Зовиракс (таблетки)



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белые, круглые, двояковыпуклые, с надписью "GXCL3" с одной стороны.

	1 таб.
ацикловир	200 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, натрия крахмала гликолат, повидон К30, магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая.

5 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противовирусный препарат, синтетический аналог пуринового нуклеозида, который обладает способность ингибировать in vitro и in vivo репликацию вирусов Herpes simplex типа 1 и 2, вируса Varicella zoster, вируса Эпштейна-Барра (EBV) и цитомегаловируса (CMV). В культуре клеток ацикловир обладает наиболее выраженной противовирусной активностью в отношении Herpes simplex типа 1, далее в порядке убывания активности следуют: Herpes simplex типа 2, Varicella zoster, EBV и CMV.

Действие ацикловира на вирусы имеет высокоизбирательный характер. Ацикловир не является субстратом для фермента тимидинкиназы неинфицированных клеток, поэтому он малотоксичен для клеток млекопитающих. Тимидинкиназа клеток, инфицированных вирусами Herpes simplex типа 1 и 2, Varicella zoster, EBV и CMV, превращает ацикловир в ацикловира монофосфат - аналог нуклеозида, который затем последовательно превращается в дифосфат и трифосфат под действием клеточных ферментов. Включение ацикловира трифосфата в цепочку вирусной ДНК и последующий обрыв цепи блокируют дальнейшую репликацию вирусной ДНК.

У пациентов с выраженным иммунодефицитом длительные или повторные курсы терапии ацикловиром могут приводить к образованию резистентных штаммов, и поэтому дальнейшее лечение ацикловиром может быть неэффективным. У большинства выделенных штаммов с пониженной чувствительностью к ацикловиру отмечалось относительно низкое содержание вирусной тимидинкиназы, нарушение структуры вирусной тимидинкиназы или ДНК-полимеразы. Воздействие ацикловира на штаммы вируса Herpes simplex in vitro также может приводить к образованию менее чувствительных к нему штаммов. Не установлена корреляция между чувствительностью штаммов вируса Herpes simplex к ацикловиру in vitro и клинической эффективностью препарата.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь ацикловир только частично абсорбируется из кишечника. При приеме 200 мг ацикловира каждые 4 ч средняя С

C_{SSmax} в плазме составляла 3.1 мкмоль (0.7 мкг/мл), а средняя C_{SSmin} - 1.8 мкмоль (0.4 мкг/мл). При приеме 400 мг и 800 мг ацикловира каждые 4 часа C_{SSmax} составляла 5.3 мкмоль (1.2 мкг/мл) и 8 мкмоль (1.8 мкг/мл) соответственно, а средняя C_{SSmin} - 2.7 мкмоль (0.6 мкг/мл) и 4 мкмоль (0.9 мкг/мл) соответственно.

Распределение

Концентрация ацикловира в спинномозговой жидкости составляет приблизительно 50% от его плазменной концентрации. Ацикловир в незначительной степени (9-33%) связывается с белками плазмы крови.

Метаболизм и выведение

Основным метаболитом ацикловира является 9-карбоксиметокси-метилгуанин, на долю которого в моче приходится около 10-15% от введенной дозы препарата.

$T_{1/2}$ составляет 2.5-3.3 ч. Большая часть препарата выводится почками в неизмененном виде. Почечный клиренс ацикловира значительно превышает клиренс креатинина, что свидетельствует о выведении ацикловира не только посредством клубочковой фильтрации, но и канальцевой секреции. При назначении ацикловира через 1 ч после приема 1 г пробенецида $T_{1/2}$ и AUC увеличивались на 18 и 40% соответственно.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с хронической почечной недостаточностью $T_{1/2}$ ацикловира составлял в среднем 19.5 ч; при проведении гемодиализа соответственно 5.7 ч., а концентрация ацикловира в плазме снижалась приблизительно на 60%.

