Аримидекс



Код АТХ:

- L02BG03

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 оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, на одной стороне с гравировкой "A", на другой стороне - "Adx" и "1" в виде дроби.

	1 таб.
анастрозол	1 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, повидон, карбоксиметиленкрахмал натрия, магния стеарат, вода очищенная.

Состав оболочки: макрогол 300, гипромеллоза, титана диоксид, вода очищенная.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Противоопухолевые средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Высокоселективный нестероидный ингибитор ароматазы. Ароматаза - фермент, при помощи которого у женщин в постменопаузе андростендион в периферических тканях превращается в эстрон и далее в эстрадиол. Снижение уровня циркулирующего эстрадиола оказывает терапевтический эффект у больных раком молочной железы. В постменопаузе препарат в суточной дозе 1 мг вызывает снижение уровня эстрадиола на 80%.

Аримидекс не обладает прогестагенной, андрогенной и эстрогенной активностью.

Аримидекс в суточной дозе до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и альдостерона (следовательно, при применении препарата не требуется заместительного введения кортикостероидов).

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь анастрозол быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается в течение 2 ч (натощак). Пища несколько уменьшает скорость, но не степень всасывания. Небольшие изменения скорости всасывания не приводят к клинически значимому влиянию на C_{ss} препарата в плазме при ежедневном приеме 1 таб. Аримидекса.

Распределение

Анастрозол связывается с белками плазмы на 40%. Приблизительно 90-95% от C_{ss} достигается после 7 дней приема препарата. Нет сведений о кумуляции препарата и зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени и дозы.

Метаболизм

Анастрозол метаболизируется путем N-деалкилирования, гидроксилирования и глюкуронизации. Триазол, основной метаболит, определяемый в плазме, не ингибирует ароматазу.

Выведение

Анастрозол выводится медленно, $T_{1/2}$ - 40-50 ч.

Анастрозол и его метаболиты выводятся, в основном, с мочой (менее 10% выведенной дозы - в неизмененном виде), в течение 72 ч после приема препарата.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

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

Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста у женщин в постменопаузе.

Показания к применению:

— адъювантная терапия раннего гормоноположительного рака молочной железы у женщин в постменопаузе;

— лечение распространенного рака молочной железы у женщин в постменопаузе;

— адъювантная терапия раннего гормоноположительного рака молочной железы у женщин в постменопаузе после терапии тамоксифеном в течение 2-3 лет.

Относится к болезням:

- Рак

Противопоказания:

— почечная недостаточность тяжелой степени (клиренс креатинина менее 20 мл/мин);

— печеночная недостаточность средней и тяжелой степени (безопасность и эффективность не установлены);

— сопутствующая терапия тамоксифеном;

— детский возраст (безопасность и эффективность не установлены);

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к анастрозолу и другим компонентам препарата.

Препарат не назначают женщинам в пременопаузе.

Способ применения и дозы:

Взрослым, включая пожилых пациентов, препарат 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.

Пациентам с легкими и умеренно выраженными нарушениями функции почек не требуется коррекции дозы.

Пациентам с легкими нарушениями функции печени не требуется коррекции дозы.

Таблетку следует проглотить целиком и запить водой. Рекомендуется принимать препарат в одно и то же время суток.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций: очень часто (>10%); часто (1-10%); редко (0.1-1%); очень редко (<0.1%).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - приливы.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - артралгия.

Со стороны репродуктивной системы: часто - сухость влагалища; редко - влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или смены предшествующей гормональной терапии на Аримидекс).

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, диарея; редко - анорексия, рвота, увеличение активности ГГТ и ЩФ.

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

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

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

Аллергические реакции: очень редко - ангионевротический отек, крапивница, анафилактический шок.

Прочие: часто - астения.

Передозировка:

Описаны единичные клинические случаи передозировки препарата. Разовая доза Аримидекса, при которой развиваются угрожающие жизни симптомы, не установлена.

Лечение: специфического антидота не существует. При необходимости проводят симптоматическую терапию: индуцирование рвоты (если больной в сознании), общая поддерживающая терапия, наблюдение за больным и контроль за функцией жизненно важных органов и систем. Возможно проведение диализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Клинические исследования по лекарственному взаимодействию с антипирином и циметидином указывают на то, что совместное введение Аримидекса с другими препаратами вряд ли приведет к клинически значимому взаимодействию, обусловленному цитохромом Р450.

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

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

Препараты, содержащие эстрогены, не следует назначать одновременно с Аримидексом, т.к. они уменьшают

фармакологическое действие последнего.

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

Особые указания и меры предосторожности:

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

В случае сомнений в гормональном статусе пациентки менопауза должна быть подтверждена определением половых гормонов в сыворотке крови.

Нет данных о безопасности применения Аримидекса у пациентов с выраженными нарушениями функции печени или у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 20 мл/мин).

В случае сохраняющегося маточного кровотечения на фоне приема Аримидекса необходима консультация и наблюдение гинеколога.

Препараты, содержащие эстрогены, не следует назначать одновременно с Аримидексом.

Снижая уровень циркулирующего эстрадиола, Аримидекс может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани.

У пациенток с остеопорозом или с риском развития остеопороза минеральная плотность костной ткани должна оцениваться методом денсиометрии (например, DEXA сканированием) в начале лечения и в динамике. При необходимости должны быть начаты лечение или профилактика остеопороза под тщательным наблюдением врача.

Нет данных об одновременном применении анастрозола и препаратов аналогов ГнРГ.

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

Данные по безопасности при длительном лечении анастрозолом пока не получены.

При применении Аримидекса чаще, чем при терапии тамоксифеном, наблюдались ишемические заболевания, однако статистической значимости при этом не отмечено.

Эффективность и безопасность Аримидекса 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.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения препарата у детей не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Некоторые побочные эффекты Аримидекса, такие как астения и сонливость, могут отрицательно влиять на способность к выполнению работы, требующей повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В связи с этим рекомендуется при появлении этих симптомов соблюдать осторожность при управлении автомобилем или движущимися механизмами.

При нарушениях функции почек

Пациентам с легкими и умеренно выраженными нарушениями функции почек не требуется коррекции дозы.

Противопоказан при почечной недостаточности тяжелой степени (клиренс креатинина менее 20 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Пациентам с легкими нарушениями функции печени не требуется коррекции дозы.

Противопоказан при умеренной или выраженой печеночной недостаточности (безопасность и эффективность не установлены).

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан к применению у детей (безопасность и эффективность не установлены).

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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