

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

Ацикловір 400 СТАДА®
(Aciclovir 400 STADA®)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: aciclovir; 2-аміно-1,9-дигідро-9-[(2-гідроксіетокси)метил]-6Н-пурин-6-он;

основні фізико-хімічні властивості: білі круглі, двоопуклі таблетки з відтиском «VS2», діаметром 12 мм і висотою $4,8 \pm 0,2$ мм;

склад: 1 таблетка містить ацикловіру 400 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, кополівідон, натрію крохмальгліколят.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Противірусні засоби для системного застосування.

Код АТС J05AB01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка Ацикловір – противірусний препарат, особливо ефективний проти вірусів простого герпесу (Herpes simplex) і лишая оперізувального (Varicella zoster). Схожість структур ацикловіру і дезоксигуанідину дозволяє ацикловіру взаємодіяти з вірусними ферментами, що приводить до переривання розмноження вірусу. Після проникнення ацикловіру в уражену герпесом клітину під впливом тимідинкінази, яка виділяється вірусом, ацикловір перетворюється

в ацикловір-монофосфат, який ферментами клітини-хазяїна перетворюється в ацикловір-дифосфат, а потім в активну форму ацикловір-трифосфат, який і блокує розповсюдження вірусної ДНК. Вибірково діє на синтез вірусної ДНК. На реплікацію ДНК клітини-хазяїна (клітини людини) ацикловір-трифосфат практично не впливає.

Специфічність і висока селективність дії зумовлені переважним його накопиченням у клітинах, уражених вірусом герпесу. Має високу активність відносно вірусу простого герпесу I та II типу; вірусу, який спричинює вітряну віспу і оперізувальний лишай; вірусу Епштейна-Барра. Має помірну активність по відношенню до цитомегавірусу. При герпесі попереджує виникнення нових елементів висипу, знижує ймовірність шкірної дисемінації і вісцеральних ускладнень, прискорює утворення кірок, знижує біль у гострій фазі оперізувального герпесу. Має імуностимулюючу дію.

Фармакокінетика. Після перорального застосування частково всмоктується в кишковому тракті, через низьку ліпофільність абсорбція після перорального застосування 400 мг - близько 20%, при цьому утворюються дозозалежні концентрації, достатні для ефективного лікування вірусних захворювань. Максимальна концентрація після перорального застосування на добу 400 мг – 1,2 мкг/мл, мінімальна – 0,6 мкг/мл. Пік максимальної концентрації досягається за 1,5 – 2 год. Проникає крізь гематоенцефалічний та плацентарний бар'єр, виділяється з грудним молоком. Добре проникає в органи і тканини, концентрація в спинномозковій рідині – 50% від рівня у крові. Після перорального прийому 1 г на добу концентрація в грудному молоці – 60-410 % від його концентрації у плазмі (в організм дитини з грудним молоком ацикловір потрапляє в дозі 0,3 мг/кг на добу). Зв'язок з білками плазми – 9-33%. Метаболізується в печінці з утворенням метаболіту 9-карбоксиметоксиметилгуаніну. Виводиться нирками в незміненому стані, шляхом клубочкової і канальцевої секреції, у вигляді метаболіту - 10-15%. Швидкість виведення з віком уповільнюється, але період напіввиведення активної речовини збільшується. У хворих з тяжкою нирковою недостатністю період напіввиведення – 20 год, при гемодіалізі – 5-7 год (при цьому концентрація ацикловіру в плазмі зменшується до 60% від вихідного значення).

Показання для застосування.

Інфекції простого герпесу, генітальний герпес на шкірі та слизових оболонках (найчастіше-рецидивний генітальний герпес).

Для профілактики рецидиву показаний дорослим з ускладненими формами частих генітальних вірусних інфекцій.

Для лікування вітряної віспи і оперізувального лишая.

Спосіб застосування та дози.

