Вирдел



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, капсуловидные, с гравировкой "V" на одной стороне и "500" на другой стороне.

	1 таб.
валацикловира гидрохлорида моногидрат	583.8 мг,
что соответствует содержанию валацикловира	500 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - от 37 до 55 мг, кросповидон - 15 мг, повидон - 50 мг, магния стеарат - 7 мг.

Состав оболочки: опадрай белый YS-1-7003 (титана диоксид - 31.25%, гипромеллоза (3cP, 6cP) - 29.875%, макрогол (полиэтиленгликоль 400) - 8%, полисорбат (твин 80) - 1%) - 17.5 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противовирусный препарат. Специфический нуклеозидный ингибитор ДНК-полимеразы вирусов герпеса. В организме человека быстро превращается в ацикловир и L-валин; в результате фосфорилирования из ацикловира образуется активный ацикловиртрифосфат, который конкурентно подавляет вирусную ДНК-полимеразу, и, будучи аналогом пуринового нуклеозида (гуанина), встраивается в вирусную ДНК, что приводит к полному разрыву цепи, прекращению синтеза ДНК и блокированию репликации вируса. Первый этап фосфорилирования происходит под влиянием вирусоспецифического фермента (для вирусов Herpes simplex типа 1 и 2, Varicella zoster – вирусная тимидинкиназа, которую обнаруживают только в клетках, инфицированных вирусом). Для цитомегаловируса (ЦМВ) селективность препарата обусловлена тем, что фосфорилирование частично опосредовано продуктом гена фосфотрансферазы UL97. Препарат активен in vitro в отношении вирусов простого герпеса (ВПГ) типа 1 и 2, вируса опоясывающего лишая, вируса Эпштейна-Барр, ЦМВ и вируса герпеса человека 6 типа.

У пациентов с сохраненным иммунитетом вирусы Herpes simplex и Varicella zoster с пониженной чувствительностью к валацикловиру встречаются крайне редко (менее 0.1%), но иногда могут быть обнаружены у пациентов с тяжелыми нарушениями иммунитета, например, с трансплантатом костного мозга, у получающих химиотерапию по поводу злокачественных новообразований и у ВИЧ-инфицированных.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь хорошо абсорбируется из ЖКТ. При участии фермента печени валацикловиргидролазы быстро и

практически полностью превращается в ацикловир и L-валин. Биодоступность (в пересчете на ацикловир) при приеме в дозе 1000 мг составляет 54% и не зависит от приема пищи. После применения валацикловира в дозе 1 г 4 раза/сут AUC примерно равна AUC при в/в введении ацикловира в дозе 5 мг каждые 8 ч. C_{max} в плазме после однократного приема 1 г - 15-25 мкмоль/мл, время достижения C_{max} – 1.6-2.1 ч; через 3 ч неметаболизированный валацикловир в плазме не определяется.

Распределение

Связывание с белками плазмы валацикловира - 13-18%, ацикловира - 9-33%.

Ацикловир широко распределяется в тканях и жидкостях организма, включая головной мозг, печень, матку, слизистую оболочку и секрет влагалища, сперму, спинномозговую жидкость (50% от концентрации в плазме), жидкость герпетических пузырьков. Проникает через плаценту и в грудное молоко.

Метаболизм

Метаболизм валацикловира/ацикловира не связан с ферментами цитохрома P450.

После повторного применения валацикловира у пациентов с нормальной функцией почек ацикловир не кумулирует.

Выведение

$T_{1/2}$ валацикловира у пациентов с нормальной функцией почек - менее 30 мин; ацикловира – 2.5-3.3 ч.

Выводится почками (45,6%), преимущественно в виде ацикловира (более 80% дозы) и его метаболита 9-карбоксиметоксиметилгуанина, менее 1% - в неизмененном виде; и через кишечник (47.12%) в течение 96 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

$T_{1/2}$ валацикловира при терминальной стадии хронической почечной недостаточности - 14 ч, у пожилых пациентов (65-83 лет) – 3.3-3.7 ч.

У пациентов, находящихся на гемодиализе, $T_{1/2}$ около 4 ч; во время 4-часовой процедуры удаляется около 30% препарата. При перитонеальном диализе препарат удаляется в меньшей степени.

