

Бикалутамид



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 таб.
бикалутамид	150 мг

14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

14 шт. - упаковки ячейковые контурные (20) - коробки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 таб.
бикалутамид	50 мг

14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

14 шт. - упаковки ячейковые контурные (20) - коробки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Бикалутамид является селективным нестероидным антиандрогеном, не обладающим другими видами эндокринной активности. Представляет собой рацемическую смесь с нестероидной антиандрогенной активностью преимущественно (R)-энантиомера. 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 приёма бикалутамида может привести к развитию синдрома «отмены» антиандрогенов.

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на всасывание.

(S)-энантиомер выводится из организма гораздо быстрее (R)-энантиомера, период полувыведения последнего - около 7 дней. При ежедневном приеме бикалутамида концентрация (R)-энантиомера в плазме увеличивается примерно в 10 раз вследствие длительного периода полувыведения, что делает возможным прием препарата один раз в сутки.

При ежедневном приеме бикалутамида в дозе 50 мг равновесная концентрация (R)-энантиомера в плазме составляет около 9 мкг/мл. При приеме 150 мг бикалутамида ежедневно равновесная концентрация (R)-энантиомера составляет приблизительно 22 мкг/мл. При равновесном состоянии около 99% всех циркулирующих в крови энантиомеров составляет активный (R)-энантиомер.

Связь с белками плазмы крови высокая (для рацемической смеси 96%, для (R)-энантиомера 99.6 %).

Интенсивно и стереоспецифично метаболизируется в печени (путем окисления и образования конъюгатов с глюкуроновой кислотой). Метаболиты не активны, выводятся почками и кишечником примерно в равных соотношениях.

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 крови.

Показания к применению:

- распространенный рак предстательной железы в комбинации с аналогом гонадотропин-рилизинг гормона (ГнРГ) или хирургической кастрацией;
- местно-распространённый рак предстательной железы (T3-T4, любая N, M0; T1-T2, N+, M0) в качестве монотерапии или адъювантной терапии в сочетании с радикальной простатэктомией или радиотерапией;
- местно-распространенный неметастатический рак предстательной железы в случаях, когда хирургическая кастрация или другие медицинские вмешательства неприменимы или неприемлемы.

Относится к болезням:

- [Простатит](#)
- [Рак](#)

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к любому компоненту препарата, одновременный приём с терфенадином, астемизолом, цизапридом; дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (препарат содержит лактозу); детский возраст. Не должен назначаться пациентам женского пола.

С осторожностью. Нарушение функции печени.

Способ применения и дозы:

Внутрь.

Взрослые мужчины (в т.ч. пожилого возраста):

При распространённом раке предстательной железы в комбинации с аналогом ГнРГ или хирургической кастрацией: по 50 мг один раз в сут. Лечение бикалутамидом необходимо начинать одновременно с началом приёма аналога ГнРГ или хирургической кастрацией.

При местнораспространенном раке предстательной железы: по 150 мг один раз в сут.

Бикалутамид следует принимать длительно, как минимум в течение 2-х лет.

При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить.

Нарушения функции почек: коррекция дозы не требуется.

Нарушения функции печени: при легком нарушении функции печени коррекции дозы не требуется. У пациентов со средними и тяжелыми нарушениями функции печени может наблюдаться повышенная кумуляция бикалутамида.

Побочное действие:

Фармакологическое действие бикалутамида может обуславливать следующие побочные эффекты:

- очень часто (>10%): гинекомастия (может сохраняться даже после прекращения терапии, особенно в случае приёма препарата в течение длительного времени), болезненность грудных желёз, «приливы» крови к лицу;
- часто (≥1% и <10%): диарея, тошнота, транзиторное повышение активности «печеночных» трансаминаз, холестаза и желтуха (описанные изменения функции печени редко оценивались как серьёзные, 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, снижение полового влечения, сексуальные дисфункции, прибавка в весе.
- редко (≥0.1% - <1%): реакции повышенной чувствительности, включая ангионевротический отек и крапивницу,

интерстициальные заболевания легких; стенокардия, удлинение интервала QT, нарушения ритма сердца; при применении препарата в суточной дозе 150 мг - боль в животе, депрессия, диспепсия, гематурия.

