

Курамы

Бир таблетка төмөнкүдөй заттарды камтыйт:

Активдүү зат: ацикловир – 800 мг

Кошумча заттар: лактозанын моногидраты, натрий крахмал гликолят тип А (эксплотаб), жүгөрү крахмалы, магний стеараты

Сыпаттамасы

УЛКАРИЛ® 800 – эки жактуу томпок формадагы ак түстөгү тегерек таблеткалар.

Фармакологиялык касиеттери

Фармакокинетикасы

Азык-түлүк кабылдоосунан көз карандысыз түрдө ооз аркылуу кабыл алганда, ацикловир ичеги-карын трактынан жарым-жартылай (20%) сиңет.

Кан плазмасындагы эң жогорку концентрациясы 1,5–2 сааттан кийин байкалат.

Ацикловир гематоэнцефалдык жана плацентардык тосмолордон өтөт, эмчек сүтү менен бөлүнөт. Жүлүн суюктугундагы концентрациясы кан плазмасына салыштырмалуу орточо 50% түзөт. Ацикловир плазмадагы белоктор менен аз байланышат (9–33%), ошондуктан белоктор менен байланышкан участоктордон сүрүлүп чыгуу менен болгон дары-дармектердин өз ара аракеттешүүсү күтүлбөйт.

Боордо азыраак метаболизмге учурайт, негизги метаболити – 9-карбоксиметоксиметилгуанин, ал заарада кабыл алынган дозанын 10–15% түзөт.

Ацикловирдин жарым ажырашуу мезгили ($T_{1/2}$) ооз аркылуу кабыл алганда орточо 4 саатты түзөт. Созулма бөйрөк жетишсиздиги бар бейтаптарда $T_{1/2}$ орточо 19,5 саат, ал эми гемодиализ учурунда – 5,7 саат, жана ацикловирдин концентрациясы кан плазмасында болжол менен 60% төмөндөйт.

Препараттын негизги бөлүгү заара менен өзгөрүүсүз түрдө чыгат. Бөйрөк клиренси креатинин клиренсинен жогору, бул ацикловирдин гломерулярдык фильтрация менен гана эмес, ошондой эле түтүкчө секрециясы аркылуу бөлүнүп чыгуусун көрсөтөт.

Бөйрөк жетишсиздиги бар бейтаптарда сунушталган дозаларда ацикловирди колдонуу, коопсуздук деңгээлинен ашкан концентрацияларга алып келбейт.

Фармакодинамикасы

УЛКАРИЛ® — тимидиндин синтетикалык нуклеозид аналогу. Вирус менен жабыркаган клеткалардагы тимидинкиназа ацикловирди бир катар ырааттуу реакциялар аркылуу моно-, ди- жана трифосфат ацикловирге айландырат.

Ацикловирдин трифосфаты вирус ДНКсына дезоксигуанозиндин ордуна кошулат, ДНК полимеразаны басат жана репликация процессин токтотот.

Учук учурунда, ацикловир жаңы элементтердин чыгышын алдын алат, териге жана ички органдарга жайылуу коркунучун азайтат, жаралардын кабыгынын пайда болушун тездетет.

Учуктун курч фазасында ооруну жеңилдетет. Ацикловир вирус менен жабыркаган клеткаларда жогорку концентрацияда топтолот, бул анын өзгөчө жана тандалма таасирин түшүндүрөт.

Ацикловирдин 1-типтеги Herpes simplex вирусунa карата активдүүлүгү цитарабинге салыштырмалуу 2 эсе, идоксуридинге салыштырмалуу 10 эсе, трифлуоротимидинге салыштырмалуу 15 эсе, ал эми видарабинге салыштырмалуу 160 эсе жогору.

Herpes simplex вирусунун 1 жана 2 түрлөрүнө, Varicella zoster (шамал тештин жана учук) вирусунa, Эпштейн-Барр вирусунa жогорку активдүүлүк көрсөтөт. Цитомегаловируска карата орточо активдүүлүккө ээ.