Показания к применению:

Взрослые

— лечение опоясывающего лишая (Herpes zoster);

— лечение инфекций кожи и слизистых оболочек, вызванных ВПГ типа 1 и 2 (включая впервые выявленный генитальный герпес, рецидивирующий генитальный герпес (Herpes genitalis) и лабиальный герпес (Herpes labialis);

— профилактика (супрессия) рецидивов инфекций кожи и слизистых оболочек, вызванных ВПГ типа 1 и 2 (включая генитальный герпес);

— снижение риска передачи генитального герпеса здоровому партнеру.

Взрослые и подростки 12 лет и старше

— профилактика цитомегаловирусной инфекции, возникающей при трансплантации органов.

Относится к болезням:

- Герпес
- Инфекции
- Цитомегаловирусная инфекция

Противопоказания:

— ВИЧ-инфекция при содержании CD4+-лимфоцитов менее 100/мкл;

— детский возраст (до 12 лет – для профилактики цитомегаловирусной инфекции при трансплантации органов, до 18 лет – по другим показаниям);

— повышенная чувствительность к валацикловиру, ацикловиру, а также к другим компонентам, входящим в состав препарата.

С *осторожностью*: печеночная/почечная недостаточность, клинически выраженные формы ВИЧ-инфекции; беременность, период лактации; пожилой возраст; гипогидратация, одновременный прием нефротоксичных препаратов.

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи.

Лечение опоясывающего лишая (лечение рекомендуется начинать при появлении первых симптомов).

Взрослые - по 1000 мг 3 раза/сут в течение 7 дней.

Лечение инфекций, вызванных ВПГ (лечение рекомендуется начинать в продромальном периоде или при появлении первых симптомов).

Взрослые - по 500 мг 2 раза/сут. При рецидиве герпеса курс лечения – 3-5 дней; при необходимости курс лечения может быть продлен до 10 дней.

При *лабиальном герпесе* возможен также прием валацикловира в дозе 2 г 2 раза/сут (вторую дозу следует принимать приблизительно через 12 ч, но не ранее, чем через 6 ч после приема первой дозы); курс лечения - 1 день. Лечение рекомендуется начинать при появлении самых ранних симптомов лабиального герпеса, таких как покалывание, зуд, жжение.

Профилактика (супрессия) рецидивов инфекций, вызванных ВПГ

Взрослые

Пациенты *с нормальным иммунным статусом* **-** по 500 мг 1 раз/сут, пациенты *с иммунодефицитом* **-** по 500 мг 2 раза/сут.

Снижение риска передачи генитального герпеса здоровому партнеру

Для снижения риска передачи генитального герпеса здоровому партнеру у гетеросексуальных взрослых пациентов с сохраненным иммунитетом и с числом обострений до 9 в год: по 500 мг 1 раз/сут в течение года и более каждый день при регулярных половых контактах. Данные о профилактике инфицирования в других популяциях больных отсутствуют.

Профилактика цитомегаловирусной инфекции после трансплантации

Взрослые и подростки в возрасте от 12 лет и старше - по 2 г 4 раза/сут. Лечение рекомендуется начинать как можно раньше после трансплантации. Дозу следует снижать в зависимости от КК. Курс лечения – 90 дней (у пациентов с высоким риском развития инфекций может быть продлен).

У **пожилых пациентов** коррекции дозы не требуется, за исключением значительного нарушения функции почек.

При **хронической почечной недостаточности** режим дозирования устанавливают в зависимости от КК и показаний**.**

Лечение опоясывающего лишая: **КК 15-30 мл/мин** - по 1 г 2 раза/сут; **КК менее 15 мл/мин** - по 1 г 1 раз/сут.

Лечение инфекций, вызванных ВПГ: **КК менее 15 мл/мин** - по 500 мг 1 раз/сут.

Лечение лабиального герпеса: **КК 31-49 мл/мин** - по 1 г 2 раза/сут в течение 1 дня; **КК 15-30 мл/мин** - по 500 мг 2 раза/сут в течение 1 дня; **КК менее 15 мл/мин** - 500 мг однократно.