При лікуванні простого герпесу шкіри і слизових оболонок призначають по 200 мг 5 разів на добу кожні 4 год, за винятком періоду нічного сну. Курс лікування – 5 днів, за необхідності може бути продовжений. При вираженому імунодефіциті (у тому числі після трансплантації кісткового мозку або при порушенні всмоктування із кишечника) призначають по 400 мг 5 разів на добу. Лікування необхідно починати якомога раніше після виникнення інфекції. Для профілактики рецидивів простого герпесу пацієнтам з нормальним імунним статусом призначають по 200 мг 4 рази на добу кожні 6 год або 400 мг 2 рази на добу кожні 12 год. При рецидивах розпочинають лікування у продромальний період або при появі перших елементів висипу. Терапію слід періодично переривати через 6 – 12 місяців (для виявлення можливих змін протягом захворювання). Для профілактики рецидивів простого герпесу пацієнтам з імунодефіцитом призначають по 200 мг 4 рази на добу кожні 6 год. У випадку вираженого імунодефіциту (після трансплантації кісткового мозку або при порушенні всмоктування із кишечника) – 400 мг 5 разів на добу. Тривалість профілактичного курсу терапії визначається тривалістю періоду, коли існує ризик інфікування. Дітям від 2 років призначають такі ж дози, як і дорослим. Для лікування первинної генітальної герпетичної інфекції призначають по 200 мг 5 разів на добу протягом 5 – 10 днів, при рецидиві - 200 мг 5 разів на добу протягом 5 днів. Для профілактики – 200 мг 4 рази на добу або 400 мг 2 рази на добу протягом 6 – 12 місяців; на фоні вираженого імунодефіциту - по 400 мг 4 рази на добу (лікування продовжують доти, доки існує загроза ризику). Для лікування вітряної віспи і оперізувального лишая призначають внутрішньо по 800 мг 5 разів на добу кожні 4 год, за винятком періоду нічного сну. Курс лікування – 7 днів. Дітям старше 6 років – по 800 мг 4 рази на добу; 2 – 6 років – по 400 мг 4 рази на добу. Більш точну дозу можна визначити із розрахунку 20 мг/кг, але не більше 800 мг 4 рази на добу. Курс лікування – 5 днів.

У пацієнтів з порушенням функції нирок: при лікуванні і профілактиці інфекцій, викликаних простим герпесом, у хворих із С1 креатиніна <10 мл/хв дозування варто знизити до 200 мг 2 рази в добу із 12-годинними інтервалами;

при лікуванні інфекцій, викликаних оперізувальним лишаєм, у хворих з С1 креатиніна <10 мл/хв рекомендується знизити дозування до 800 мг 2 рази в добу із 12-годинними інтервалами; при С1 креатиніна до 25 мл/хв призначається по 800 мг 3 рази в добу із 8-ми годинними інтервалами.

Побічна дія.

При застосуванні препарату можуть спостерігатися висипання на шкірі, шлунково-кишкові розлади, такі як нудота, блювання, абдомінальний біль, запори і діарея, головний біль, стомлюваність, запаморочення, галюцинації, гіпербілірубінемія. Всі ці симптоми зникають після припинення терапії ацикловіром.

Протипоказання.

Дитячий вік до 2 років.

Підвищена чутливість до компонентів препарату.

Передозування.

Максимальна доза ацикловіру 5 г, прийнята за один раз, не провокує інтоксикацію або прояви передозування. Але пацієнти, які прийняли дозу, що перевищує 5 г, повинні бути ретельно обстежені

Особливості застосування.

Пацієнтам зі зниженим імунітетом (при ВІЛ/СНІД або після трансплантації кісткового мозку) на фоні застосування крему ацикловіру слід призначати системне застосування препарату, як і у випадку тяжкого і рецидивного перебігу герпесвірусної інфекції. Довготривале або повторне лікування ацикловіром хворих зі зниженим імунітетом може спричинити появу штамів вірусів, нечутливих до його дії. У більшості виділених штамів вірусів, нечутливих до ацикловіру, знаходиться відносна нестача вірусної тимідинкінази; були виділені штами зі зміненою тимідинкіназою або зі зміненою ДНК-полімеразою. In-vitro дія ацикловіру на ізольовані штами вірусу простого герпесу може спричинювати появу менш чутливих штамів.

Застосування ацикловіру в період вагітності показано у тих випадках, коли користь для матері перевищує потенційний ризик для плоду.

У ході терапії високими пероральними дозами препарату слід забезпечити достатнє надходження рідини в організм пацієнта.

У період терапії ацикловіром слід припинити годування груддю.

У випадках порушення видільної функції нирок і особам похилого віку дозу зменшують з урахуванням кліренсу креатиніну.

У разі виникнення алергічних реакцій препарат слід відмінити.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Пробенецид зменшує виведення ацикловіру на 30%, що спричинює збільшення часу напіввиведення ацикловіру.

Умови та термін зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці при температурі не вище 25°C.

Термін придатності - 4 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка.

По 35 таблеток у блістері; по 1 блістеру в картонній коробці.

Виробник. СТАДА Арцнайміттель АГ.

Адреса. Стадаштрассе 2-18, D-61118 Бад Фільбель, Німеччина.