

## Эксеместан-Тева



### **Полезные ссылки:**

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

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### **Фармакологические свойства:**

#### **Фармакодинамика**

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 ЩФ.

*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 CYP3A4 и альдокеторедуктаз и не ингибирует ни один из главных изоферментов CYP. В ходе клинического фармакокинетического исследования было установлено, что специфическое ингибирование изофермента CYP3A4 кетоконазолом не вызывает достоверных изменений фармакокинетических параметров эксеместана. Однако нельзя исключить возможное снижение концентрации эксеместана в плазме под влиянием препаратов, которые являются индукторами изофермента CYP3A4.

## 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 эксеметана возможно появление сонливости и головокружения.

### **При нарушениях функции почек**

При почечной недостаточности коррекции дозы не требуется.

### **При нарушениях функции печени**

При печеночной недостаточности коррекции дозы не требуется.

### **Применение в детском возрасте**

Не рекомендуется применять у детей.

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