Андроблок



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бикалутамид

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 "485" на одной стороне; на поперечном разрезе - белого или почти белого цвета.

	1 таб.
бикалутамид	50 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 132 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 12.5 мг, повидон К30 - 5 мг, магния стеарат - 0.5 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II (33F28627) - 6 мг (гипромеллоза 2910, лактозы моногидрат, титана диоксид (Е171), макрогол 3000).

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоопухолевый препарат, антиандрогенный нестероидный препарат. Бикалутамид представляет собой рацемическую смесь с нестероидной антиандрогенной активностью преимущественно (R)-энантиомера. не обладает иной эндокринной активностью. Бикалутамид связывается с андрогенными рецепторами и, не активируя экспрессию генов, подавляет стимулирующее влияние андрогенов. Результатом этого является регрессия злокачественных новообразований предстательной железы. У некоторых пациентов прекращение приема бикалутамида может привести к развитию клинического "синдрома отмены антиандрогенов".

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После приема внутрь быстро и полностью всасывается из ЖКТ. Прием пищи не влияет на всасывание.

При ежедневном приеме бикалутамида концентрация (R)-энантиомера в плазме увеличивается примерно в 10 раз вследствие длительного $T_{1/2}$, что делает возможным прием препарата 1 раз/сут При ежедневном приеме бикалутамида в дозе 50 мг C_{ss}(R)-энантиомера в плазме составляет около 9 мкг/мл. При приеме 150 мг бикалутамида ежедневно C_{ss}(R)-энантиомера составляет приблизительно 22 мкг/мл. При равновесном состоянии около 99% всех циркулирующих в крови энантиомеров составляет активный (R)-энантиомер.

Связывание с белками плазмы высокое (для рацемической смеси 96%, для (R)-энантиомера 99.6%).

Метаболизм и выведение

Интенсивно метаболизируется в печени (путем окисления и образования конъюгатов с глюкуроновой кислотой). Метаболиты выводятся с мочой и желчью примерно в равных соотношениях.

(S)-энантиомер выводится из организма гораздо быстрее (R)-энантиомера. $T_{1/2}$ последнего -около 7 дней.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

На фармакокинетику (R)-энантиомера не влияют возраст, нарушение функции почек, легкое и умеренное нарушение функции печени. Имеются данные о том, что у больных с тяжелыми нарушениями функции печени замедляется элиминация (R)-энантиомера из плазмы.

Показания к применению:

— бикалутамид в дозе 50 мг в комбинации с аналогом ГнРГ (гонадотропин-рилизинг гормона) или хирургической кастрацией показан для лечения распространенного рака предстательной железы;

— бикалутамид в дозе 150 мг показан для лечения местно-распространенного рака предстательной железы (Т3-Т4, любая N, M0; T1-T2, N+, M0) в качестве монотерапии или адъювантной терапии в сочетании с радикальной простатэктомией или радиотерапией;

— бикалутамид в дозе 150 мг также показан для лечения местно-распространенного, неметастатического рака предстательной железы в случаях, когда хирургическая кастрация или другие медицинские вмешательства неприемлемы или неприменимы.

Относится к болезням:

- Простатит
- Рак

Противопоказания:

— одновременный прием с терфенадином, астемизолом и цизапридом;

— бикалутамид не должен назначаться детям и женщинам;

— повышенная чувствительность к бикалутамиду и вспомогательным компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при нарушении функции печени, непереносимости лактозы, лактазной недостаточности или мальабсорбции глюкозы/галактозы.

Способ применения и дозы:

Внутрь, вне зависимости от приема пищи, желательно в одно и то же время.

Взрослые и пожилые мужчины:

При *распространенном раке предстательной железы в комбинации с аналогом ГнРГ (гонадотропин-рилизинг гормона) или хирургической кастрацией:* внутрь по 50 мг 1 раз/сут. Лечение бикалутамидом необходимо начинать одновременно с началом приема аналога ГнРГ или хирургической кастрацией.

