Аромазин



Код АТХ:

- L02BG

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Эксеместан

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 сахарной оболочкой белого или белого с сероватым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые; с маркировкой "7663" на одной стороне, выполненной черной краской.

	1 таб.
эксеместан	25 мг

Вспомогательные вещества: маннит, гипромеллоза, полисорбат 80, кросповидон, кремния диоксид коллоидный гидратированный, целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал, магния стеарат.

Состав сахарной оболочки: гипромеллоза, симетиконовая эмульсия, макрогол 6000, магния карбонат, титана диоксид, метил-п-гидроксибензоат, поливиниловый спирт, сахароза.

15 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Гормоны и их антагонисты
- Противоопухолевые средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Необратимый стероидный ингибитор ароматазы, сходный по структуре с природным веществом андростендионом.

У женщин в постменопаузе эстрогены продуцируются преимущественно путем превращения андрогенов в эстрогены под действием фермента ароматазы в периферических тканях. Блокирование образования эстрогенов путем ингибирования ароматазы является эффективным и избирательным методом лечения гормонозависимого рака молочной железы у женщин в постменопаузе. Механизм действия препарата Аромазин обусловлен тем, что он

необратимо связывается с активным фрагментом фермента, вызывая его инактивацию. У женщин в постменопаузе Аромазин достоверно снижает концентрацию эстрогенов в сыворотке крови, начиная с дозы 5 мг, причем максимальное снижение (>90%) достигается при применении доз 10-25 мг. У пациенток в постменопаузе с диагнозом рак молочной железы, получавших 25 мг препарата ежедневно, общий уровень фермента ароматазы в организме снижался на 98%.

Эксеместан не обладает прогестагенной и эстрогенной активностью. Выявляется лишь незначительная андрогенная активность, преимущественно при применении в высоких дозах.

Аромазин не оказывает влияния на биосинтез кортизола и альдостерона в надпочечниках, что подтверждает избирательность действия препарата. В связи с этим нет необходимости в заместительной терапии глюкокортикоидами и минералокортикоидами.

При применении препарата даже в низких дозах наблюдается незначительное увеличение содержания ЛГ и ФСГ в сыворотке крови, что является характерным для препаратов данной фармакологической группы и, вероятно, развивается по принципу обратной связи на уровне гипофиза: снижение концентрации эстрогенов стимулирует секрецию гонадотропинов в гипофизе также и у женщин в постменопаузе.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь эксеместан быстро всасывается, в основном, из ЖКТ. Абсолютная биодоступность препарата не установлена. Предполагают, что она ограничена экстенсивным эффектом первого прохождения через печень. При однократном приеме препарата в дозе 25 мг C_{max} в плазме составляет 17 нг/мл и достигается через 2 ч. Одновременный прием пищи увеличивает биодоступность препарата на 40%.

Фармакокинетические параметры эксеместана носят линейный характер.

Распределение

Связь с белками плазмы - приблизительно 90%. Эксеместан и его метаболиты не связываются с эритроцитами. При повторном приеме непрогнозируемой кумуляции эксеместана не наблюдается.

Метаболизм

Процесс биотрансформации эксеместана осуществляется путем окисления метиленовой группы в 6 позиции под действием изофермента CYP3A4 и/или восстановления 17-кетогруппы под действием альдокеторедуктазы с последующей конъюгацией. Продукты метаболизма эксеместана либо неактивны, либо менее активны в отношении ингибирования ароматазы, чем исходное соединение.

Выведение

Конечный $T_{1/2}$ составляет приблизительно 24 ч. Примерно равные количества эксеместана (около 40%) выводятся с мочой и калом в течение недели. От 0.1 до 1% выводится с мочой в неизменном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Выраженной связи между системным воздействием препарата и возрастом не установлено.

У пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК < 30 мл/мин) системное воздействие эксеместана в 2 раза выше, однако коррекции дозы не требуется.

У пациентов с умеренной или тяжелой печеночной недостаточностью системное воздействие эксеместана в 2-3 раза выше, однако коррекции дозы не требуется.

Показания к применению:

— распространенный рак молочной железы у женщин в естественной или индуцированной постменопаузе при прогрессировании заболевания на фоне антиэстрогенной терапии, а также при прогрессировании заболевания после неоднократного применения различных видов гормональной терапии;

— адъювантная терапия раннего рака молочной железы у женщин в постменопаузе с эстроген-положительными рецепторами или с неизвестным рецепторным статусом, после завершения 2-3-летней первоначальной адъювантной терапии тамоксифеном, с целью снижения риска рецидивов (отдаленных или региональных), а также контралатерального рака молочной железы.

