста в связи

с увеличением периода полувыведения ацикловира.

При применении препарата необходимо обеспечить поступление достаточного количества жидкости.

При приеме препарата следует контролировать функцию почек (концентрацию мочевины крови и креатинина плазмы крови). Ацикловир не предупреждает передачу герпеса половым путем, поэтому в период лечения необходимо воздержаться от половых контактов, даже при отсутствии клинических проявлений. Необходимо информировать пациентов о возможности передачи вируса генитального герпеса в период высыпаний, а также о случаях бессимптомного вирусоносительства.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Нет данных. Однако следует учитывать, что в период лечения ацикловиром может развиваться головокружение, поэтому необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Принимать с осторожностью при нарушении функции почек.

Необходимо соблюдать осторожность при назначении ацикловира **пациентам с почечной недостаточностью**. У таких пациентов прием препарата внутрь в рекомендованных дозах с целью лечения и профилактики инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса, не приводит к кумуляции препарата до концентраций, превышающих установленные безопасные уровни. Однако, у **больных с выраженной почечной недостаточностью (КК меньше 10 мл/мин)** дозу ацикловира следует снизить до 200 мг 2 раза/сут с 12-часовыми интервалами.

При *лечении инфекций, вызываемых вирусом Varicella zoster, Herpes zoster*, а также при лечении **пациентов с выраженным иммунодефицитом** рекомендуемые дозы составляют:

— **терминальная почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин)** - по 800 мг 2 раза/сут каждые 12 ч;

—**тяжелая почечная недостаточность (КК 10-25 мл/мин)** - по 800 мг 3 раза/сут каждые 8 ч.

Применение в пожилом возрасте

В **пожилом возрасте** происходит снижение клиренса ацикловира в организме параллельно со снижением клиренса креатинина. Принимающие большие дозы препарата внутрь, должны получать достаточное количество жидкости. При почечной недостаточности необходимо решить вопрос о снижении дозы препарата.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 3 лет.

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте. Не применять по истечению срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Aciklovir_tabletki