Анастрозол



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Анастрозол

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Противоопухолевые средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоопухолевое средство. Является селективным нестероидным ингибитором ароматазы. В постменопаузе эстрадиол в основном образуется из эстрона, который продуцируется в периферических тканях путем превращения из андростендиона (при участии фермента ароматазы). Снижение уровня циркулирующего эстрадиола оказывает терапевтический эффект у женщин с раком молочной железы. В постменопаузе анастрозол в суточной дозе 1 мг вызывает снижение уровня эстрадиола на 80%. Анастрозол не обладает прогестагенной, андрогенной и эстрогенной активностью; в терапевтических дозах не влияет на секрецию кортизола и альдостерона.

Фармакокинетика

После приема внутрь анастрозол быстро абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается в течение 2 ч (натощак). Пища несколько уменьшает скорость, но не степень всасывания. Связывание с белками плазмы составляет 40%. Сведений о кумуляции нет.

Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием, гидроксилированием и глюкуронизацией. Триазол, основной метаболит, определяемый в плазме и моче, не ингибирует ароматазу.

Анастрозол и его метаболиты выводятся, в основном, с мочой, (менее 10% - в неизмененном виде), в течение 72 ч после введения однократной дозы. $T_{1/2}$ из плазмы - 40-50 ч.

Клиренс анастрозола после приема внутрь у добровольцев со стабилизированным циррозом печени или нарушением функции почек не отличается от клиренса, определяемого у здоровых добровольцев.

Фармакокинетика анастрозола у женщин в постменопаузе не изменяется.

Показания к применению:

Рак молочной железы в постменопаузе.

Противопоказания:

Период пременопаузы, выраженная почечная недостаточность (КК менее 20 мл/мин), умеренная и выраженная печеночная недостаточность, беременность, лактация, детский возраст, повышенная чувствительность к анастрозолу.

Способ применения и дозы:

Внутрь - по 1 мг 1 раз/сут.

Побочное действие:

Со стороны эндокринной системы: "приливы", сухость влагалища и истончение волос.

Со стороны пищеварительной системы: анорексия, тошнота, рвота, диарея. У пациенток с распространенным раком молочной железы в большинстве случаев с метастазами в печень отмечались повышение уровня ГГТ, реже - ЩФ.

Со стороны ЦНС: астения, сонливость, головная боль.

Со стороны обмена веществ: небольшой подъем уровня общего холестерина.

Аллергические реакции: кожная сыпь.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Анастрозол снижает эффективность эстрогенов.

Клинические исследования показали, что при одновременном применении анастрозола с антипирином и циметидином лекарственное взаимодействие, обусловленное индукцией микросомальных ферментов печени, маловероятно.

Особые указания и меры предосторожности:

В случае неопределенности гормонального статуса пациентки состояние менопаузы необходимо подтвердить дополнительными биохимическими исследованиями.

Безопасность применения анастрозола у пациентов с умеренными нарушениями функции печени не установлена.

Анастрозол не следует применять одновременно с эстрогенами.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения не следует выполнять работу, требующую высокой концентрации внимания и быстрых психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказание: выраженная почечная недостаточность (КК менее 20 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказание: умеренная и выраженная печеночная недостаточность.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст.

Источник: http://drugs.thead.ru/Anastrozol