Актастав



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ставудин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, размер №2, белого цвета; содержимое капсул - белый порошок.

	1 капс.
ставудин	30 мг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная - 214.48 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 15 мг, натрия лаурилсульфат - 12.52 мг, магния стеарат - 8 мг.

Состав оболочки капсулы: титана диоксид - 2.1119%, вода - 14.5%, натрия лаурилсульфат - 0.08%, желатин - до 100%, метилпарагидроксибензоат - 0.8%, пропилпарагидроксибензоат - 0.2%.

60 шт. - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры полиэтиленовые (1) - пачки картонные.

Капсулы твердые желатиновые, размер №2, белого или почти белого цвета; содержимое капсул - белый порошок.

	1 капс.
ставудин	40 мг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная - 204.5 мг, натрия крахмала гликолат - 15 мг, натрия лаурилсульфат 12.5 мг, магния стеарат - 8 мг.

Состав оболочки капсулы: краситель Понсо 4R - 0.00075%, титана диоксид - 1.788%, вода 14.5±1.5%, натрия лаурилсульфат - 0.08%, желатин - до 100%, метилпарабен 0.64-0.8%, пропилпарабен 0.16-0.2%.

60 шт. - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры полиэтиленовые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ставудин (2'3'-дидегидро-3'-дезокситимидин) - синтетический аналог нуклеозида тимидина, подавляет репликацию ВИЧ в культивируемых клетках человека и в клеточных линиях in vitro. После попадания в клетку ставудин под действием клеточных ферментов превращается в активный метаболит ставудина трифосфат, который подавляет активность обратной транскриптазы ВИЧ за счет конкуренции с природным субстратом диокситимидина трифосфатом и нарушает репликацию ВИЧ. Ставудина трифосфат также усиливает терминацию цепей вирусной ДНК благодаря отсутствию в молекуле 3'-гидроксильных групп, необходимых для построения ДНК. Кроме того, ставудина трифосфат подавляет клеточные ДНК-полимеразы β и γ и заметно снижает синтез митохондриальной ДНК.

Фармакокинетика

Взрослые.

Ставудин быстро всасывается при приеме внутрь. Абсолютная биодоступность составляет около 86.4%. После однократно принятой внутрь дозы C_{max} препарата в плазме крови наблюдается менее чем через 1 ч. Значения C_{max} возрастают пропорционально увеличению доз препарата. Кумуляции ставудина при его применении каждые 6, 8 или 12 ч не наблюдается. Применение препарата после или во время приема пищи не оказывает заметного влияния на фармакокинетику.

Кажущийся V_d после однократного приема препарата составляет в среднем 66 л и не зависит от дозы. Препарат в равной степени распределяется между красными и белыми клетками крови. Связывание с белками крови незначительно. После однократной пероральной дозы 40 мг концентрация в спиномозговой жидкости составляла 63 нг/мл (среднее 44-71 нг/мл) на протяжении 4-5 ч. Отношение концентрации в спиномозговой жидкости к концентрации в плазме крови составляет около 40% (среднее 31-45%).

После приема внутрь $T_{1/2}$ препарата составляет 1.44 ч и не зависит от дозы. Почечный клиренс составляет 40% от общего клиренса и почти в 2 раза превышает клиренс эндогенного креатинина, что указывает на активную канальцевую секрецию при выведении ставудина через почки наряду с гломерулярной фильтрацией.

Дети.

Абсолютная биодоступность препарата у детей составляет в среднем 76.9%. Фармакокинетика после однократного приема препарата сходна с фармакокинетикой взрослых и не зависит от дозы. Концентрации препарата в спиномозговой жидкости после однократного и многократного приема внутрь составляют от 16 до 125% по отношению к концентрации в плазме крови. Кумуляции ставудина при приеме дозы 0.125 -2 мг/кг каждые 12 ч не наблюдается.

$T_{1/2}$ составляет в среднем 1 ч. Около 34.5% препарата выводится почками в неизмененном виде.

При нарушенной функции почек клиренс ставудина снижается. Рекомендуется корректировка дозы.

Больным с нарушенной функцией печени в стабильном состоянии корректировки начальной дозы препарата не требуется.

Показания к применению:

Лечение ВИЧ-инфекции (в комбинации с другими нуклеозидными и ненуклеозидными ингибиторами обратной транскриптазы и ингибиторами ВИЧ-протеазы).

Относится к болезням:

- Инфекции

Противопоказания:

— гиперчувствительность к ставудину и/или любому из вспомогательных веществ препарата;

— детский возраст до 3 месяцев.

С *осторожностью:* алкоголизм, хроническая почечная недостаточность (КК менее 50 мл/мин), печеночная недостаточность, периферическая невропатия, применение в комбинации с диданозином, панкреатит.

Способ применения и дозы:

Внутрь. Время приема препарата не зависит от времени приема пищи. Доза препарата зависит от массы тела.

Взрослые и **дети старше 12 лет**.

Масса тела	Дозы
≥60 кг	40 мг каждые 12 ч

Если проглатывание капсул затруднено, следует аккуратно открыть капсулу и принять содержимое с небольшим количеством пищи.