При *местно-распространенном раке предстательной железы:* внутрь по 150 мг 1 раз/сут. Бикалутамид следует принимать длительно, как минимум в течение 2-х лет. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить.

Пациенты с нарушением функции почек: не требуется изменения режима дозирования.

Пациенты с нарушением функции печени: не требуется изменения режима дозирования. Возможно увеличение кумуляции препарата в организме пациентов с тяжелой степенью печеночной недостаточности

Побочное действие:

Фармакологическое действие бикалутамида может обуславливать следующие побочные эффекты:

Очень часто (>10%): гинекомастия (может сохраняться даже после прекращения терапии, особенно в случае приема препарата в течение длительного времени), болезненность грудных желез, "приливы" крови к лицу, снижение полового влечения, сексуальные дисфункции;

Часто (>1%, но <10%): диарея, тошнота, транзиторное повышение активности печеночных трансаминаз. холестаз и желтуха (описанные изменения функции печени редко оценивались, как серьезные, носили транзиторный характер, полностью исчезали или уменьшались при продолжении терапии или после отмены препарата), зуд, астения; при применении препарата в суточной дозе 150 мг - алопеция или восстановление роста волос, увеличение массы тела.

Редко (> 0.1%, но <1%): реакции повышенной чувствительности, включая ангионевротический отек и крапивницу, интерстициальные легочные заболевания: при применении препарата в суточной дозе 150 мг - боль в животе, депрессия, диспепсия, гематурия.

Очень редко (> 0.01%, но <0.1%): рвота, сухость кожи (при применении препарата в суточной дозе 150 мг сухость кожи наблюдается часто), печеночная недостаточность (причинно-следственная связь с приемом бикалутамида достоверно не установлена). При одновременном применении бикалутамида и аналогов ГнРГ могут также наблюдаться указанные ниже побочные явления с частотой > 1% (причинно-следственная связь с приемом препарата не установлена, некоторые из отмеченных побочных эффектов встречались у пожилых пациентов):

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердечная недостаточность, стенокардия, нарушения проводимости, включая удлинение интервалов PR и QT, нарушения ритма, неспецифические изменения на ЭКГ, повышение АД, инфаркт миокарда, обморок.

Со стороны пищеварительной системы: желудочное кровотечение, анорексия, сухость во рту, диспепсия, запор, метеоризм, периодонтальный абсцесс, рак желудка/кишечника.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, бессонница, тревожность, сонливость, невропатия.

Со стороны дыхательной системы: одышка, боль в груди, кашель, фарингит, бронхит, пневмония, ринит, бронхоспазм, носовое кровотечение.

Со стороны мочевыделительной системы: никтурия, дизурия, задержка мочи, отеки, учащенное мочеиспускание, гидронефроз, инфекции.

Со стороны системы кроветворения: анемия.

Дерматологические реакции: алопеция, кожная сыпь, повышенная потливость, гирсутизм, сухость кожи, герпетическая инфекция, рак кожи.

Со стороны костно-мышечной системы: миастения, миалгия, судороги, артрит, контрактуры суставов, боли в костях, судороги в ногах.

Со стороны лабораторных показателей: гипергликемия, повышение активности ЩФ, гиперкреатининемия. гиперхолестеринемия, гипербилирубинемия.

Прочие: сахарный диабет, полиурия, повышение или снижение массы тела, боль в животе, груди, тазовой области, сексуальные дисфункции, развитие опухолевого процесса, озноб, дегидратация, подагра, катаракта.

Передозировка:

Нет данных о случаях передозировки препарата у людей.

Лечение: симптоматическое. Специфического антидота не существует. Диализ малоэффективен, так как бикалутамид в высокой степени связывается с белками плазмы и не обнаруживается в моче в неизмененном виде. Показаны общие мероприятия, включающие мониторинг жизненно важных показателей работы сердца и органов дыхания.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Бикалутамид нельзя назначать при беременности и в период лактции.

