Бикалутамид Каби

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "DB01" на одной стороне и гладкие с другой стороны; на поперечном разрезе - ядро таблетки белого цвета.

	1 таб.
бикалутамид	50 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 88.93 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 5 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.45 мг, повидон - 4.5 мг, магния стеарат - 1.12 мг.

Состав оболочки: опадрай белый (Y-1-7000) - 3.75 мг (гипромеллоза 5 cP - 2.344 мг, титана диоксид - 1.172 мг, макрогол 400 - 0.234 мг).

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоопухолевое средство, нестероидный антиандрогенный препарат - конкурентный антагонист эндогенных андрогенов.

Связываясь с рецепторами на поверхности клеток органов-мишеней, делает их недоступными для андрогенов, повышая при этом концентрацию гормонов в плазме. Результатом этого является регрессия новообразований предстательной железы.

Назначение бикалутамида в дозе 150 мг/сут больным с локализованным (T1-T2, N0 или NX, MO) или местнораспространенным (T3-T4, любая N, MO; T1-T2, N+, MO) раком предстательной железы снижает риск прогрессирования заболевания на 42% и относительный риск метастазирования в кости на 33% в период наблюдения до 2 лет.

Вместе с тем эффективность бикалутамида в отношении показателей выживаемости ниже таковой при выполнении хирургической кастрации.

У некоторых пациентов прекращение приема может привести к развитию синдрома "отмены" антиандрогенов (после

отмены у 10-15% больных наступает временная стабилизация заболевания).

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро и полностью всасывается из ЖКТ (прием пищи не влияет на всасывание).

Связь с белками плазмы - 96-99%.

Интенсивно метаболизируется в печени (путем окисления и образования конъюгатов с глюкуроновой кислотой) до неактивного (S)- и активного (R)-энантиомеров. TC_{max} (R)-энантиомера - 31.3 ч. (S)-энантиомер выводится из организма гораздо быстрее (R)-энантиомера; $T_{1/2}$ последнего - около 7 дней. При ежедневном приеме бикалутамида в дозе 150 мг/сут C_{ss} (K)-энантиомера в плазме - 22 мкг/мл. При C_{ss} около 99% всех циркулирующих в крови энантиомеров составляет активный (R)-энантиомер. При ежедневном приеме концентрация (R)-энантиомера в плазме увеличивается примерно в 10 раз вследствие длительного $T_{1/2}$.

Выводится в виде метаболитов почками и с желчью в равных соотношениях. Фармакокинетика (R)-энантиомера не зависит от возраста, состояния функции почек, на фоне умеренного нарушения функции печени; у больных с тяжелыми нарушениями функции печени замедляется элиминация (R)-энантиомера из плазмы.

Показания к применению:

— рак предстательной железы (лечение локализованного рака предстательной железы пациентов, не подвергнувшихся радикальной простатэктомии или радиотерапии; монотерапия или адьювантная терапия в сочетании с радикальной простатэктомией или радиотерапией местнораспространенного рака предстательной железы; лечение местно-распространенного, неметастатического рака предстательной железы в случаях, когда хирургическая кастрация или другие лекарственные средства не эффективны или неприемлемы).

Относится к болезням:

- Простатит
- Рак

Противопоказания:

— одновременный прием терфенадина, астемизола и цизаприда;

— детский возраст;

— гиперчувствительность.

Препарат не назначают женщинам в период беременности и лактации.

С **осторожностью** следует назначать при печеночной недостаточности.

Способ применения и дозы:

При *распространенном раке предстательной железы* - внутрь, 50 мг/сут однократно в сочетании с аналогом ГнРГ или хирургической кастрацией.

При *неметастатическом раке предстательной железы in situ* в качестве монотерапии (при наличии противопоказаний к хирургической кастрации или к назначению других лекарственных средств) - по150 мг/сут однократно.

Бикалутамид следует принимать продолжительно, как минимум в течение 2 лет.

У пациентов со средними и тяжелыми **нарушениями функции печени** требуется коррекция дозы.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: стенокардия, развитие или усугубление сердечной недостаточности, повышение АД.

Со стороны дыхательной системы: боль в груди, кашель, фарингит, бронхит, пневмония, ринит.

Со стороны пищеварительной системы: редко - боль в животе, метеоризм, диспепсия, желудочное кровотечение,

сухость во рту, транзиторное повышение активности "печеночных" трансаминаз, холестаз, желтуха; очень редко - нарушение функции печени.

Со стороны нервной системы: головокружение, бессонница или сонливость, тревожность, редко - депрессия.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: миастения, миалгия, судороги, артрит, контрактуры суставов.

Со стороны эндокринной системы: часто (>10%) - гинекомастия (может сохраняться после прекращения терапии, особенно в случае приема препарата в течение длительного времени), болезненность молочных желез; гипергликемия, сахарный диабет, полиурия.

Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, задержка мочи, отеки; редко - гематурия.

Прочие: часто - астения, алопеция, снижение или повышение массы тела, снижение либидо; лихорадка, озноб, повышенное потоотделение, анемия, боль в тазовой области, сухость кожи, гирсутизм, аллергические реакции, "приливы" крови к лицу.

Передозировка:

Лечение: симптоматическое, специфического антидота не существует. Проведение диализа неэффективно, поскольку бикалутамид прочно связывается с белками и не выводится с мочой в неизмененном виде. Показана общая поддерживающая терапия и контроль за жизненно важными функциями организма.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Усиливает эффекты антикоагулянтов непрямого действия.

Увеличивает AUC мидазолама на 80%.

Несовместим с терфенадином, астемизолом, цизапридом.

Повышает риск возникновения неблагоприятных эффектов при одновременном назначении с циклоспорином, блокаторами медленных кальциевых каналов, лекарственными средствами, угнетающими микросомальное окисление (в
т.ч. циметидином, кетоконазолом).

Особые указания и меры предосторожности:

При совместном приеме с циклоспорином, после начала использования или отмены бикалутамида, рекомендуется проводить тщательный контроль концентрации циклоспорина в плазме и состояния пациента.

Исследования in vitro показали, что бикалутамид может вытеснять варфарин из участков связывания с белком (необходимо регулярно контролировать протромбиновое время).

Элиминация бикалутамида из организма может быть замедлена у больных с тяжелыми нарушениями функции печени, что может привести к его кумуляции. Целесообразно периодически оценивать функцию печени (большинство изменений функции печени встречаются в течение первых 6 мес лечения). Прекратить лечение при появлении клинических симптомов и/или повышении функциональных проб более, чем в 2 раза. В случае развития тяжелых поражений печени необходимо прекратить прием.

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

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 печени

С осторожностью следует назначать при печеночной недостаточности. У пациентов со средними и тяжелыми **нарушениями функции печени** требуется коррекция дозы.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям.

Условия хранения:

Хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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