Взрослым с нарушенной функцией почек рекомендуется снижение дозы в зависимости от клиренса креатинина (КК):

КК (мл/мин)	Доза в зависимости от массы тела
	> 60 кг
>50[a]	40 мг каждые 12 ч
26-50	20 мг каждые 12 ч
<25[b]	20 мг каждые 24 ч

[a] обычная доза, корректировки дозы не требуется.

[b] больным после сеанса гемодиализа рекомендуется принять суточную дозу препарата. В дни, когда диализ не проводится, препарат следует принимать в те же часы, что и в дни проведения гемодиализа.

Детям с нарушенной функцией почек. Точные рекомендации по корректировке дозы препарата у детей отсутствуют. Возможно снижение дозы и/или увеличение интервала между приемами препарата.

Побочное действие:

При применении в комбинации с другими лекарственными средствами со сходной токсичностью риск развития побочных эффектов возрастает.

Периферическая невропатия является тяжелым и дозозависимым побочным эффектом применения препарата. Риск развития этого эффекта возрастает при одновременном применении с диданозином. Периферическая невропатия обычно сопровождается двусторонним симметричным чувством онемения конечностей: покалывание и боли в ступнях ног и меньше в кистях рук. В клинических исследованиях частота проявления этих реакций зависела от дозы и/или от стадии заболевания. На ранних стадиях заболевания эти явления менее частые.

Панкреатит различной степени тяжести, включая летальный исход, может развиться у больного на разных этапах лечения и не зависит от того, применяется ли препарат в виде монотерапии или в комбинации с другими препаратами, или от степени иммуносупрессии. При применении препарата в комбинации с диданозином или другими препаратами, обладающими токсическим действием на поджелудочную железу, риск развития панкреатита повышается.

Молочнокислый ацидоз. Тяжелая форма стеатоза с гепатомегалией, включая случаи летального исхода, отмечаются при применении нуклеозидных аналогов при монотерапии или в комбинации с другими антивирусными препаратами, включая ставудин. При применении ставудина в комбинации с диданозином риск нарушения функции печени значительно возрастает. Тошнота, рвота, боли в абдоминальной области, учащенное дыхание или одышка, мышечная слабость могут указывать на развитие молочнокислого ацидоза.

Другие побочные эффекты: тромбоцитопения, гепатит, нарушения функции печени, астения, головная боль, бессонница, головокружение; сухость во рту, снижение аппетита, диарея, панкреатит; повышение активности печеночных трансаминаз, гипербилирубинемия, нейтропения, аллергические реакции (кожная сыпь, лихорадка), артралгия, миалгия, озноб.

В клинических исследованиях побочные эффекты препарата у больных детей и взрослых были схожими. Развитие периферической невропатии у детей наблюдалось реже, чем у взрослых. Однако симптомы периферической невропатии у детей было выявить труднее.

Передозировка:

Симптомы: периферическая невропатия и нарушение функции печени.

Лечение: симптоматическое. Ставудин удаляется при гемодиализе (скорость выведения составляет 120±18мл/мин). Перитонеальный диализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение во время беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Ставудин не рекоменудется применять одновременно с зидовудином. Превращение ставудина в активный метаболит снижается в присутствии зидовудина, фосфорилирование ставудина также замедляется в присутствии доксорубицина и рибавирина.

Одновременно принимаемые диданозин, ламивудин или нелфинавир не влияют на эффективность препарата. Риск развития побочных эффектов возрастает при одновременном применении с диданозином.

Ставудин почти не связывается с белками крови, что указывает на малую вероятность лекарственных взаимодействий с участием механизма вытеснения из мест связывания.

Не рекомендуется сопутствующий прием препаратов, вызывающих периферические неврологические расстройства (хлорамфеникол, цисплатин, дапсон, этамбутол, этионамид, гидралазин, изониазид, литий, метронидазол, нитрофурантоин, фенитоин, винкристин, залцитабин).

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат следует применять с осторожностью у больных с повышенным риском развития периферической невропатии, при прогрессирующей ВИЧ-инфекции, с периферической невропатией в анамнезе, а также при применении в комбинации с диданозином. Чувство онемения, покалывания или боли в конечностях могут указывать на развитие периферической невропатии, которые могут исчезать сразу после прекращения приема препарата. При появлении указанных симптомов следует временно прекратить лечение препаратом. Возобновлять лечение можно только после полного исчезновения симптомов. Может потребоваться уменьшение дозы до половины рекомендованной.

Препарат следует применять с осторожностью у больных с повышенным риском развития панкреатита, при прогрессирующей ВИЧ-инфекции, при одновременном назначении с диданозином. При появлении симптомов панкреатита лечение препаратом следует приостановить. При повторном назначении препарата исключить одновременное применение диданозина и гидроксимочевины.

Независимо от того, как применяется препарат, в виде монотерапии или в комбинации с другими препаратами, биохимические показатели функции печени могут повышаться. С целью раннего выявления развития панкреатита необходимо чаще проверять функцию поджелудочной железы.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять при хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 50мл/мин).

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять при печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям до 3 мес.

Точные рекомендации по корректировке дозы препарата у детей отсутствуют. Возможно снижение дозы и/или увеличение интервала между приемами препарата.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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