Эгистразол



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 пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "ANA 1" на одной стороне; на изломе - белого или почти белого цвета.

	1 таб.
анастрозол	1 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, повидон, карбоксиметилкрахмал натрия, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: опадрай белый (макрогол 400, гипромеллоза, титана диоксид).

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противоопухолевые средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоопухолевый препарат. Анастрозол является сильным и высокоселективным нестероидным ингибитором ароматазы - фермента, с помощью которого у женщин андростендион и тестостерон в тканях превращаются в эстрон и эстрадиол соответственно. Снижение уровня концентрации циркулирующего эстрадиола у больных раком молочной железы оказывает терапевтическое действие. У женщин в постменопаузе анастрозол в суточной дозе 1 мг вызывает снижение уровня концентрации эстрадиола на 80%.

Анастрозол не обладает прогестагенной, андрогенной и эстрогенной активностью. В суточных дозах до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и альдостерона, следовательно, при применении анастрозола не требуется заместительного введения кортикостероидов.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После приема внутрь анастрозол быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови обычно достигается в течение 2 ч после приема внутрь натощак. Пища незначительно уменьшает скорость всасывания, но не его степень и не приводит к клинически значимому влиянию на C_{ss} препарата в плазме крови при однократном приеме суточной дозы анастрозола. После 7-дневного приема препарата достигается приблизительно 90-95% C_{ss} анастрозола в плазме крови. Сведений о зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени или дозы нет. Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста женщин в постменопаузе. Связывание с белками плазмы крови - 40%.

Метаболизм и выведение

Метаболизм анастрозола осуществляется N-дезалкилированием, гидроксилированием и глюкуронированием. Метаболиты анастрозола выводятся преимущественно почками. Основной метаболит анастрозола - триазол, определяемый в плазме крови, не обладает фармакологической активностью. Анастрозол экстенсивно метаболизируется у женщин в постменопаузе, при этом менее 10% экскретируется почками в неизмененном виде в течение 72 ч после приема препарата. $T_{1/2}$ анастрозола из плазмы крови составляет 40-50 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Клиренс анастрозола после приема внутрь при циррозе печени или нарушении функции почек не изменяется.

Показания к применению:

— адъювантная терапия раннего рака молочной железы, с положительными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе;

— первая линия терапии местно-распространенного или метастатического рака молочной железы с положительным или с неизвестным гормональным статусом у женщин в постменопаузе.

— вторая линия терапии распространенного рака молочной железы, прогрессирующего после предшествующей терапии тамоксифеном.

Относится к болезням:

- Рак

Противопоказания:

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— пременопауза;

— выраженная печеночная недостаточность (безопасность и эффективность не установлены);

— сопутствующая терапия тамоксифеном или препаратами, содержащими эстрогены;

— детский возраст (безопасность и эффективность не установлены);

— повышенная чувствительность к анастрозолу или другим компонентам препарата.

С *осторожностью:* остеопороз, гиперхолестеринемия, ИБС, нарушение функции печени, почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 20 мл/мин), недостаточность лактазы, непереносимость лактозы, синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы (в лекарственной форме препарата содержится лактоза).

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь. Таблетку проглатывают целиком, запивая водой. Рекомендуется принимать препарат в одно и то же время вне зависимости от приема пищи.

Взрослым, включая пожилых, 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.

Коррекции дозы у **пациентов с нарушением функции почек** не требуется.

Коррекция дозы у **пациентов с легкой и умеренной степенью нарушений функции печени** не требуется.

Побочное действие:

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующим критериям: очень часто (не менее 1/10), часто (более 1/100, менее 1/10); иногда (более 1/1000, менее 1/100); редко (более 1/10 000, менее 1/1000); очень редко (менее 1/10 000), включая отдельные сообщения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - приливы крови к лицу.

Со стороны костно-мышечной системы: очень часто - артралгия; редко - триггерный палец. Прием препарата может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани в связи со снижением концентрации циркулирующего эстрадиола, тем самым повышая риск возникновения остеопороза и переломов костей.

Со стороны репродуктивной системы: часто - сухость слизистой оболочки влагалища, влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или смены предшествующей гормональной терапии на анастрозол).

Со стороны кожи и кожных придатков: очень часто - кожная сыпь; часто - истончение волос, алопеция; очень редко - многоформная эритема (синдром Стивенса-Джонсона).

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - тошнота; часто - диарея, рвота, анорексия, повышение активности АЛТ, АСТ, ЩФ; редко - повышение активности ГГТ, гипербилирубинемия, гепатит.

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

Аллергические реакции: часто - аллергические реакции; очень редко - анафилактоидные реакции, ангионевротический отек, крапивница, анафилактический шок.

Прочие: очень часто - астения; часто - гиперхолестеринемия.

Передозировка:

Описаны единичные случаи случайной передозировки препарата. Разовая доза анастрозола, которая могла бы привести к симптомам, угрожающим жизни не установлена.

Лечение: специфического антидота не существует, в случае передозировки лечение должно быть симптоматическим. Можно индуцировать рвоту, если больной находится в сознании. Возможно проведение диализа. Рекомендуется общая поддерживающая терапия, наблюдение за больным и контроль функций жизненно важных органов и систем.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Исследования по лекарственному взаимодействию с феназоном и циметидином указывают на то, что совместное применение анастрозола с другими препаратами вряд ли приведет к клинически значимому лекарственному взаимодействию, опосредованному цитохромом Р450.

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

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

Препараты, содержащие эстрогены, уменьшают фармакологическое действие анастрозола, в связи с чем они не должны назначаться одновременно с анастрозолом.

Не следует назначать тамоксифен одновременно с анастрозолом, поскольку он может ослабить фармакологическое

действие последнего.

Особые указания и меры предосторожности:

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

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

Нет данных о применении анастрозола у пациенток с тяжелой степенью нарушений функции печени.

Поскольку анастрозол снижает концентрацию циркулирующего эстрадиола, это может привести к снижению минеральной плотности костной ткани. Поэтому у пациенток с остеопорозом или с повышенным риском развития остеопороза, минеральную плотность костной ткани следует оценивать методом денситометрии, например, DEXA-сканированием (двухэнергетическая рентгеновская абсорбциометрия), в начале лечения и регулярно на его протяжении. При необходимости следует назначать лечение или профилактику остеопороза и тщательно наблюдать за состоянием пациентки. В настоящий момент отсутствуют достаточные данные относительно положительного влияния бисфосфонатов на потерю минеральной плотности костной ткани, вызванной анастрозолом, или их пользы для профилактики.

Нет данных об одновременном применении анастрозола и препаратов-аналогов ГнРГ.

При рецептор-негативном раке молочной железы или при неэффективности предшествующей терапии тамоксифеном, эффективность анастрозола достаточно низкая.

Препараты, содержащие эстрогены, не должны назначаться одновременно с анастрозолом, т.к. эти препараты будут нивелировать его фармакологическое действие.

Эффективность и безопасность анастрозола 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.

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

Влияние на способность к вождению автомобиля и управлению механизмами

Некоторые побочные действия анастрозола, такие как астения и сонливость, могут отрицательно влиять на способность выполнения потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В этой связи рекомендуется при появлении этих симптомов соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью:* почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 20 мл/мин).

При нарушениях функции печени

С *осторожностью:* нарушение функции печени.

Применение в пожилом возрасте

Применение возможно согласно режиму дозирования.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст (безопасность и эффективность не установлены).

Условия хранения:

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

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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