

HERPESIN 250 inj. sicc.

(ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции)

ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции е противовирусен агент, който се отличава с висока активност по отношение на херпес симплекс и варицела зостер вирусите.

Състав

Всеки флакон ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции съдържа aciclovir 250 mg sodium hydroxide q.s. под форма на стерилен лиофилизат.

Свойства

Активната съставка на препарата Херпезин е ацикловир (9-*(2-hydroxy-ethoxymethyl)guanine*). Ацикловир е вещество с подиртан вирусстатичен ефект по отношение на herpes simplex (I и II) и Varicella zoster вирусите.

След като проникне в заразната с вирус клетка, ацикловир се фосфорилира в няколко етапа до активното съединение acyclovirtriphosphate. Първият етап на този процес се ускорява от вирус-специфична тимидинкиназа. Acyclovirtriphosphate действа като инхибитор и като фалшив субстрат за специфична вирусна ДНК полимераза, като по този начин се избягва синтеза на вирусна ДНК без да се оказва съществено влияние върху нормалните клетъчни процеси.

След прием се излъчва предимно в непроменено състояние през бъбреците както чрезglomerularна филтрация, така и чрез тубулна екскреция. 9-*(2-hydroxy-ethoxymethyl)guanine* е единственият значим метаболит на ацикловир и съставлява 10-15% от бъбречния му клирънс. Нивата на ацикловир в цереброспиналната течност са около 50% от тези в плазмата. Свързането с плазмените протеини е относително слабо, като не се оказва взаимодействие с други лекарствени средства, което може да доведе до изместване на препарата.

Показания

Лечение на тежки или повтарящи се инфекции, причинени от Herpes simplex вирус тип I и II и тежки инфекции, дължащи се на Varicella zoster вирус, предимно генерализирани или в случаи с намален имунитет.

Противопоказания

ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции е противопоказан при болни с данни за свръхчувствителност към ацикловир. Препаратът трябва да се дозира внимателно при болни с увредена бъбречна функция с оглед предотвратяване на натрупване на ацикловир в кръвта.

Нежелани лекарствени реакции

Като се има предвид механизмът на действие на ацикловир, токсичността на препарата е много ниска.

В някои случаи може да се повишат плазмените концентрации на уреята и креатинина, вследствие запушване на тубулните пътища от кристали ацикловир. Предполага се, че това е свързано със задържане на бъбречните тубули с кристали ацикловир, който из кристализира в отделителната система при високата концентрация на медикамента в тубулната течност, възникнала при наличие на много високи сарумни нива на препарата или при недостатъчна хидратация на пациента. По тази причина ацикловир трябва да се прилага посредством бавна венозна инфузия в продължение на повече от един час. Трябва да се поддържа също така и адекватна хидратация на пациента. Само в изключително редки случаи и може да възникне остра бъбречна недостатъчност.

Разтворите на ацикловир трябва да се разреждат, като се има предвид високото рН на препаратта. Извънсъдовата апликация може даже да причини некроза на тъканите. В някои случаи при провеждане на лечение с ацикловир е възможна поява на преходни неврологични нарушения (премор, объркваност), съпроводени с изменения в енцефалограмата. В редки случаи се наблюдават загубе и повръщане. При единични болни са наблюдавани повишаване спонтанните на чернодробните ензими, потискане на костния мозък и екзантема.

Лекарствени взаимодействия

При едновременно прилагане на Пробенецид се удължава биологичният полуживот на ацикловир.

Дозировка и начин на приложение

Преди употреба, съдържанието на флакона ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции трябва да се разтвори в 10 мл вода за инжекции или разтвор на натриев хлорид (0,9 %). По този начин се получава разтвор, в 1 мл, от който се съдържа 25 мг ацикловир. След това, съдържанието на флакона се разрежда с най-малко 50 мл физиологичен серум или разтвор на Харпман, т.е. до максимална концентрация от 0,5%. Инфузионният разтвор, в който се съдържа цялата необходима доза ацикловир, се въвежда посредством бавна венозна инфузия с продължителност най-малко един час. Тъй като препаратът не съдържа стабилизиращи вещества, инфузионният разтвор трябва да се приложи веднага за след приготвянето му или не по-късно от 12 часа, ако разтворът е съвсем бистър. Разтворите не трябва да се поставят в хладилник.

Обикновено при пациентите с Herpes simplex инфекции, както със запазен така и с понижан имунен отговор и при болните с Varicella zoster инфекция, се прилага ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции в доза 5 мг/кг на всеки 8 часа. Лечението обикновено продължава 5 или повече дни, в зависимост от състоянието на пациента и терапевтичния отговор. При деца на възраст между 3 месеца и 12 години се препоръчва необходимата доза да се изчислява в съответствие с телесната повърхност. Дозата от 5 мг/кг съответства приблизително на 250 мг/кв.м. Дозата от 10 мг/кг съответства приблизително на 500 мг/кв.м.

При пациенти с увредена бъбречна функция ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции трябва да се прилага внимателно. Препоръчва се следното адаптиране на дозата:

Креатининов клирънс

25 - 50 мл/мин

10 - 25 мл/мин

0 - 10 мл/мин
(анурични болни)

Доза

Препоръчва се апликациите на препаратта в посочената по-горе доза да се извършват на 12 ч

Препоръчва се апликациите на препаратта в посочената по-горе доза да се извършват на 24 ч

Препоръчва се посочената по-горе доза да се намали наполовина и апликациите да се извършват всеки 24 ч след диализа

Лечението с ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции трябва да започне възможно най-рано след първите прояви на заболяването, обикновено първите 3 - 4 дни, тъй като по-късното начало на терапията не води до съкращаване продължителността на болестта.

Предупреждения

Дозата на препарата ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции трябва специално да се адаптира при болни с увредена бъбречна функция, с оглед предотвратяване акумулирането на лекарственото средство в кръвта (виж по-горе).

Тъй като препаратът не съдържа стабилизиращи вещества, разтварянето и разреждането на разтвора трябва да се извършат непосредствено преди апликацията. Разредените разтвори не трябва да се поставят в хладилник.

След разреждане, проведено съгласно препоръките, полученият разтвор има рН приблизително 11,0 и не трябва да се прилага перорално.

Препаратът ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции трябва да се съхранява в оригиналните опаковки в сухи помещения при температура до 25 гр. С.

Опаковка

10 флакона ХЕРПЕЗИН 250 мг суха субстанция за инжекции

Производител: Lachema - Вито, Чехия