Колдонууга көрсөтмөлөр

-Тери жана былжыр челдеги Herpes simplex вирусунa менен шартталган инфекциялар (алгачкы жана рецидивдүү жыныстык герпес)

-Иммунитети нормалдуу жана иммунодуштукту бузулган бейтаптарда Herpes simplex вирусунa менен шартталган инфекцияны алдын алуу

-Шамал тештин

-Varicella zoster вирусунa менен шартталган опоясывающий герпес

-Сөөк чөйчөгүн трансплантациялоодон кийин цитомегаловирустук инфекциянын алдын алуу

Колдонуу ыкмасы жана дозасы

Чондор үчүн:

Herpes simplex вирусунa менен шартталган инфекциялар – 200 мг, 5 жолу күнүнө (ар 4 саат сайын, түнкү уйкудан тышкары), курс – 5 күн.

Оор иммунодуштук бузулууларда (мисалы, трансплантациядан кийин) же ичеги аркылуу сиңиши начар болсо, дозасы 400 мг 5 жолу күнүнө.

Рецидив учурунда – дарылоо продромалдык мезгилде же биринчи элементтер чыкканда башталат.

Рецидивдин алдын алуу (иммунитети нормалдуу бейтаптарда):

200 мг – 4 жолу күнүнө (ар 6 саат сайын) же 400 мг – 2 жолу күнүнө (ар 12 саат сайын).

Кээде 200 мг 2 же 3 жолу күнүнө (ар 8–12 саат сайын), же 800 мг бир жолу күнүгө.

Дарылоо курсун 6–12 айда үзгүлтүккө учуратып, оорунун жүрүшүндөгү өзгөрүүлөрдү баалоо керек.

Иммунодуштукту бузулган бейтаптарда профилактика:

200 мг 4 жолу күнүнө (ар 6 саат сайын), кээде 400 мг 5 жолу күнүнө.

Шамал тештин жана учук:

800 мг 5 жолу күнүнө (ар 4 саат сайын, түнкү уйкудан тышкары), курс – 7 күн.

Балдар үчүн:

Herpes simplex инфекциясы (6 жаштан жогору):

200 мг 5 жолу күнүнө (ар 4 саат сайын), курс – 5 күн.

Шамал тештин:

6 жаштан жогору балдар:

-салмагы 40 кг чейин — 20 мг/кг, 4 жолу күнүнө (жалпы 80 мг/кг/сут), курс – 5 күн

-салмагы 40 кг ашык — 800 мг 4 жолу күнүнө, 5 күн

Картаң бейтаптар:

Креатинин клиренси төмөндөйт, ошондуктан УЛКАРИЛ® колдонгондо жетиштүү суюктук ичиш керек. Бөйрөк жетишсиздигинде доза азайтылышы мүмкүн.

Бөйрөк жетишсиздиги бар бейтаптар:

Herpes simplex:

-оор бөйрөк жетишсиздиги (креатинин клиренси <10 мл/мин): 200 мг 2 жолу күнүнө (ар 12 саат сайын)

Шамал тештин, учук же иммунодуштук бузулуулар:

-оор учур: 800 мг 2 жолу күнүнө (ар 12 саат сайын)

-орточо учур: 800 мг 3 жолу күнүнө (ар 8 саат сайын)

Кыйыр таасирлер

-жүрөк айлануу, кусуу, диарея, ичтин оорушу

-лимфоцитопения, эритропения, лейкопения

-териде бөртпөлөр, фотосенсибилизация, кычышуу, калтырак

-заарадагы креатинин жана мочевины деңгээлинин жогорулашы

-боор ферменттери жана билирубиндин деңгээлинин жогорулашы (кайтар түрдө)

-баш оору, баш айлануу

Сейрек:

-чачтын бат түшүүсү (байланышы аныкталган эмес)

-чарчоо, концентрациянын төмөндөшү, галлюцинациялар, уйкусуроо же уйкусуздук

-дене табынын көтөрүлүшү

-лимфаденопатия

-дем жетпөө, ангионевротикалык шишик, анафилаксия

Каршы көрсөтмөлөр

-ацикловирге же препараттын башка компоненттерине жогорку сезимталдык

-орточо же оор дегидратация

-неврологиялык бузулуулар

-6 жашка чейинки балдар