— очень редко ($\geq 0.01\%$ - $< 0.1\%$): рвота, сухость кожи (при применении препарата в суточной дозе 150 мг сухость кожи наблюдается часто), печёночная недостаточность (причинно-следственная связь с приемом бикалутамида достоверно не установлена), тромбоцитопения.

При одновременном применении бикалутамида и аналогов ГНРГ могут наблюдаться также следующие побочные явления с частотой $\geq 1\%$ (причинно-следственная связь с приёмом препарата не установлена, некоторые из отмеченных побочных эффектов встречались у пожилых пациентов):

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердечная недостаточность.

Со стороны пищеварительной системы: анорексия, сухость во рту, диспепсия, дисфагия, запор, метеоризм.

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

Со стороны дыхательной системы: одышка.

Со стороны мочевыделительной системы: никтурия, инфекция мочевыводящих путей, дизурия, задержка мочи, учащенное мочеиспускание, полиурия, гидронефроз.

Со стороны кроветворной системы: анемия, лейкопения.

Со стороны кожи и её придатков: алопеция, сыпь, повышенная потливость, гирсутизм.

Со стороны лабораторных показателей: гипергликемия, повышение активности «печеночных» трансаминаз.

Прочие: боль в животе, боль в груди, боль в тазовой области, боль в спине, снижение или повышение массы тела, отеки, сахарный диабет, лихорадка.

Передозировка:

Случаи передозировки у человека не описаны. Специфического антидота не существует. Лечение симптоматическое. Проведение диализа не эффективно, так как бикалутамид прочно связывается с белками и не выводится почками в неизменном виде. Показана общая поддерживающая терапия и мониторинг жизненно-важных функций организма.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Не должен назначаться пациентам женского пола.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Нет данных о фармакокинетических или фармакодинамических взаимодействиях между бикалутамидом и аналогами ГНРГ.

В исследованиях *in vitro* показано, что (R)-энантиомер бикалутамида ингибирует CYP3A4, в меньшей степени влияя на активность CYP2C9, 2C19 и 2D6. Потенциальной способности бикалутамида к взаимодействию с другими лекарственными препаратами не обнаружено, однако при использовании частоты возникновения побочных эффектов. Усиливает действие мидазолама, 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 лекарственных средств, ингибирующих микросомальное окисление лекарственных средств, например, с циметидином или кетоконазолом может привести к увеличению концентрации бикалутамида в плазме крови и, возможно, к увеличению частоты возникновения побочных эффектов. Усиливает действие антикоагулянтов кумаринового ряда, в т.ч. варфарина (конкуренция за связь с белками).

Особые указания и меры предосторожности:

Бикалутамид

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Учитывая возможность замедления выведения бикалутамида у пациентов с нарушением функции печени целесообразно периодически оценивать функцию печени. Большинство изменений функции печени встречаются в течение первых шести месяцев лечения бикалутамидом.

В случае развития выраженных изменений функции печени приём препарата необходимо прекратить.

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

При назначении бикалутамида пациентам, получающим антикоагулянты кумаринового ряда рекомендуется регулярно контролировать протромбиновое время.

Учитывая возможность ингибирования бикалутамидом активности цитохрома P450 (CYP3A4), следует проявлять осторожность при одновременном назначении бикалутамида с лекарственными средствами, преимущественно метаболизирующимися с участием CYP3A4.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Применение возможно согласно режиму дозирования.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: нарушение функции печени. Учитывая возможность замедления выведения бикалутамида у пациентов с нарушением функции печени целесообразно периодически оценивать функцию печени. Большинство изменений функции печени встречаются в течение первых шести месяцев лечения бикалутамидом. В случае развития выраженных изменений функции печени приём препарата необходимо прекратить.

Применение в пожилом возрасте

Применение возможно согласно режиму дозирования.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности. 2 года Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Bikalutamid>