

07.07.2016 № 1198/07-23

на № _____

ІНФОРМАЦІЙНИЙ ЛИСТ – ПОВІДОМЛЕННЯ

для медичних, фармацевтичних працівників та споживачів.

Важлива інформація з безпеки

про внесення змін в інструкцію для медичного застосування лікарського засобу **ЛАМІВУДИН**, розчин оральний, 10 мг/мл по 240 мл у банці, по 1 банці разом з шприцом місткістю 10 мл у пачці з картону, виробництва ПрАТ «Технолог»

ПрАТ «Технолог» повідомляє, що відповідно до оновленої інформації з безпеки оригінального (референтного) лікарського засобу, що містить у своєму складі ламівудин, були внесені зміни в інструкцію для медичного застосування у розділі:

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Основний механізм дії ламівудину – пригнічення зворотної транскриптази ВІЛ. Трифосфат ламівудину є селективним інгібітором реплікації ВІЛ-1 та ВІЛ-2 *in vitro*, він також активний відносно стійких до зидовудину штамів ВІЛ. Ламівудин у комбінації із зидовудином зменшує кількість ВІЛ-1 і збільшує кількість CD4-клітин, а також значно знижує ризик прогресування захворювання та летальності від нього.

Продемонстровано синергізм ламівудину і зидовудину щодо пригнічення реплікації ВІЛ у культурі клітин. Виявлено, що при виникненні резистентності до ламівудину у стійких до зидовудину штамів вірусу може відновитися чутливість до зидовудину. *In vitro* препарат виявляє слабку цитотоксичну дію на лімфоцити периферичної крові, лімфоцитарні та моноцитарно-макрофагальні клітинні лінії і клітини кісткового мозку, що свідчить про його широкий терапевтичний індекс.

Фармакокінетика.

Абсорбція. Ламівудин добре всмоктується зі шлунково-кишкового тракту, його біодоступність при пероральному застосуванні у дорослих становить 80-85 %. Максимальна концентрація у сироватці крові досягається в середньому через 1 годину і при застосуванні в середній терапевтичній дозі (4 мг/кг/добу у 2 прийоми з інтервалом 12 годин) становить 1-1,9 мкг/мл. Застосування ламівудину під час їди подовжує t_{max} і знижує C_{max} (до 47 %). Однак це не впливає на загальний рівень абсорбованого ламівудину (розрахованого на підставі фармакокінетичної кривої концентрація-час), тому препарат можна приймати незалежно від вживання їжі.

Розподіл. Середній об'єм розподілу становить 1,3 л/кг, середній період напіввиведення – 5-7 годин. Ламівудин має лінійний фармакокінетичний профіль у терапевтичних дозах і низьке зв'язування з білками плазми. Обмежені дані свідчать про проникнення ламівудину у центральну нервову систему і цереброспінальну рідину. Через 2-4 години після перорального застосування співвідношення концентрації ламівудину у спинномозковій рідині та плазмі становить 0,12. Клінічне значення цього явища невідоме.

Метаболізм. Вірогідність метаболічної взаємодії ламівудину є малою з огляду на низький рівень (5-10 %) печінкового метаболізму та низький рівень зв'язування з білками плазми крові.

Виведення. Середній системний кліренс ламівудину – приблизно 0,32 л/кг на годину, виводиться він головним чином нирками (> 70 %) шляхом активної тубулярної секреції, незначною мірою (< 10 %) – шляхом печінкового метаболізму. Активний метаболіт, внутрішньоклітинний ламівудину трифосфат, має подовжений час напіввиведення з клітини (від 16 до 19 годин) порівняно з періодом напіввиведення ламівудину (5-7 годин).

Елімінація ламівудину порушується при зниженні функції нирок незалежно від того, чи є це

