

Состав

Одна таблетка содержит

активное вещество - ацикловир 200 мг

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, натрия крахмала гликолят тип А (эксплотаб), крахмал кукурузный, магния стеарат

Описание

УЛКАРИЛ® 200: круглые таблетки белого цвета с двояковыпуклой поверхностью.

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

При приёме внутрь, независимо от приёма пищи, ацикловир абсорбируется из желудочно-кишечного тракта частично (20%). Максимальная концентрация в плазме крови определяется через 1,5 - 2 часа.

Ацикловир проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, выделяется с грудным молоком. Концентрация ацикловира в спинномозговой жидкости составляет приблизительно 50% от его плазменной концентрации. Ацикловир в незначительной степени связывается с белками плазмы крови (9–33%), поэтому лекарственные взаимодействия вследствие вытеснения из участков связывания с белками маловероятны. Мало метаболизируется печенью, основным метаболитом ацикловира является 9-карбоксиметоксиметилгуанин, на долю которого в моче приходится около 10–15% от введенной дозы препарата.

Период полувыведения ($T_{1/2}$) ацикловира при приеме внутрь составляет около 4 часов. У пациентов с хронической почечной недостаточностью $T_{1/2}$ ацикловира составляет, в среднем, 19,5 ч, а при проведении гемодиализа средний $T_{1/2}$ ацикловира - 5,7 ч, а концентрация ацикловира в плазме снижается приблизительно на 60%.

Большая часть препарата выводится почками в неизмененном виде. Почечный клиренс ацикловира значительно превышает клиренс креатинина, что свидетельствует о выведении ацикловира посредством не только клубочковой фильтрации, но и канальцевой секреции.

У пациентов с почечной недостаточностью прием ацикловира внутрь в рекомендуемых дозах с целью лечения и профилактики инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса, не приводит к кумуляции препарата до концентраций, превышающих установленные безопасные уровни.

Фармакодинамика

УЛКАРИЛ® является синтетическим аналогом нуклеозида тимидина. Тимидинкиназа инфицированных вирусом клеток, активно преобразует ацикловир через ряд последовательных реакций в моно-, ди- и трифосфат ацикловира. Трифосфат ацикловира встраивается вместо дезоксигуанозина в ДНК вируса, ингибирует ДНК-полимеразу последнего и подавляет процесс репликации. При герпесе ацикловир предупреждает образование новых элементов сыпи, уменьшает вероятность кожной диссеминации и висцеральных осложнений, ускоряет образование корок. Способствует снижению боли в острой фазе опоясывающего герпеса. Специфичность и весьма высокая селективность действия также обусловлена преимущественным его накоплением в клетках, пораженных вирусом герпеса. Активность ацикловира против вируса простого герпеса (тип 1) в два раза выше, чем у цитарабина, в 10 раз — чем у идоксуридина, в 15 раз — чем у трифлуоротимидина и в 160 раз — чем у видарабина. Высокоактивен в отношении вируса простого герпеса (*Herpes simplex (VHS)*) типа 1 и 2, вируса ветряной оспы и опоясывающего лишая (*Varicella zoster (VZV)*), вируса Эпштейн-Барра. Умеренно активен в отношении цитомегаловируса.

Показания к применению

- инфекции кожи и слизистых оболочек, вызванных вирусом простого герпеса, включая первичный и рецидивирующий генитальный герпес
- профилактика рецидивов инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, у пациентов с нормальным иммунным статусом и иммунодефицитом
- ветряная оспа
- опоясывающий лишай, вызванный вирусом Varicella zoster
- профилактика цитомегаловирусной инфекции после трансплантации костного мозга

Способ применения и дозы

Взрослым

Лечение инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

Рекомендуемая доза препарата составляет 200 мг 5 раз в сутки каждые 4 ч, исключением является период ночного сна. Обычный курс лечения составляет 5 дней, но может быть продлен при тяжелых первичных инфекциях.

В случае выраженного иммунодефицита (например, после трансплантации костного мозга) или при нарушении всасывания из кишечника доза препарата для приема внутрь может быть увеличена до 400 мг 5 раз в сутки. Лечение необходимо начинать как можно раньше после возникновения инфекции.

