Осельтамивир-натив



Код АТХ:

- J05AH02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Осельтамивир

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Капсулы твердые желатиновые капсулы №2, с корпусом и крышечкой белого цвета; содержимое капсул - белый или белый с желтоватым оттенком порошок.

	1 капс.
осельтамивира фосфат	98.5 мг
что соответствует содержанию осельтамивира	75 мг

Вспомогательные вещества: крахмал прежелатинизированный - 46.4 мг, тальк - 8.3 мг, повидон К30 - 6.7 мг, кроскармеллоза натрия - 3.4 мг, натрия стеарилфумарат - 1.7 мг.

Состав оболочки капсулы:
корпус капсулы: титана диоксид - 2%, желатин - до 100%;
крышечка капсулы: титана диоксид - 2%, желатин - до 100%.

10 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.
10 шт. - банки из полиэтилентерефталата (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противомикробные, противопаразитарные и противоглистные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противовирусное средство. Является пролекарством, активный метаболит (осельтамивир карбоксилат) которого селективно подавляет нейраминидазу вируса гриппа типов А и В. Нейраминидаза представляет собой гликопротеин, который катализирует расщепление связи между концевой сиаловой кислотой и сахаром, способствуя тем самым распространению вируса в дыхательных путях (выходу вирионов из инфицированной клетки и проникновению в

клетки эпителия дыхательных путей, предотвращая инактивацию вируса эпителиальной слизью). Осельтамивир карбоксилат действует вне клеток и конкурентно подавляет нейраминидазу вируса. Тормозит рост вируса гриппа in vitro и подавляет репликацию вируса и его патогенность in vivo. Уменьшает выделение вирусов гриппа А и В из организма.

Не влияет на выработку антител в ответ на введение инактивированной вакцины против гриппа.

Частота резистентности клинических изолятов вируса составляет 2%.

Фармакокинетика

После приема внутрь практически полностью всасывается из ЖКТ, абсорбция не зависит от приема пищи. Обладает эффектом "первого прохождения" через печень. Под действием кишечных и печеночных эстераз превращается в активный метаболит. 75% принятой внутрь дозы попадает в системный кровоток в виде активного метаболита, менее 5% - в виде исходного вещества. Плазменные концентрации как пролекарства, так и активного метаболита пропорциональны дозе.

Средний V_d активного метаболита - 23 л. Связывание с белками плазмы - 3%.

Выводится в виде активного метаболита преимущественно почками путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции. $T_{1/2}$ осельтамивира - 1-3 ч. Осельтамивира карбоксилат далее не метаболизируется и выводится почками, его $T_{1/2}$ - 6-10 ч. Почечный клиренс - 18.8 л/ч. Выводится через кишечник - менее 20%.

У пациентов пожилого возраста (65-78 лет) концентрация активного метаболита в равновесном состоянии на 25-35% выше, чем у более молодых пациентов. У пациентов с почечной недостаточностью скорость выведения осельтамивира карбоксилата обратно пропорциональна величине КК.

Показания к применению:

Грипп типов А и В.

Противопоказания:

Хроническая почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин), печеночная недостаточность, повышенная чувствительность к осельтамивиру.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь, независимо от приема пищи.

При лечении прием необходимо начать не позднее 2 сут от момента развития симптомов заболевания в дозе 75 мг 2 раза/сут в течение 5 дней. Увеличение дозы более 150 мг/сут не приводит к усилению эффекта.

Для профилактики гриппа типов А и В взрослым - по 75 мг 1-2 раза/сут в течение 6 нед. (во время эпидемии гриппа). *Максимальная суточная доза* для взрослых составляет 150 мг.

У больных с КК менее 30 мл/мин дозу уменьшают до 75 мг 1 раз/сут в течение 5 дней.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота (обычно при приеме в высоких дозах, либо в первые дни лечения); редко - диарея, боли в животе.

Со стороны ЦНС: бессонница, головокружение, головная боль.

Со стороны дыхательной системы: заложенность носа, боль в горле, кашель.

Прочие: чувство усталости, слабость.

Применение при беременности и кормлении грудью:

С осторожностью применять при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию, в 2-3 раза увеличивают концентрацию активного метаболита (вследствие торможения процесса активной канальцевой секреции в почках), что не требует коррекции дозы.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять у детей.

У пациентов с печеночной недостаточностью безопасность и эффективность осельтамивира не установлена.

Не имеется данных о безопасности применения осельтамивира при КК менее 10 мл/мин.

Источник: http://drugs.thead.ru/Oseltamivir-nativ