Профилактика (супрессия) рецидивов инфекций, вызванных ВПГ

Взрослые пациенты *с нормальным иммунным статусом:* **КК менее 15 мл/мин** - по 250 мг 1 раз/сут, взрослые пациенты *с иммунодефицитом*: **КК менее 15 мл/мин** - по 500 мг 1 раз/сут.

Снижение риска передачи генитального герпеса здоровому партнеру: **КК менее 15 мл/мин** - по 250 мг 1 раз/сут.

Профилактика цитомегаловирусной инфекции после трансплантации

Взрослые и подростки в возрасте от 12 лет и старше: КК 75 мл/мин и более - по 2 г 4 раза/сут; **КК от 50 до менее 75 мл/мин** - по 1.5 г 4 раза/сут; **КК от 25 до менее 50 мл/мин** - по 1.5 г 3 раза/сут; **КК от 10 до менее 25 мл/мин** - по 1.5 г 2 раза/сут; **КК менее 10 мл/мин или у пациентов, находящихся на гемодиализе** - по 1.5 г 1 раз/сут.

Пациентам, находящимся на гемодиализе, препарат рекомендуется принимать сразу после процедуры гемодиализа в такой же дозе, как пациентам с КК менее 15 мл/мин.

Пациенты с нарушением функции печени

У **пациентов со слабо или умеренно выраженным циррозом печени** (синтетическая функция печени сохранена) коррекции дозы не требуется. При исследовании фармакокинетики у **пациентов с тяжелым циррозом печени** (с нарушением синтетической функции печени и наличием шунтов между портальной системой и общим сосудистым руслом) также не получено данных, свидетельствующих о необходимости коррекции режима дозирования; однако клинический опыт применения валацикловира у этой категории пациентов органичен.

Побочное действие:

По частоте возникновения побочные эффекты разделены на следующие категории: очень часто (≥10%), часто (≥1% и <10%), нечасто (≥0.1% и <1%), редко (≥0.01% и <0.1%), очень редко (<0.01%).

Со стороны ЦНС: часто - головная боль; редко - головокружение, спутанность сознания, галлюцинации, нарушение умственных способностей; очень редко - возбуждение, тремор, атаксия, дизартрия, психотические симптомы, судороги, энцефалопатия, кома.

Перечисленные симптомы обратимы и обычно наблюдаются у больных с нарушением функции почек или на фоне других предрасполагающих состояний.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота; редко - дискомфорт в животе, рвота, диарея; очень редко - обратимые нарушения функциональных печеночных проб, которые иногда расценивают как проявления гепатита.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - кожная сыпь, фотосенсибилизация; редко - зуд.

Аллергические реакции: очень редко - крапивница, ангионевротический отек, анафилактические реакции.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - нарушение функции почек; очень редко - острая почечная недостаточность, почечная колика. Почечная колика может быть связана с нарушением функции почек.

Со стороны органов кроветворения: очень редко - лейкопения, тромбоцитопения.

Прочие: у пациентов с тяжелыми нарушениями иммунитета, особенно у взрослых пациентов на поздней стадии СПИД, получающих валацикловир в высоких дозах (8 г/сут ежедневно) в течение длительного времени, наблюдались случаи почечной недостаточности, микроангиопатической гемолитической анемии и тромбоцитопении (иногда в сочетании). Подобные осложнения были отмечены у пациентов с такими же заболеваниями, но не получающих валацикловир.

Передозировка:

Симптомы: острая почечная недостаточность и нарушения со стороны ЦНС (спутанность сознания, галлюцинации, возбуждение, судороги, кома); возможны тошнота, рвота.

Лечение: гемодиализ (при острой почечной недостаточности и анурии).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Имеются ограниченные данные по применению валацикловира при беременности. Валацикловир применяют только в тех случаях, когда потенциальная польза для матери превышает возможный риск для плода. Зарегистрированные данные об исходе беременности у женщин, принимавших валацикловир или ацикловир, не показали увеличения числа врожденных дефектов у их детей по сравнению с общей популяцией. Поскольку в регистр включено небольшое количество женщин, принимавших валацикловир при беременности, то достоверных и определенных заключений о безопасности применения валацикловира при беременности сделать нельзя.

