

## Эксеместан-ТЛ



### **Международное непатентованное название (Действующее вещество):**

- [Эксеместан](#)

### **Полезные ссылки:**

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)  
[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>  
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### **Форма выпуска:**

#### **Форма выпуска, описание и состав**

**Таблетки, покрытые пленочной оболочкой** белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе ядро от белого до светло-желтого цвета.

	<b>1 таб.</b>
эксеместан	25 мг

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

*Состав пленочной оболочки:* Опадрай II 85F48105 белый (поливиниловый спирт, макрогол 4000, тальк, титана диоксид)

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

### **Фармакологические свойства:**

#### **Фармакодинамика**

Противоопухолевое средство, ингибитор ароматазы, по структуре сходен с естественным стероидным гормоном андростендионом.

У женщин в постменопаузе эстрогены продуцируются преимущественно путем превращения андрогенов в эстрогены под действием фермента ароматазы в периферических тканях. Механизм действия эксеместана обусловлен необратимым связыванием с активным фрагментом ароматазы, что приводит к инактивации фермента.

Эксеместан не обладает прогестагенной и эстрогенной активностью. При применении в высоких дозах проявляется лишь незначительная андрогенная активность. Не оказывает влияния на биосинтез кортизола и альдостерона в надпочечниках.

Незначительное увеличение уровней ЛГ и ФСГ в сыворотке отмечается даже при низких дозах эксеместана. Этот эффект, однако, является нехарактерным для препаратов данной фармакологической группы. Вероятно, он развивается по принципу обратной связи, на уровне гипофиза: снижение концентрации эстрогенов стимулирует секрецию гонадотропинов в гипофизе также и у женщин в постменопаузе.

**Фармакокинетика**

После приема внутрь быстро абсорбируется из ЖКТ. При однократном приеме в дозе 25 мг после приема пищи  $C_{max}$  составляет 18 нг/мл и достигается в течение 2 ч. Пища улучшает абсорбцию: достигаемый при этом уровень эксеместана в плазме крови на 40% выше, чем после приема натощак.

После достижения  $C_{max}$  уровень активного вещества в плазме снижается; при этом конечный  $T_{1/2}$  составляет приблизительно 24 ч. Эксеместан широко распределяется в тканях. Связывание с белками плазмы составляет около 90%, степень связывания не зависит от общей концентрации.

После повторных приемов в дозе 25 мг/сут концентрация в плазме неизмененного вещества была сходна с таковой после однократного приема.

Эксеместан характеризуется высоким клиренсом, преимущественно за счет метаболизма. Метаболизируется путем окисления метиленовой группы в положении 6 при участии изофермента CYP3A4 и/или путем восстановления 17-кетогруппы при участии альдокеторедуктаз. В результате образуются многочисленные вторичные метаболиты, однако количество каждого из них очень невелико по сравнению с введенной дозой. В отношении ингибирования ароматазы эти метаболиты либо неактивны, либо менее активны, чем неизмененное вещество.

Выводится с мочой и с калом. Выведение эксеместана и его метаболитов из организма в основном завершается в течение 1 недели. Менее 1% выводится с мочой в неизмененном виде.

**Показания к применению:**

Лечение распространенного рака молочной железы у женщин в естественной или индуцированной постменопаузе, у которых выявлено прогрессирование заболевания на фоне антиэстрогенной терапии.

Гормональная терапия при распространенном раке молочной железы у женщин в естественной или индуцированной постменопаузе, у которых выявлено прогрессирование заболевания на фоне терапии либо нестероидными ингибиторами ароматазы, либо прогестинами.

**Относится к болезням:**

- [Рак](#)

**Противопоказания:**

Беременность, лактация (грудное вскармливание), повышенная чувствительность к эксеместану.

**Способ применения и дозы:**

При приеме внутрь рекомендуемая доза для взрослых и пациенток пожилого возраста - по 25 мг 1 раз/сут ежедневно, предпочтительно после приема пищи. Лечение следует продолжать до появления признаков прогрессирования опухолевого заболевания, после этого рекомендуется скорректировать врачебную тактику.

При печеночной или почечной недостаточности коррекции дозы не требуется.

**Побочное действие:**

*Со стороны ЦНС:* часто - утомляемость, головокружение; иногда - головная боль, бессонница, депрессия, астения.

*Со стороны пищеварительной системы:* часто - тошнота; иногда - боли в области живота, анорексия, запор, диспепсия; редко - увеличение показателей функциональных печеночных тестов в сыворотке, повышение уровня ЦФ.

*Со стороны эндокринной системы:* часто - приступообразные ощущения жара (приливы).

*Дерматологические реакции:* возможны - кожная сыпь, алопеция.

*Со стороны системы кроветворения:* часто - снижение уровня лимфоцитов; редко - тромбоцитопения, лейкопения.

*Со стороны обмена веществ:* возможны - периферические отеки (отеки стоп, голеней).

*Прочие:* часто - усиление потоотделения.

## **Применение при беременности и кормлении грудью:**

Противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

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

До настоящего времени не проводилось исследований взаимодействия эксеместана с другими лекарственными средствами. Результаты исследований *in vitro* показали, что эксеместан подвергается метаболизму под влиянием изофермента СYP3A4 и альдокеторедуктаз и не ингибирует ни один из главных изоферментов СYP. В ходе клинического фармакокинетического исследования было установлено, что специфическое ингибирование изофермента СYP3A4 кетоконазолом не вызывает достоверных изменений фармакокинетических параметров эксеместана. Однако нельзя исключить возможное снижение концентрации эксеместана в плазме под влиянием препаратов, которые являются индукторами изофермента СYP3A4.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

Не следует применять у женщин с пременопаузным эндокринным статусом, поскольку оценка эффективности и безопасности препарата у этой категории пациентов не проводилась. В тех случаях, когда необходимость применения клинически обоснована, постменопаузный статус следует подтверждать определением уровня ЛГ, ФСГ и эстрадиола.

У пациенток с исходной лимфопенией повышен риск снижения количества лимфоцитов. Увеличение показателей функциональных печеночных тестов в сыворотке и повышение уровня ЩФ отмечалось преимущественно у пациенток с метастазами в печень и в кости, а также при наличии других поражений печени.

Не рекомендуется применять у детей.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

При выполнении работы, связанной с необходимостью концентрации внимания и высокой скорости психомоторных реакций, пациентам следует иметь в виду, что при применении эксеместана возможно появление сонливости и головокружения.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Eksemestan-TL>