Анастрозол-Тева



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]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "93" на одной стороне и "A10" на другой.

	1 таб.
анастрозол	1 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (200 меш), лактозы моногидрат (высушенный распылением), повидон К30, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А), магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: опадрай белый 02G28619 (гипромеллоза (Е464), титана диоксид (Е171), макрогол 6000, макрогол 400)

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоопухолевый препарат, ингибитор синтеза эстрогенов.

Анастрозол является высокоселективным нестероидным ингибитором ароматазы - фермента, с помощью которого у женщин в постменопаузе андростендион в периферических тканях превращается в эстрон и далее в эстрадиол. Снижение концентрации циркулирующего эстрадиола у пациенток с раком молочной железы оказывает терапевтический эффект. У женщин в постменопаузе анастрозол в суточной дозе 1 мг вызывает снижение концентрации эстрадиола на 80%.

Анастрозол не обладает гестагенной, андрогенной и эстрогенной активностью. В суточных дозах до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и альдостерона, следовательно, при применении анастрозола не требуется заместительного введения кортикостероидов.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После приема внутрь анастрозол быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови обычно достигается в течение 2 ч

после приема внутрь (натощак). Пища незначительно уменьшает скорость всасывания, но не его степень и не приводит к клинически значимому влиянию на C_{ss} препарата в плазме крови при однократном приеме суточной дозы анастрозола.

После 7-дневного приема препарата достигается приблизительно 90-95% C_{ss} анастрозола в плазме крови. Сведений о зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени или дозы нет. Связывание с белками плазмы крови - 40%.

Метаболизм и выведение

Анастрозол экстенсивно метаболизируется у женщин в постменопаузе, при этом менее 10% выводится почками в неизмененном виде в течение 72 ч после приема препарата. $T_{1/2}$ анастрозола из плазмы крови составляет 40-50 ч. Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием, гидроксилированием и глюкуронидацией. Метаболиты анастрозола выводятся преимущественно почками. Основной метаболит анастрозола - триазол, определяемый в плазме крови, не обладает фармакологической активностью.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста женщин в постменопаузе.

Клиренс анастрозола после перорального приема при циррозе печени или нарушении функции почек не изменяется.

Показания к применению:

— адъювантная терапия раннего рака молочной железы с положительными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе;

— первая линия терапии местно-распространенного рака молочной железы, с положительными или неизвестными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе;

— вторая линия терапии распространенного рака молочной железы, прогрессирующего после лечения тамоксифеном.

Относится к болезням:

- Рак

Противопоказания:

— пременопаузный период;

— выраженная печеночная недостаточность (безопасность и эффективность не установлены);

— сопутствующая терапия тамоксифеном или препаратами, содержащими эстрогены;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский возраст (безопасность и эффективность у детей не установлена);

— повышенная чувствительность к анастрозолу или другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при остеопорозе, гиперхолестеринемии, ИБС, нарушении функции печени, почечной недостаточности тяжелой степени (КК <20 мл/мин), недостаточности лактазы, непереносимости лактозы, мальабсорбции глюкозы/галактозы (в лекарственной форме препарата содержится лактоза).

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь. Таблетку проглатывают целиком, запивая водой. Рекомендуется принимать препарат в одно и то же время вне зависимости от приема пищи.

Взрослым, включая пожилых, назначают по 1 мг внутрь 1 раз/сут длительно. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить. В качестве адъювантной терапии рекомендуемая продолжительность лечения - 5 лет.

При **нарушении функции почек** коррекция дозы не требуется.

Коррекция дозы у **пациентов с легкой и умеренной степенью нарушения функции печени** не требуется.

Побочное действие:

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующим критериям: очень часто (≥ 1/10), часто (> 1/100, < 1/10); иногда (> 1/1000, < 1/100); редко (> 1/10 000, < 1/1000); очень редко (< 1/10 000), включая отдельные сообщения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - приливы крови к лицу.

Со стороны костно-мышечной системы: очень часто - артралгия; редко - триггерный палец.

Со стороны половой системы: часто - сухость слизистой оболочки влагалища, влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или замены предшествующей гормональной терапии на анастрозол).

Дерматологические реакции: очень часто - кожная сыпь; часто - истончение волос, алопеция; очень редко - полиморфная эритема (синдром Стивенса-Джонсона).

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - тошнота; часто - диарея, рвота, анорексия.