Ацикловир, основной метаболит валацикловира, выделяется с грудным молоком. При приеме матерью валацикловира внутрь в дозе 500 мг 2 раза/сут ребенок подвергнется такому же воздействию ацикловира, как при приеме его внутрь в дозе около 0.61 мг/кг/сут. Период полувыведения ацикловира из грудного молока такой же, как из плазмы крови. Валацикловир в неизмененном виде не определялся в плазме матери, грудном молоке или в моче ребенка. Валацикловир следует назначать с осторожностью кормящим женщинам. Однако в/в введение ацикловира в дозе 30 мг/кг/сут используется у новорожденных для лечения заболеваний, вызванных вирусом простого герпеса.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Циметидин и пробенецид (блокаторы канальцевой секреции) повышают AUC ацикловира и уменьшают его почечный клиренс. У пациентов с нормальным КК коррекции режима дозирования не требуется, т.к. ацикловир обладает широким терапевтическим диапазоном.

Нефротоксичные лекарственные средства (в т.ч. циклоспорин, такролимус) повышают риск развития нарушения функции почек.

Ацикловир выводится из организма с мочой в основном в неизмененном виде путем активной канальцевой секреции. При одновременном приеме валацикловира и препаратов, конкурирующих за данный механизм выведения, возможно повышение уровня ацикловира или обоих препаратов (или их метаболитов). Было отмечено повышение AUC ацикловира и неактивного метаболита микофенолата мофетила при одновременном применении этих препаратов.

Фармакокинетика валацикловира не меняется при одновременном приеме с дигоксином, алюминий/магнийсодержащими антацидами, тиазидными диуретиками.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов с риском дегидратации, особенно больных пожилого возраста, необходимо поддерживать адекватный водно-электролитный баланс.

Рекомендуется тщательное наблюдение за пациентами с нарушением функции почек и пожилыми пациентами в связи с более высоким риском развития нежелательных явлений со стороны ЦНС, острой почечной недостаточности и риском передозировки у данной категории пациентов.

У пациентов с хронической почечной недостаточностью рекомендуется часто определять клиренс креатинина, особенно, в период, когда функция почек быстро меняется (в частности, сразу после трансплантации или приживления трансплантата), при этом доза валацикловира корректируется в соответствии с показателями клиренса креатинина. При отсутствии выраженных нарушений функции почек, коррекции режима дозирования не требуется.

Необходимо с осторожностью применять валацикловир (особенно в дозах, превышающих 4 мг/сут) одновременно с лекарственными препаратами, которые конкурируют с ацикловиром за путь элиминации, а также с препаратами, нарушающими функцию почек.

Нет данных о применении валацикловира в высоких дозах (4 г/сут и более) у пациентов с заболеваниями печени, поэтому следует с осторожностью назначать препарат в высоких дозах этой категории пациентов.

Валацикловир снижает риск передачи генитального герпеса у гетеросексуальных взрослых пациентов с сохраненным иммунитетом. Данные о профилактике инфицирования в других популяциях больных отсутствуют.

Валацикловир снижает риск передачи генитального герпеса, но не исключает его полностью и не приводит к полному излечению. Во время терапии валацикловиром пациент должен принять меры для обеспечения безопасности партнера при половых контактах.

Прием препарата в высоких дозах в течение длительного времени при состояниях, сопровождающихся выраженным иммунодефицитом (трансплантация костного мозга, клинически выраженные формы ВИЧ-инфекции, трансплантация почки), приводил к развитию тромбоцитопенической пурпуры и гемолитико-уремическому синдрому, вплоть до летального исхода.

При возникновении побочных эффектов со стороны ЦНС (в т.ч. ажитации, галлюцинаций, спутанности сознания, бреда, судорог и энцефалопатии) препарат отменяют.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При оценке способности пациента управлять автомобилем и другими механизмами следует учитывать клиническое состояние пациента и профиль побочных реакций валацикловира.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью*: почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью*: печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью*: пожилой возраст.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте (до 12 лет – для профилактики цитомегаловирусной инфекции при трансплантации органов, до 18 лет – по другим показаниям).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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