Результатом применения бикалутамида беременными крысами была феминизация потомства мужского пола, сопровождавшаяся анаспадией вне зависимости от дозы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Нет данных о фармакокинетаческих или фармакодинамических взаимодействиях между бикалутамидом и аналогами ГнРГ (гонадотропин-рилизинг гормона).

В исследованиях in vitro показано, что (R)-энантиомер бикалутамида ингибирует изофермент CYP3A4, в меньшей степени влияя на активность изоферментов CYP2C9, 2C19 и 2D6.

Потенциальной способности бикалутамида к взаимодействию с другими лекарственными препаратами не обнаружено, однако при использовании бикалутамида в течение 28 дней на фоне приема мидазолама, площадь под кривой AUC мидазолама увеличивается на 80%.

Несовместим с терфенадином, астемизолом, цизапридом.

Следует соблюдать осторожность при назначении бикалутамида одновременно с циклоспорином или блокаторами кальциевых каналов. Возможно, потребуется снижение дозы этих препаратов, особенно в случае потенцирования или развития побочных явлений.

После начала использования или отмены бикалутамида рекомендуют проводить тщательный мониторинг концентрации циклоспорина в плазме и клинического состояния пациента.

Одновременное применение бикалутамида и препаратов, угнетающих микросомальное окисление лекарственных средств, например, с циметидином или кетоконазолом может привести к увеличению концентрации бикалутамида в плазме и возможно к увеличению частоты возникновения побочных эффектов.

Усиливает действие антикоагулянтов кумаринового ряда, варфарина (конкуренция за связь с белками).

Особые указания и меры предосторожности:

Редкие случаи летального исхода или госпитализации, связанные с приемом бикалутамида, были зафиксированы после выхода препарата на рынок у людей с тяжелыми нарушениями печени. Гепатотоксичность наблюдалась в первые 3-4 месяца приема. Гепатит или значительные повышения печеночных ферментов, вызывающие необходимость отмены препарата, наблюдались у 1% пациентов. Уровень трансаминаз в плазме крови нужно измерять до начала лечения бикалутамидом, а также регулярно в течение первых четырех месяцев лечения и некоторое время после. При появлении симптомов печеночной дисфункции необходимо срочно измерить уровень трансаминаз в плазме крови. При появлении желтухи или повышении уровня аланинтрансфераз более чем в два раза следует прекратить прием бикалутамида.

Пациентов с непереносимостью лактозы необходимо проинформировать о том, что каждая таблетка бикалутамида 50 мг содержит 132 мг моногидрата лактозы.

У пациентов с прогрессированием заболевания на фоне повышения концентрации простатспецифического антигена (ПСА) необходимо рассмотреть вопрос о прекращении лечения препаратом.

Рекомендуется регулярно контролировать протромбиновое время при назначении бикалутамида пациентам, получающим непрямые антикоагулянты кумаринового ряда.

У пациентов, принимающих агонисты ГнРГ, наблюдалось снижение переносимости глюкозы. Этот эффект может приводить к развитию сахарного диабета или снижению толерантности к глюкозе у пациентов с сахарным диабетом.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Бикалутамид не влияет на способность пациентов управлять транспортными средствами или заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Пациенты с нарушением функции почек: не требуется изменения режима дозирования.

При нарушениях функции печени

Пациенты с нарушением функции печени: не требуется изменения режима дозирования. Возможно увеличение кумуляции препарата в организме пациентов с тяжелой степенью печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

Взрослые и пожилые мужчины:

При *распространенном раке предстательной железы в комбинации с аналогом ГнРГ (гонадотропин-рилизинг гормона) или хирургической кастрацией:* внутрь по 50 мг 1 раз/сут. Лечение бикалутамидом необходимо начинать одновременно с началом приема аналога ГнРГ или хирургической кастрацией.

При *местно-распространенном раке предстательной железы:* внутрь по 150 мг 1 раз/сут. Бикалутамид следует принимать длительно, как минимум в течение 2-х лет. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить.

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Не использовать после истечения срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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