Относится к болезням:

- Рак
- Рак молочной железы

Противопоказания:

— пременопаузный эндокринный статус;

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к эксеместану или к любому другому компоненту препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при нарушении функции печени или почек.

Способ применения и дозы:

Назначают внутрь. Для **взрослых и пациенток пожилого возраста** рекомендуемая доза составляет 25 мг 1 раз/сут предпочтительно после приема пищи.

При раннем раке молочной железы лечение препаратом рекомендуется продолжать до тех пор, пока общая длительность последовательной адъювантной гормональной терапии не достигнет 5 лет. Лечение больных распространенным раком молочной железы длительное. При появлении признаков прогрессирования опухолевого заболевания или при появлении контралатерального рака молочной железы лечение Аромазином следует прекратить.

При **печеночной или почечной недостаточности** коррекции дозы не требуется.

Не рекомендуется использовать препарат у **детей**.

Побочное действие:

Нежелательные эффекты при применении препарата в дозе 25 мг/сут являются незначительными или умеренно выраженными.

Ниже перечислены нежелательные реакции, распределенные по системам организма и частоте: очень часто (>10%), часто (>1%, <10%), нечасто (>0.1%, <1%), редко (>0.01%, <0.1%).

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - тошнота; часто - анорексия, боль в области живота, рвота, запор, диспепсия, диарея.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: очень часто - бессонница, головная боль; часто - депрессия, головокружение, синдром запястного канала.

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

Дерматологические реакции: очень часто - потливость; часто - сыпь, алопеция.

Со стороны костно-мышечной системы: очень часто - суставные и скелетно-мышечные боли.

Прочие: очень часто - повышенная утомляемость; часто - боль неуточненной локализации, периферические отеки или отеки ног.

Примерно у 20% больных (особенно у пациенток с исходной лимфопенией) наблюдалось периодическое снижение числа лимфоцитов. Однако среднее число лимфоцитов у этих больных со временем существенно не менялось, и сопутствующего увеличения заболеваемости вирусными инфекциями не наблюдалось.

Иногда наблюдали повышение активности печеночных ферментов и ЩФ, преимущественно у пациенток с метастазами в печень и в кости, а также при наличии других поражений печени (не установлено, связаны ли эти изменения с приемом препарата или нет).

Передозировка:

Однократная доза препарата, которая могла бы вызвать появление опасных для жизни симптомов, не установлена. Применение эксеместана в разовой дозе до 800 мг у здоровых женщин и в суточной дозе до 600 мг у женщин в постменопаузе с распространенным раком молочной железы хорошо переносились.

Лечение: специфических антидотов нет. При необходимости следует проводить симптоматическую терапию, а также регулярный контроль жизненно важных функций и тщательное наблюдение.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Аромазин противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Препараты, содержащие эстрогены, при одновременном применении с Аромазином полностью нивелируют его фармакологическое действие.

Эксеместан подвергается метаболизму под влиянием CYP3A4 и альдокеторедуктаз и не ингибирует ни один из главных изоферментов CYP. Специфическое ингибирование CYP3A4 кетоконазолом не оказывает достоверного влияния на фармакокинетику эксеместана. Несмотря на установленное фармакокинетическое взаимодействие эксеместана с рифампицином, сильным индуктором CYP3A4, фармакологическая активность Аромазина (подавление эстрогенов) остается без изменений, поэтому коррекции дозы не требуется.

Особые указания и меры предосторожности:

Аромазин не следует назначать женщинам с пременопаузным эндокринным статусом, поэтому, в тех случаях, когда это клинически обосновано, постменопаузный статус следует подтверждать определением уровня ЛГ, ФСГ и эстрадиола.

Аромазин не следует назначать одновременно с препаратами, содержащими эстрогены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентов необходимо предупредить о возможности появления во время лечения Аромазином сонливости, астении и головокружения. При возникновении этих симптомов пациентам рекомендуется воздержаться от управления автомобилем и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При **почечной недостаточности** коррекции дозы не требуется.

С *осторожностью* следует применять препарат при нарушении функции почек.

При нарушениях функции печени

При **печеночной недостаточности** коррекции дозы не требуется.

С *осторожностью* следует применять препарат при нарушении функции печени.

Применение в пожилом возрасте

Для **пациенток пожилого возраста** рекомендуемая доза составляет 25 мг 1 раз/сут предпочтительно после приема пищи.

Применение в детском возрасте

Не рекомендуется использовать препарат у **детей**.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить при температуре не выше 30°С в недоступном для детей месте. Препарат не следует употреблять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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