У пожилых людей клиренс ацикловира с возрастом снижается параллельно со снижением клиренса креатинина, однако $T_{1/2}$ ацикловира изменяется незначительно.

При одновременном введении ацикловира и зидовудина ВИЧ-инфицированным пациентам фармакокинетические характеристики обоих препаратов практически не изменялись.

Показания к применению:

— лечение инфекций кожи и слизистых оболочек, вызванных вирусом Herpes simplex типа 1 и 2, включая первичный и рецидивирующий генитальный герпес;

— профилактика рецидивов инфекций, вызванных вирусом Herpes simplex типа 1 и 2, у пациентов с нормальным иммуннным статусом;

— профилактика инфекций, вызванных вирусом Herpes simplex типа 1 и 2, у пациентов с иммунодефицитом;

— лечение инфекций, вызванных вирусом Varicella zoster (ветряной оспы и опоясывающего герпеса);

— лечение пациентов с тяжелым иммунодефицитом, главным образом с ВИЧ-инфекцией (число клеток $CD4^+$<200/мкл), с ранними клиническими проявлениями ВИЧ-инфекции и с развернутой клинической картиной СПИД), перенесших трансплантацию костного мозга.

Относится к болезням:

- Ветрянка
- Герпес
- Инфекции

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к ацикловиру или валацикловиру.

С *осторожностью* назначают при дегидратации и почечной недостаточности.

Способ применения и дозы:

Взрослым для *лечения инфекций, вызванных вирусом Herpes simplex типа 1 и 2*, рекомендуемая доза Зовиракса составляет 200 мг 5 раз/сут каждые 4 ч (за исключением периода ночного сна). Обычно курс лечения составляет 5 дней, но может быть продлен при тяжелых первичных инфекциях.

При *выраженном иммунодефиците* (например, после трансплантации костного мозга) или при *нарушении абсорбции из кишечника* доза Зовиракса для приема внутрь может быть увеличена до 400 мг 5 раз/сут. Лечение необходимо начинать как можно раньше после возникновения инфекции; при рецидивах препарат рекомендуется назначать уже

в продромальном периоде или при появлении первых элементов сыпи.

Для *профилактики рецидивов инфекций, вызванных вирусом Herpes simplex типа 1 и 2*, у **пациентов с нормальным иммунным статусом** рекомендуемая доза Зовиракса составляет 200 мг 4 раза/сут (каждые 6 ч). Многим пациентам подходит более удобная схема терапии: по 400 мг 2 раза/сут (каждые 12 ч). В ряде случаев оказываются эффективными более низкие дозы Зовиракса: по 200 мг 3 раза/сут (каждые 8 ч) или 2 раза/сут (каждые 12 ч). Лечение Зовираксом следует периодически прерывать на 6-12 мес для выявления возможных изменений в течении заболевания.

Для *профилактики возникновения инфекций, вызываемых вирусом Herpes simplex типа 1 и 2*, у **пациентов с иммунодефицитом** рекомендуемая доза Зовиракса составляет 200 мг 4 раза/сут (каждые 6 ч). При *выраженном иммунодефиците* (например, после трансплантации костного мозга) или при *нарушении абсорбции из кишечника* доза Зовиракса для приема внутрь может быть увеличена до 400 мг 5 раз/сут. Продолжительность профилактического курса терапии определяется длительностью периода существования риска инфицирования.

Для *лечения ветряной оспы и опоясывающего герпеса* рекомендуемая доза Зовиракса составляет 800 мг 5 раз/сут, препарат принимают каждые 4 ч, за исключением периода ночного сна. Курс лечения составляет 7 дней.

Препарат следует назначать как можно раньше после начала инфекции, т.к. в этом случае лечение более эффективно.

Для *лечения пациентов с выраженным иммунодефицитом* рекомендуемая доза Зовиракса составляет 800 мг 4 раза/сут (каждые 6 ч).