При рецидивах препарат рекомендуется назначать уже в продромальном периоде или при появлении первых элементов сыпи.

Профилактика рецидивов инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

у пациентов с нормальным иммунитетом рекомендуемая доза препарата составляет 200 мг 4 раза в сутки (каждые 6 ч), либо по другой схеме терапии — 400 мг 2 раза в сутки (каждые 12 ч). В некоторых случаях эффективными оказываются более низкие дозы УЛКАРИЛА® — 200 мг 3 раза в сутки (каждые 8 ч) или 2 раза в сутки (каждые 12 ч), либо возможна однократная суммарная суточная доза - 800 мг.

Лечение препаратом периодически следует прерывать на 6–12 мес. для выявления возможных изменений в течении заболевания.

Профилактика инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

у пациентов с иммунодефицитом рекомендуемая доза УЛКАРИЛА® - 200 мг 4 раза в сутки (каждые 6 ч). В случае выраженного иммунодефицита (например, после трансплантации костного мозга) или при нарушении всасывания из кишечника доза УЛКАРИЛА® может быть увеличена до 400 мг 5 раз в сутки. Продолжительность профилактического курса терапии зависит от длительности периода возможного риска инфицирования.

Лечение ветряной оспы и опоясывающего герпеса

Рекомендуемая доза УЛКАРИЛА® составляет 800 мг 5 раз в сутки; препарат принимают каждые 4 ч, исключением является период ночного сна. Курс лечения - 7 дней. Лечение препаратом следует начинать как можно раньше после начала инфекции, т.к. от этого зависит эффективность лечения.

Детям

Лечение инфекций, вызванных вирусом простого герпеса

- дети от 6 лет и старше по 200мг 5 раз в сутки каждые 4 часа, за исключением периода ночного сна. Курс лечения 5 дней.

Лечение ветряной оспы

Детям старше 6 лет

- весом до 40 кг разовая доза из расчета 20 мг/кг 4 раза в день (80мг/кг/сутки) в течение 5 дней,

- весом более 40 кг – 800 мг 4 раза в день в течение 5 дней.

Пациенты пожилого возраста

В пожилом возрасте происходит снижение клиренса ацикловира в организме параллельно со снижением клиренса креатинина.

Пациенты пожилого возраста должны получать достаточное количество жидкости на фоне приема высоких доз УЛКАРИЛА® внутрь, при почечной недостаточности у них необходимо решить вопрос о снижении дозы УЛКАРИЛА®.

Пациенты с почечной недостаточностью

При лечении инфекций, вызванных вирусом простого герпеса, у больных с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) рекомендуется снижать дозу УЛКАРИЛА® до 200 мг 2 раза в сутки (каждые 12 ч.)

При лечении ветряной оспы, опоясывающего герпеса, а также при лечении пациентов с выраженным иммунодефицитом рекомендуемые дозы УЛКАРИЛА® составляют:

- тяжелая почечная недостаточность (Cl креатинина <10 мл/мин) 800 мг 2 раза в сутки каждые 12 часов
- умеренная почечная недостаточность (Cl креатинина 10–25 мл/мин) 800 мг 3 раза в сутки каждые 8 часов.

Побочные действия

- тошнота, рвота, диарея, боль в животе
- лимфоцитопения, эритропения, лейкопения
- сыпь, фотосенсибилизация, крапивница, зуд, лихорадка
- повышение концентрации мочевины, креатинина в крови
- обратимое повышение уровня билирубина и активности печеночных ферментов
- головная боль, головокружение

Редко

- быстрое диффузное выпадение волос (связь с приемом ацикловира не установлена)
- повышенная утомляемость, снижение концентрации внимания, галлюцинации, сонливость или бессонница
- повышение температуры тела
- лимфаденопатия
- одышка, ангионевротический отек, анафилаксия

Противопоказания

- повышенная чувствительность к ацикловиру или другим компонентам препарата
- умеренная и тяжелая дегидратация
- неврологические нарушения
- детский возраст до 6 лет