Валавир



Код АТХ:

- J05AB11

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Валацикловир

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 группы аналогов нуклеозидов. Валацикловир представляет собой L-валиновый эфир ацикловира, являясь, таким образом, пролекарством.

После всасывания в кровь валацикловир почти полностью превращается в ацикловир под влиянием печеночного фермента валацикловир-гидролазы. Образовавшийся из валацикловира ацикловир, в свою очередь, проникает в пораженные вирусом клетки, где под влиянием вирусного фермента тимидинкиназы превращается в монофосфат, затем, под влиянием клеточных киназ - в дифосфат и активный трифосфат. Трифосфат ацикловира угнетает ДНК-полимеразу и, таким образом, нарушает репликацию ДНК вируса. Кроме того, нарушение репликации вирусной ДНК может быть результатом встраивания ацикловира в ее структуру. Таким образом, высокая избирательность валацикловира в отношении тканей, пораженных вирусом, объясняется тем, что I этап цепи реакций фосфорилирования опосредуется ферментом, вырабатываемым самим вирусом.

Активен в отношении вирусов Herpes simplex типов 1 и 2, Varicella zoster, цитомегаловируса, вируса Эпштейна-Барр, вируса герпеса человека 6.

Фармакокинетика

После приема внутрь валацикловир хорошо абсорбируется из ЖКТ, быстро и практически полностью превращается в ацикловир и L-валин под действием фермента валацикловиргидролазы.

После однократного приема 0.25-2 г валацикловира C_{max} ацикловира у здоровых добровольцев с нормальной функцией почек составляет в среднем 10-37 мкмоль (2.2-8.3 мкг/мл) и достигается через 1-2 ч.

Биодоступность ацикловира при приеме от 1 г валацикловира составляет 54% и не зависит от приема пищи.

C_{max} валацикловира в плазме составляет всего 4% от уровня ацикловира и достигается в среднем через 30-100 мин после приема препарата; через 3 ч уровень C_{max} остается прежним или снижается.

Связывание валацикловира с белками плазмы очень низкое - 15%.

У пациентов с нормальной функцией почек $T_{1/2}$ ацикловира составляет около 3 ч. Валацикловир выводится с мочой, главным образом в виде ацикловира (более 80% дозы) и его метаболита 9-карбоксиметоксиметилгуанина, в неизмененном виде выводится менее 1% препарата.

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности $T_{1/2}$ ацикловира составляет примерно 14 ч.

На поздних сроках беременности устойчивый суточный показатель AUC после приема 1 г валацикловира был больше приблизительно в 2 раза, чем таковой при приеме ацикловира в дозе 1.2 г/сут.

У реципиентов трансплантатов органов, получающих валацикловир в дозе 2 г 4 раза/сут, C_{max} ацикловира равна или превосходит таковую у здоровых добровольцев, получающую такую же дозу валацикловира, а суточные показатели AUC у них значительно выше.

Показания к применению:

Лечение и профилактика инфекционных заболеваний, вызванных Herpes zoster.

Профилактика цитомегаловирусной инфекции, развивающейся при трансплантации органов.

Относится к болезням:

- Инфекции
- Цитомегаловирусная инфекция

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к валацикловиру, ацикловиру.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь разовая доза для взрослых составляет 0.25-2 г. Частота приема и длительность лечения зависят от показаний.

Пациентам с тяжелыми нарушениями функции почек требуется коррекция режима дозирования.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, чувство дискомфорта, боли в животе, рвота, диарея, анорексия; редко - транзиторное повышение показателей печеночных проб.

Со стороны ЦНС: головная боль, усталость, головокружение, спутанность сознания, галлюцинации; редко - нарушения сознания; в отдельных случаях - кома (обычно у пациентов с нарушением функции почек или другими предрасполагающими факторами).

Аллергические реакции: редко - сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек, анафилаксия.

Прочие: редко - тромбоцитопения, одышка, нарушения функции почек, фотосенсибилизация.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований безопасности применения валацикловира при беременности и в период лактации не проведено. Применение у этой категории пациентов возможно в случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода или грудного ребенка.

Известно, что ацикловир, являющийся метаболитом валацикловира, выделяется с грудным молоком в концентрациях, в 0.6-4.1 раза превышающих его концентрации в плазме. $T_{1/2}$ ацикловира из грудного молока составляет 2.8 ч, что сопоставимо с $T_{1/2}$ из плазмы крови.

В *экспериментальных исследованиях* валацикловир не оказывал тератогенного воздействия у крыс и кроликов. При пероральном приеме валацикловир не вызывал нарушений фертильности у самцов и самок крыс.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Клинически значимого взаимодействия препарата валацикловира с другими лекарственными средствами не установлено.

Ацикловир в неизмененном виде поступает в мочу в результате активной канальцевой секреции. Любые препараты, которые назначаются с ним одновременно и конкурируют за этот механизм элиминации, могут вызвать повышение концентрации валацикловира в плазме. Циметидин и препараты, блокирующие канальцевую секрецию, при назначении после приема валацикловира в дозе 1 г, повышают для ацикловира показатель AUC и уменьшают его почечный клиренс.

При одновременном приеме ацикловира и неактивного метаболита микофенолата мофетила (иммунодепрессанта, применяемого при трансплантации) наблюдалось увеличение AUC ацикловира и микофенолата мофетила.

При одновременном применении валацикловира с препаратами, нарушающими функцию почек (в т.ч. циклоспорин, такролимус), возможно ухудшение функции почек.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациентам пожилого возраста в период лечения необходимо увеличить объем потребляемой жидкости.

Пациенты с почечной недостаточностью имеют повышенный риск развития неврологических осложнений при приеме валацикловира.

С осторожностью применять у пациентов с заболеваниями печени.

Клинический опыт применения у детей отсутствует.

При нарушениях функции почек

Пациенты с почечной недостаточностью имеют повышенный риск развития неврологических осложнений при приеме валацикловира.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять у пациентов с заболеваниями печени.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста в период лечения необходимо увеличить объем потребляемой жидкости.

Применение в детском возрасте

Клинический опыт применения у детей отсутствует.

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