# Активель



## Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

## Фармакологические свойства:

***Фармакодинамика***

Комбинированный препарат, действие которого обусловлено входящими в его состав компонентами. Монофазный эстроген-гестагенный препарат.

17-бета-эстрадиол идентичен эндогенному эстрадиолу; стимулирует развитие матки, маточных труб, вторичных половых признаков при их недоразвитии, вызывает активацию регенерации и роста эндометрия в первой фазе менструального цикла, подготовку эндометрия к действию прогестерона, повышение либидо в середине цикла, влияет на обмен жиров, белков и углеводов, электролитов: снижает концентрацию липидов и холестерина в крови, регулирует азотистый обмен; стимулирует выработку печенью глобулинов, связывающих половые гормоны, ренин, ТГ и факторы свертывания крови.
Обладает умеренными центральными эффектами: устраняет вегетативно-сосудистые и психоэмоциональные расстройства. Играет важную роль в развитии костной ткани и формировании структуры костей, препятствует развитию остеопороза. Повышает возбудимость матки, в больших дозах угнетает лактацию, улучшает трофику мочеполовых органов и кожи, обладает слабым анаболическим действием.

Синтетический гестаген - норэтистерон обеспечивает переход слизистой оболочки матки из стадии пролиферации в секреторную фазу. Он уменьшает возбудимость и сократимость мускулатуры матки и маточных труб, стимулирует развитие концевых элементов молочных желез. Блокирует секрецию гипоталамических факторов высвобождения ЛГ и ФСГ в гипофизе, угнетает образование гонадотропных гормонов и тормозит овуляцию. Обладает незначительными андрогенными свойствами. Ослабление симптомов при приеме внутрь достигается в течение нескольких недель.

Не является контрацептивным средством.

***Фармакокинетика***

Активные вещества всасываются из ЖКТ.

После приема эстрадиола время достижения $C_{max}$ - 5-8 ч, $C_{max}$ - 35 пг/мл (21-52 пг/мл). Связь с белками: альбуминами - 61%, глобулинами - 37%, 1-2% - в несвязанном виде. $T_{1/2}$ - 12-14 ч.

Эстрадиол метаболизируется в печени с образованием эстрона, катехолэстрогенов, эстрогенсульфатов и глюкуронидов.

Выводится почками в виде метаболитов и частично в неизмененном виде, небольшое количество - через кишечник.

Эстрогены проникают в грудное молоко.

После перорального приема норэтистерона ацетат быстро абсорбируется и превращается в норэтистерон. Время достижения $C_{max}$ - 0.5-1.5 ч, $C_{max}$ - 3.9 нг/мл (1.4-6.8 нг/мл). Связь с белками: с альбуминами - 61%, глобулинами - 36%. $T_{1/2}$ - 8-11 ч.

Метаболизируется в печени с образованием 5-альфа-дигидро-норэтистерона и тетрагидро-норэтистерона, которые выводятся, главным образом, с мочой в виде сульфатных и глюкуронидных конъюгатов.

## Показания к применению:

— климактерические расстройства в постменопаузный период (не ранеее чем через 1 год после наступления менопаузы): "приливы", повышенное потоотделение, нарушения сна, раздражительность, депрессия, забывчивость, постменопаузный остеопороз, дегенеративные изменения кожи и слизистых оболочек (ломкость ногтей, истончение кожи, образование морщин, сухость слизистых оболочек мочеполовых органов).

— профилактика постменопаузного остеопороза (принадлежность к европейской или азиатской расе, низкорослость, дефицит массы тела, ранняя менопауза, остеопороз в семейном анамнезе, недостаточное поступление $Ca^{2+}$ с пищей, гиподинамия, курение, злоупотребление этанолом).

