Исентресс



Код АТХ:

- J05AX08

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ралтегравир

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противовирусное средство. Ингибирует каталитическую активность ВИЧ интегразы - фермента, участвующего в репликации вируса. Ингибирование интегразы предотвращает ковалентное введение генома ВИЧ в геном клетки хозяина на ранних стадиях развития инфекции. Не включенные в ДНК человека геномы ВИЧ не способны индуцировать продукцию новых вирусных частиц, вследствие этого происходит подавление процесса интеграции и предотвращение дальнейшего распространения вирусной инфекции в организме. Ингибирующая способность ралтегравира в отношении фосфотрансферазы человека, включая ДНК-полимеразы a, b и g, выражена незначительно.

Фармакокинетика

Ралтегравир быстро всасывается после приема препарата натощак, C_{max} в плазме крови достигается примерно через 3 ч. AUC и C_{max} увеличиваются пропорционально дозе в диапазоне доз от 100 до 1600 мг. Абсолютная биодоступность ралтегравира не установлена. Ралтегравир можно принимать вне зависимости от режима приема пищи.

При введении 2 раза/сут равновесное состояние достигается быстро, примерно в течение 2 дней после начала

лечения. Значения AUC и C_{max} свидетельствуют о минимальной кумуляции ралтегравира, значения концентрации в плазме крови через 12 ч указывают на незначительную кумуляцию.

В диапазоне концентраций от 2 до 10 мкмоль связывание ралтегравира с белками плазмы составляет 83%. Ралтегравир легко проникает через плацентарный барьер. Не проникает через ГЭБ.

После приема внутрь ралтегравира примерно 51% и 32% выводится через кишечник и почками соответственно. В кале обнаруживается только ралтегравир – продукт гидролиза ралтегравир-глюкуронида, секретируемого в желчь. В моче определяется ралтегравир и ралтегравир-глюкуронид в пропорциях, составляющих примерно 9% и 23% от введенной дозы, в то время как в плазме крови 70% составляет ралтегравир, а 30% - ралтегравир-глюкуронид. Основной путь метаболизма ралтегравира представлен процессом глюкуронизации, опосредованной ферментом уридин-дифосфат-глюкуронозилтрансферазой.

Показания к применению:

Лечение ВИЧ-1 инфекции (даже при неэффективности других антиретровирусных препаратов) в комбинации с другими антиретровирусными препаратам.

Относится к болезням:

- Инфекции

Противопоказания:

Детский и подростковый возраст до 16 лет; беременность, период лактации (грудного вскармливания); повышенная чувствительность к ралтегравиру.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Рекомендуемая доза - по 400 мг 2 раза/сут. *Максимальная доза* - 1600 мг/сут.

Лечение проводят в комбинации с другими антиретровирусными препаратами

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: диарея, тошнота, боли в животе; редко - рвота, ощущение дискомфорта и боль в верхних отделах живота, запоры, диспепсия, метеоризм, гастрит, глоссит, гастро-эзофагеальный рефлюкс, гепатит, гепатомегалия, гипербилирубинемия, повышение активности АСТ, АЛТ и ЩФ в сыворотке.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, астения, слабость; редко - раздражительность, периферическая невропатия, парестезии, полиневропатия, сонливость, депрессия, бессонница, необычные сновидения, чувство тревоги.

Со стороны системы кроветворения: редко - анемия, в т.ч. макроцитарная анемия, нейтропения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - инфаркт миокарда, сердцебиение, желудочковая экстрасистолия.

Со стороны органов чувств: редко - нечеткость зрения.

Со стороны обмена веществ: редко - повышение аппетита, уменьшение или увеличение массы тела, липоматоз, нарушение жирового обмена, сахарный диабет, гипергликемия, гиперлактатемия, гиперлипидемия, гипертриглицеридемия.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - артралгии, миалгии, боли в конечностях, боли в спине, мышечные спазмы, миозит, мышечная атрофия, повышение активности КФК.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - токсическая нефропатия, нефротический синдром, никтурия, поллакиурия, почечная недостаточность, тубулярный некроз.

Со стороны половой системы: редко - эректильная дисфункция, гинекомастия.

Аллергические реакции: реакции повышенной чувствительности.

Дерматологические реакции: редко - приобретенная липодистрофия, гипергидроз, эритема, сыпь, в т.ч. макулярная и

макуло-папулезная сыпь, ксеродермия, зуд.

Прочие: редко - чувство дискомфорта в грудной клетке, озноб, жар, флегмона, инфекции, вызванные вирусом Herpes simplex, носовые кровотечения.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности, в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с индукторами уридин-дифосфат глюкуронозилтрансферазы 1А1 (УДФ-ГТ1А1), такими как рифампицин, концентрация ралтегравира в плазме крови снижается. Влияние других индукторов ферментов – таких как фенитоин, фенобарбитал, участвующих в метаболизме ралтегравира, на УДФ-ГТ1А1, неизвестно.

При одновременном применении ралтегравира с ингибиторами УДФ-ГТ1А1 (в т.ч. с атазанавиром) наблюдается умеренное увеличение концентрации ралтегравира в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять у пациентов с риском развития миопатии, рабдомиолиза и увеличения концентрации КФК в сыворотке крови.

На начальных этапах комбинированной терапии антиретровирусными средствами у ВИЧ-инфицированных пациентов может развиться воспалительная реакция на бессимптомные или остаточные оппортунистические инфекции (цитомегаловирусная или пневмоцистная пневмония, вызванная Pneumocystis jiroveci, туберкулез или паратуберкулез, вызванный Mycobacterium avium), которая может проявляться в виде ухудшения клинического состояния и усиления имеющихся симптомов. Обычно такие реакции наблюдаются в первые недели или месяцы после начала терапии. В подобных случаях могут потребоваться дополнительные диагностические и лечебные мероприятия.

Поскольку неизвестно, выводится ли ралтегравир при диализе, не рекомендуется прием накануне сеанса диализа.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Исследования по изучению влияния на способность к управлению транспортными средствами и использованию механизмов не проводились. Учитывая возможность развития головокружения, слабости, сонливости и нечеткости зрения на фоне терапии, пациенты должны проявлять особую осторожность при занятиях потенциально опасными видами деятельности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 16 лет.

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