Пациентам, перенесшим трансплантацию костного мозга, перед назначением Зовиракса внутрь обычно рекомендуется проводить курс в/в терапии ацикловиром в течение 1 мес. При проведении клинических исследований максимальная продолжительность курса лечения реципиентов трансплантата костного мозга составляла 6 мес (с 1-го по 7-й месяц после трансплантации). У пациентов с развернутой клинической картиной ВИЧ-инфекции курс лечения Зовираксом составлял 12 мес, однако есть основания полагать, что у таких пациентов могут быть эффективны более продолжительные курсы терапии.

Лечение и профилактика инфекций, вызванных вирусами Herpes simplex, у **детей с иммунодефицитом в возрасте от 2 лет и старше** - такие же дозы, как для взрослых; в **возрасте младше 2 лет** - половину дозы для взрослых.

Для *лечения ветряной оспы* **детям старше 6 лет** препарат назначают в разовой дозе 800 мг; **от 2 до 6 лет** - 400 мг; **младше 2 лет** - 200 мг. Кратность приема 4 раза/сут. Более точно разовую дозу можно определить из расчета 20 мг/кг массы тела (но не более 800 мг). Курс лечения составляет 5 дней.

Данные о применении Зовиракса для *профилактики рецидивов инфекций, вызванных вирусами Herpes simplex*, и при лечении *опоясывающего герпеса* у **детей с нормальными показателями иммунитета** отсутствуют.

Согласно имеющимся весьма ограниченным сведениям для лечения **детей старше 2 лет** с *выраженным иммунодефицитом* можно применять такие же дозы Зовиракса, как для лечения взрослых.

При назначении Зовиракса **пациентам пожилого возраста** следует учитывать возможность снижения клиренса ацикловира параллельно со снижением клиренса креатинина. При наличии признаков почечной недостаточности необходимо решить вопрос о снижении дозы Зовиракса. Пациенты пожилого возраста должны получать достаточное количество жидкости на фоне приема Зовиракса внутрь в высоких дозах.

У **пациентов с почечной недостаточностью** прием ацикловира внутрь в рекомендуемых дозах с целью *лечения и профилактики инфекций, вызываемых вирусами Herpes simplex*, не приводит к кумуляции препарата до концентраций, превышающих установленные безопасные уровни. Однако у пациентов с **КК менее 10 мл/мин** дозу Зовиракса рекомендуется снижать до 200 мг 2 раза/сут (каждые 12 ч). Для *лечения ветряной оспы, опоясывающего герпеса*, а также для лечения пациентов с **выраженным иммунодефицитом** при **КК менее 10 мл/мин** рекомендуемые дозы Зовиракса составляют 800 мг 2 раза/сут каждые 12 ч; при **КК 10-25 мл/мин** 800 мг 3 раза/сут каждые 8 ч.

Зовиракс таблетки можно принимать во время еды, поскольку прием пищи не нарушает в значительной степени его абсорбцию. Таблетки следует запивать полным стаканом воды.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, боли в животе; редко - обратимое повышение уровня билирубина и активности печеночных ферментов.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - анемия, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - повышение уровня мочевины и креатинина в крови; очень редко - острая почечная недостаточность.

Со стороны ЦНС: головная боль; редко - обратимые неврологические нарушения, такие, как головокружение,

спутанность сознания, галлюцинации, сонливость, судороги, кома. Обычно эти побочные эффекты наблюдались у пациентов с почечной недостаточностью, которые принимали препарат в дозах, превышающих рекомендуемые.

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

Прочие: быстрая утомляемость; редко - быстрое диффузное выпадение волос. Поскольку такой тип алопеции наблюдается при различных заболеваниях и при терапии многими лекарственными средствами, связь ее с приемом ацикловира не установлена.

У пациентов, получавших антиретровирусные препараты, дополнительный прием Зовиракса не вызывал значимого усиления токсических эффектов.

Передозировка:

При случайном однократном приеме ацикловира внутрь в дозах до 20 г токсические эффекты не зарегистрированы.

