

Тенофовир



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Тенофовир](#)

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противовирусное средство, нуклеотидный ингибитор обратной транскриптазы. Тенофовир in vivo превращается в тенофовир, аналог нуклеозидмонофосфата (нуклеотида) аденозина монофосфата. Тенофовир в последующем превращается в активный метаболит - тенофовира дифосфат, который ингибирует активность обратной транскриптазы ВИЧ-1, встраиваясь в молекулу вирусной ДНК и нарушая синтез цепочки ДНК. Тенофовир является слабым ингибитором ДНК-полимераз α , β и митохондриальной ДНК-полимеразы γ млекопитающих.

Фармакокинетика

При приеме натощак биодоступность тенофовира составляет приблизительно 25% и до 40% (во время еды); улучшается при приеме во время еды, особенно с высоким содержанием жира. Клинически значимого влияния на эффективность тенофовира прием пищи не оказывает. После однократного приема внутрь в дозе 300 мг C_{\max} в сыворотке крови достигается через 1 ± 0.4 ч. Фармакокинетика тенофовира имеет дозозависимый характер. $T_{1/2}$ из клетки > 60 ч.

После однократного приема внутрь $T_{1/2}$ тенофовира составляет приблизительно 17 ч. После многократного приема внутрь в дозе 300 мг 1 раз/сут (в условиях приема не натощак), 32 ± 10 % принятой дозы определяется в моче в течение более 24 ч. Тенофовир выводится почками, путем клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции.

Показания к применению:

Лечение ВИЧ-1 инфекции в составе комбинированной антиретровирусной терапии у взрослых.

Относится к болезням:

- [Инфекции](#)

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к тенофовиру.

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи. Рекомендованная доза - 300 мг 1 раз/сут.

У пациентов с почечной недостаточностью при КК 30-49 мл/мин - по 300 мг каждые 48 ч; при КК 10-29 мл/мин - по 300 мг каждые 72-96 ч. У пациентов, находящихся на гемодиализе - 300 мг каждые 7 дней после завершения сеанса диализа.

Побочное действие:

Со стороны обмена веществ: очень часто - гипофосфатемия; редко - лактацидоз; возможно - гипокалиемия.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - диарея, рвота, тошнота; часто - метеоризм; редко - панкреатит, повышение активности трансаминаз; очень редко - гепатит; возможно - стеатоз печени.

Со стороны костно-мышечной системы: возможно - рабдомиолиз, остеомаляция, мышечная слабость, миопатия.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - острая почечная недостаточность, проксимальная ренальная тубулопатия (включая синдром Фанкони), гиперкреатининемия; очень редко - острый тубулярный некроз; частота неизвестна - нефрит (включая острый интерстициальный), нефрогенный несахарный диабет.

Прочие: очень часто - головокружение; редко - сыпь; очень редко - диспноэ, астения.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При необходимости применения при беременности следует сопоставить ожидаемую пользу терапии для матери и потенциальный риск для плода. В связи с выявленными изменениями костной ткани на фоне применения тенофовира, и ограниченным опытом применения рекомендуется с осторожностью применять тенофовир при беременности.

Женщины детородного возраста во время лечения должны использовать надежные методы контрацепции.

При необходимости применения в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении тенофовира с диданозином концентрация диданозина в плазме крови увеличивается (данная комбинация не рекомендуется; при необходимости комбинированной терапии дозу диданозина следует уменьшить).

При совместном применении происходит уменьшение концентрации в плазме крови атазанавира и увеличение концентрации тенофовира. Необходимо применять тенофовир с атазанавиром только с дополнительным усилением действия последнего ритонавиром.

При совместном применении комбинации лопинавир/ритонавир с тенофовиром концентрация тенофовира в плазме крови увеличивается.

Дарунавир увеличивает концентрацию тенофовира на 20-25%. При данной комбинации дарунавир и тенофовир следует применять в стандартных дозах, при этом необходимо тщательно мониторировать нефротоксическое действие тенофовира. Тенофовир в основном выводится из организма почками. При совместном применении тенофовира с препаратами, которые уменьшают функцию почек или подавляют/прекращают активную тубулярную секрецию, возможно увеличение сывороточную концентрацию тенофовира и/или увеличить концентрации других препаратов, которые выводятся почками.

Ганцикловир, валганцикловир и цидофовир конкурируют с тенофовиром за активную канальцевую секрецию почками, в результате этого повышается концентрация тенофовира в плазме крови (необходимо клиническое наблюдение для контроля возможных побочных эффектов).

Нефротоксичные препараты способны повышать концентрацию тенофовира в плазме.

Особые указания и меры предосторожности:

Тенофовир

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

С осторожностью следует применять тенофовир при почечной недостаточности с КК менее 50 мл/мин, включая пациентов, находящихся на гемодиализе. При КК менее 30 мл/мин не рекомендуется применять тенофовир; при необходимости применения следует тщательно контролировать функцию почек и скорректировать интервал между введением препарата.

Впервые возникшая или прогрессирующая почечная недостаточность может привести к острой почечной недостаточности и синдрому Фанкони. Необходимо определение КК перед началом лечения тенофовиром. Необходим контроль клиренса креатинина и фосфора в сыворотке крови у пациентов с повышенным риском развития или прогрессирования почечной недостаточности. Необходимо избегать применения тенофовира одновременно или после недавнего лечения нефротоксичными препаратами.

Необходимо исключать применение тенофовира одновременно с комбинированными противовирусными препаратами, в состав которых входит тенофовир и адефовира депивоксил.

Тенофовир следует применять только как часть соответствующей антиретровирусной комбинированной терапии у ВИЧ-1 инфицированных пациентов.

При применении тенофовира возможно развитие синдрома Фанкони, сопровождающегося гипофосфатемией, гипоурикемией, протеинурией, нормогликемической глюкозурией; в некоторых случаях может развиваться острая почечная недостаточность. На ранних стадиях течение может быть бессимптомным, либо сопровождаться миалгиями; в большинстве случаев симптомы исчезают при прекращении приема тенофовира. К факторам риска относятся низкую массу тела, наличие заболеваний почек на момент начала терапии. Частота развития нефротоксичных побочных эффектов крайне низкая у пациентов с исходно нормальной функцией почек.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять тенофовир при почечной недостаточности с КК менее 50 мл/мин, включая пациентов, находящихся на гемодиализе. При КК менее 30 мл/мин не рекомендуется применять тенофовир; при необходимости применения следует тщательно контролировать функцию почек и скорректировать интервал между введением препарата.

Впервые возникшая или прогрессирующая почечная недостаточность может привести к острой почечной недостаточности и синдрому Фанкони. Необходимо определение КК перед началом лечения тенофовиром. Необходим контроль клиренса креатинина и фосфора в сыворотке крови у пациентов с повышенным риском развития или прогрессирования почечной недостаточности. Необходимо избегать применения тенофовира одновременно или после недавнего лечения нефротоксичными препаратами.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Tenofovir>