## Относится к болезням:

- Депрессия
- Остеопороз

## Противопоказания:

— гиперчувствительность;

— беременность;

— период лактации;

— острые или хронические заболевания печени;

— печеночная недостаточность;

— рак печени;

— врожденные гипербилирубинемии (синдромы Жильбера, Дубина-Джонсона и Ротора);

— гемангиома;

— нарушения мозгового кровообращения (ишемический инсульт, геморрагический инсульт);

— рак молочной железы и подозрение на него;

— рак эндометрия;

— гиперлипопротеинемия;

— идиопатическая желтуха (в т.ч. во время предшествующей беременности);

— герпес (в анамнезе);

— вагинальные кровотечения;

— метроррагия неясного генеза;

— ИБС;

— атеросклероз;

— порок сердца;

— миокардит.

С *осторожностью:* мигрень, эпилепсия, депрессия, сильная головная боль, сахарный диабет, диабетическая ангиопатия, бронхиальная астма, ХСН, отосклероз, рассеянный склероз, артериальная гипертензия, гиперлипопротеинемия, идиопатическая желтуха (в т.ч. во время предшествующей беременности), тромбоэмболическая болезнь, заболевания печени при нормальных функциональных тестах (в т.ч. порфирия) и желчного пузыря, лейомиома, эндометриоз, гиперплазия эндометрия, фиброаденома молочной железы, эстроген-зависимые опухоли, миома матки, мастопатия, язвенный колит, почечная недостаточность.

## Способ применения и дозы:

Внутрь, по 1 таб./сут ежедневно. Лечение начинают в любой день и проводят без перерыва.

## Побочное действие:

В первые месяцы лечения: спорадические менструальноподобные кровотечения, болезненное напряжение молочных желез, тошнота, головная боль, отечность.

После 3 мес лечения - боль в животе, метеоризм, желчнокаменная болезнь, изменение полового влечения, кандидоз, тромбозы, тромбоэмболия, повышение АД, головокружение, депрессия, судороги, гирсутизм, алопеция; кожная сыпь, зуд, хлоазма, мультиформная эритема, узловатая эритема, геморрагии, артралгия, миалгия, нарушение зрения, бессонница, увеличение или снижение веса.

## Передозировка:

*Симптомы:* рвота, тошнота.

*Лечение:* симптоматическое.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности, в период лактации.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Барбитураты, противоэпилептические лекарственные средства (карбамазепин, фенитоин) усиливают метаболизм стероидных гормонов.

Антибиотики (ампициллин, рифампицин), изменяя микрофлору кишечника, снижают эффективную концентрацию.

Средства для общей анестезии, наркотические анальгетики, анксиолитики, противоэпилептические лекарственные средства , некоторые гипотензивные лекарственные средства , этанол снижают эффективность.

При одновременном назначении может потребоваться коррекция режима дозирования гипогликемических лекарственных средств.

## Особые указания и меры предосторожности:

Назначают только женщинам, у которых последний менструальный цикл был не менее 1 года назад.

Перед началом лечения необходимо провести тщательное медицинское обследование, включающее измерение АД, исследование молочных желез и брюшной полости, гинекологическое обследование с целью исключения гиперплазии эндометрия.

Во время приема препарата каждые 6 мес следует проводить гинекологический контроль (анализ цитологического мазка шейки матки и исследование молочных желез).

Необходим регулярный контроль функции печени, АД, анализов мочи, липидов крови.

Лечение немедленно прекращают при возникновении беременности, мигренеподобных головных болей (если их не было ранее), признаков флебитов (непривычные боли или вздутие вен на ногах), желтухи, нарушения зрения, тромбов, цереброваскулярных расстройств, при возникновении колющих болей неясной этиологии при дыхании или кашле, при болях и чувстве стеснения в грудной клетке, повышении АД, учащении приступов эпилепсии, при обнаружении опухолей печени, за 6 нед до планового хирургического вмешательства, при длительной иммобилизации.

Если менструальноподобные кровотечения продолжаются более 3 мес или впервые появились после нескольких месяцев лечения, проводят диагностическое выскабливание для исключения злокачественных новообразований матки.

***При нарушениях функции почек***

С *осторожностью:* почечная недостаточность.

***При нарушениях функции печени***

Противопоказан при острых или хронических заболеваниях печени, печеночной недостаточности, раке печени.

С *осторожностью:* заболевания печени при нормальных функциональных тестах (в т.ч. порфирия).

**Источник:** http://drugs.thead.ru/Aktivel