Симптомы: нарушения со стороны ЖКТ (тошнота, рвота) и неврологические нарушения (головная боль и спутанность сознания); иногда - одышка, диарея, нарушение функции почек, летаргия, судороги, кома.

Лечение: тщательное медицинское наблюдение с целью выявления возможных симптомов интоксикации. Возможно применение гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Назначение Зовиракса при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) требует осторожности и возможно только после оценки предполагаемой пользы для матери и потенциального риска для плода и ребенка.

Не выявлено увеличения числа врожденных дефектов у детей, матери которых получали Зовиракс во время беременности, по сравнению с общей популяцией.

После приема Зовиракса внутрь в дозе 200 мг 5 раз/сут ацикловир определялся в грудном молоке в концентрациях, составляющих 0.6-4.1% от плазменных концентраций. При таких концентрациях в грудном молоке дети, находящиеся на грудном вскармливании, могут получать ацикловир в дозе до 300 мкг/кг/сут.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Клинически значимых взаимодействий Зовиракса с другими лекарственными препаратами не отмечалось.

Блокаторы кальциевых каналов и циметидин увеличивают AUC ацикловира и снижают его почечный клиренс (коррекции режима дозирования Зовиракса не требуется).

При одновременном применении Зовиракса с препаратами, выводящимися путем активной канальцевой секреции, возможно повышение концентрации активных веществ или их метаболитов в плазме (необходима осторожность при назначении таких комбинаций).

Сочетанное применение ацикловира и микофенолата мофенила, иммунодепрессанта, применяющегося при трансплантации органов, приводит к повышению показателя AUC ацикловира и неактивного метаболита микофенолата мофенила.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты, принимающие внутрь Зовиракс в высоких дозах, должны получать достаточное количество жидкости.

При нарушениях функции почек

У **пациентов с почечной недостаточностью** прием ацикловира внутрь в рекомендуемых дозах с целью *лечения и профилактики инфекций, вызываемых вирусами Herpes simplex*, не приводит к кумуляции препарата до концентраций, превышающих установленные безопасные уровни. Однако у пациентов с **КК менее 10 мл/мин** дозу Зовиракса рекомендуется снижать до 200 мг 2 раза/сут (каждые 12 ч). Для *лечения ветряной оспы, опоясывающего герпеса*, а также для лечения пациентов с **выраженным иммунодефицитом** при **КК менее 10 мл/мин** рекомендуемые дозы Зовиракса составляют 800 мг 2 раза/сут каждые 12 ч; при **КК 10-25 мл/мин** 800 мг 3 раза/сут каждые 8 ч.

Применение в пожилом возрасте

Пациенты пожилого возраста должны получать достаточное количество жидкости на фоне приема Зовиракса внутрь в высоких дозах.

Применение в детском возрасте

Лечение и профилактика инфекций, вызванных вирусами Herpes simplex, у **детей с иммунодефицитом в возрасте от 2 лет и старше** - такие же дозы, как для взрослых; в **возрасте младше 2 лет** - половину дозы для взрослых.

Для *лечения ветряной оспы* **детям старше 6 лет** препарат назначают в разовой дозе 800 мг; **от 2 до 6 лет** - 400 мг; **младше 2 лет** - 200 мг. Кратность приема 4 раза/сут. Более точно разовую дозу можно определить из расчета 20 мг/кг массы тела (но не более 800 мг). Курс лечения составляет 5 дней.

Данные о применении Зовиракса для *профилактики рецидивов инфекций, вызванных вирусами Herpes simplex*, и при лечении *опоясывающего герпеса* у **детей с нормальными показателями иммунитета** отсутствуют.

Согласно имеющимся весьма ограниченным сведениям для лечения **детей старше 2 лет** *свыраженным иммунодефицитом* можно применять такие же дозы Зовиракса, как для лечения взрослых.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, недоступном для детей месте, при температуре не выше 25°С. Срок годности – 5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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