Со стороны гепатобилиарной системы: повышение активности АЛТ, АСТ и ЩФ; редко - повышение активности ГГТ и концентрации билирубина, гепатит.

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; часто - повышенная сонливость, синдром запястного канала (в основном наблюдался у пациенток с факторами риска по данному заболеванию).

Со стороны обмена веществ: часто - гиперхолестеринемия. Прием препарата может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани в связи со снижением концентрации циркулирующего эстрадиола, тем самым повышая риск возникновения остеопороза и переломов костей.

Аллергические реакции: часто - аллергические реакции; очень редко - анафилактоидные реакции, ангионевротический отек, крапивница, анафилактический шок.

Прочие: очень часто - астения.

Передозировка:

Описаны единичные клинические случаи случайной передозировки препарата. Разовая доза анастрозола, которая могла бы привести к симптомам, угрожающим жизни, не установлена.

Лечение: специфического антидота не существует, в случае передозировки проводят симптоматическую терапию. Можно индуцировать рвоту, если пациент находится в сознании. Может быть проведен диализ. Рекомендуется общая поддерживающая терапия, наблюдение за пациентом и контроль функций жизненно важных органов и систем.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано назначение препарата при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Исследования по лекарственному взаимодействию с феназоном и циметидином указывают на то, что совместное применение анастрозола с другими препаратами вряд ли приведет к клинически значимому лекарственному взаимодействию, опосредованному цитохромом Р450.

Клинически значимое лекарственное взаимодействие при приеме анастрозола одновременно с другими часто назначаемыми препаратами отсутствует.

На данный момент нет сведений о применении анастрозола в комбинации с другими противоопухолевыми препаратами.

Препараты, содержащие эстрогены, уменьшают фармакологическое действие анастрозола, в связи с чем они не должны назначаться одновременно с анастрозолом.

Не следует назначать тамоксифен одновременно с анастрозолом поскольку он может ослабить фармакологическое действие последнего.

Особые указания и меры предосторожности:

В случае сомнений в гормональном статусе пациентки, менопауза должна быть подтверждена определением концентрации половых гормонов в сыворотке крови. В случае сохраняющегося маточного кровотечения на фоне приема анастрозола необходима консультация и наблюдение гинеколога.

Нет данных о применении анастрозола у пациенток с тяжелой степенью нарушений функции печени.

У пациенток с остеопорозом или с повышенным риском развития остеопороза, минеральную плотность костной ткани следует оценивать методом денситометрии, например, DEXA-сканированием (двухэнергетическая рентгеновская абсорбциометрия), в начале лечения и регулярно на его протяжении. При необходимости следует назначать лечение или профилактику остеопороза и тщательно наблюдать за состоянием пациентки. Поскольку анастрозол снижает концентрацию циркулирующего эстрадиола, это может привести к снижению минеральной плотности костной ткани. На настоящий момент отсутствуют достаточные данные относительно положительного влияния бисфосфонатов на потерю минеральной плотности костной ткани, вызванной анастрозолом или их пользы при применении с целью профилактики.

Нет данных об одновременном применении анастрозола и препаратов-аналогов ГнРГ.

У женщин с рецептор-отрицательной опухолью к эстрогенам эффективность анастрозола не была продемонстрирована, кроме тех случаев, когда имелся предшествующий положительный клинический ответ на тамоксифен.

Препараты, содержащие эстрогены, не должны назначаться одновременно с анастрозолом, т.к. эти препараты будут нивелировать его фармакологическое действие.

Эффективность и безопасность анастрозола и тамоксифена при их одновременном применении вне зависимости от статуса гормональных рецепторов сравнимы с таковыми при использовании одного тамоксифена. Точный механизм данного явления пока не известен.

Неизвестно, улучшает ли анастрозол результаты лечения при совместном использовании с химиотерапией.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Некоторые побочные реакции анастрозола, такие как астения и сонливость, могут отрицательно влиять на способность выполнения потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В этой связи рекомендуется при появлении этих симптомов соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами.

При нарушениях функции почек

При **нарушении функции почек** коррекция дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Коррекция дозы у пациентов с **легкой и умеренной степенью нарушения функции печени** не требуется.

Противопоказано назначение препарата при выраженной печеночной недостаточности (безопасность и эффективность не установлены)

Применение в детском возрасте

Безопасность и эффективность у детей не установлена, назначение противопоказано

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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