Билумид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
бикалутамид	50 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал картофельный, целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал, повидон, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный.

Состав оболочки: оксипропилметилцеллюлоза, повидон, полисорбат, тальк, титана диоксид, желтый водорастворимый краситель или хинолиновый желтый.

7 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
28 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.
30 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе видны два слоя.

	1 таб.
бикалутамид	150 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал картофельный, целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал, повидон, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный.

Состав оболочки: оксипропилметилцеллюлоза, повидон, полисорбат, тальк, титана диоксид, желтый водорастворимый краситель или хинолиновый желтый.

7 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
28 шт. - флаконы (1) - пачки картонные.
28 шт. - банки (1) - пачки картонные.
30 шт. - банки (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антиандрогенный нестероидный препарат с противоопухолевой активностью. Представляет собой рацемическую смесь с нестероидной антиандрогенной активностью преимущественно (11)-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

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

При ежедневном приеме 150 мг бикалутамида C_{ss} (11)-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 150 мг C_{ss} (R)- энантиомера в плазме составляет приблизительно 22 мкг/мл. При равновесном состоянии около 99 % всех циркулирующих в крови энантиомеров составляет активный (R)- энантиомер.

Распределение

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

Метаболизм

Интенсивно метаболизируется в печени путем окисления и образования коньюгатов с глюкуроновой кислотой.

Выведение

Метаболиты выводятся с мочой и желчью примерно в равных пропорциях. З)-энантиомер выводится из организма гораздо быстрее (11)-энантиомера, $T_{1/2}$ последнего - около 7 дней.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетика (11)-энантиомера не зависит от возраста, нарушения функции почек, легкого или среднего нарушения функции печени. Имеются данные о том, что у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени замедляется элиминация (11)-энантиомера из плазмы.

Показания к применению:

— распространенный рак предстательной железы в комбинации с аналогом ГнРГ (гонадотропин-рилизинг гормон) или хирургической кастрацией;

— местно-распространенный рак предстательной железы (Т3-Т4, любая N, МО; Т1-Т2, N+, МО) 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:

— одновременный прием с терфенадином, астемизолом и цизапридом;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Билумид не назначают женщинам и детям.

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

Способ применения и дозы:

Взрослым и пожилым мужчинам

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

При *местнораспространенном раке предстательной железы* внутрь по 150 мг (1 таб. по 150 мг или 3 таб. по 50 мг) 1 раз/сут. Билумид следует принимать длительно, как минимум, в течение 2 лет. При появлении признаков прогрессирования заболевания применение препарата следует прекратить.

При **нарушении функции почек** коррекция дозы препарата не требуется.

При **легком нарушении функции печени** коррекция дозы препарата не требуется. У пациентов **со средними и тяжелыми нарушениями функции печени** может наблюдаться повышенная кумуляция бикалутамида.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: очень часто (>10%) - диарея, тошнота, транзиторное повышение активности печеночных трансаминаз, холестаз и желтуха (описанные изменения функции печени носили транзиторный характер, полностью исчезали или уменьшались при продолжении терапии или после отмены препарата); редко (>0.1% и <1%) - при применении препарата в суточной дозе 150 мг возможны боль в животе, диспепсия; очень редко (>0.01% и <0.1%) - рвота, печеночная недостаточность (причинно-следственная связь с приемом бикалутамида достоверно не установлена).

Со стороны репродуктивной системы: очень часто (>10%) - гинекомастия (может сохраняться даже после прекращения терапии, особенно в случае приема препарата в течение длительного времени), болезненность грудных желез, "приливы" жара; часто (>1% и <10%) - снижение полового влечения, сексуальные дисфункции, прибавка в весе.

Со стороны ЦНС: часто (>1% и <10%) - астения; редко (>0.1% и <1%) - при применении препарата в суточной дозе 150 мг возможна депрессия.

Дерматологические реакции: часто (>1% и <10%) - при применении препарата в суточной дозе 150 мг - алопеция или восстановление роста волос; очень редко (>0.01% и <0.1%) - сухость кожи (при применении препарата в суточной дозе 150 мг сухость кожи наблюдается часто)

Аллергические реакции: часто (>1% и <10%) - зуд; редко (>0.1% и <1%) - реакции повышенной чувствительности (в т.ч. ангионевротический отек, крапивница).

Прочие: редко (>0.1% и <1%) - интерстициальные легочные заболевания, при применении препарата в суточной дозе 150 мг - гематурия.

При одновременном применении бикалутамида и аналогов ГнРГ с частотой >1% могут наблюдаться также следующие побочные явления (причинно-следственная связь с приемом 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, запор, метеоризм.

Со стороны ЦНС: головокружение, головная боль, бессонница, повышенная сонливость.

Со стороны дыхательной системы: одышка.

Со стороны мочевыделительной системы: сексуальная дисфункция, никтурия.

Со стороны системы кроветворения: анемия.

Дерматологические реакции: алопеция, сыпь, повышенная потливость, гирсутизм.

Прочие: сахарный диабет, гипергликемия, повышение/снижение массы тела, боль в животе, боль в груди, боль в тазовой области, озноб.

Передозировка:

Случаи передозировки препарата Билумид у человека не описаны.

Лечение: симптоматическое. Специфического антидота не существует. Проведение диализа неэффективно, поскольку бикалутамид прочно связывается с белками плазмы и не выводится с мочой в неизмененном виде. Показана общая поддерживающая терапия и контроль жизненноважных функций организма.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Билумид не назначают женщинам.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Нет данных о фармакодинамическом или фармакокинетическом взаимодействии между бикалутамидом и аналогами ГнРГ.

В исследованиях in vitro показано, что (11)-энантиомер бикалутамида является ингибитором CYP3A4, в меньшей степени влияет на активность изоферментов CYP2C9, CYP2C19 и CYP2D6. Потенциальной способности бикалутамида к взаимодействию с другими лекарственными препаратами не обнаружено, однако при применении бикалутамида в течение 28 дней на фоне приема мидазолама, AUC мидазолама увеличивалась на 80%.

Препарат несовместим с терфенадином, астемизолом и 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 нежелательных реакций.

После начала применения или отмены бикалутамида следует проводить тщательный мониторинг концентрации циклоспорина в плазме крови 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.

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

Особые указания и меры предосторожности:

Учитывая возможность замедления выведения бикалутамида и его кумуляции у пациентов с нарушением функции печени, следует периодически оценивать функцию печени. Большинство изменений функции печени встречаются в течение первых 6 месяцев лечения бикалутамидом. В случае развития выраженных изменений функции печени прием Билумида необходимо прекратить.

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

При назначении Билумида пациентам, получающим антикоагулянты кумаринового ряда, следует регулярно контролировать протромбиновое время.

Учитывая возможность ингибирования бикалутамидом активности изофермента CYP3A4, следует проявлять осторожность при одновременном назначении Билумида с препаратами, преимущественно метаболизирующимися с участием изофермента CYP3A4.

Пациентов с непереносимостью лактозы необходимо проинформировать о том, что таблетка Билумида по 50 мг содержит 55.2 мг лактозы, а таблетка по 150 мг содержит 165.6 мг лактозы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Билумид 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 печени

С *осторожностью* следует применять препарат принарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Билумид не назначают детям.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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