Эстаризол



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" и "1" на одной стороне; на изломе - ядро белого или почти белого цвета.

	1 таб.
анастрозол	1 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 93 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 3 мг, повидон - 2 мг, магния стеарат - 1 мг.

Состав оболочки: опадрай белый Y-1-7000 (макрогол (ПЭГ 400) - 160 мкг, гипромеллоза (HPMC) - 1.56 мг, титана диоксид - 780 мкг).

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Противоопухолевые средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анастрозол является высокоселективным нестероидным ингибитором ароматазы - фермента, с помощью которого у женщин андростендион и тестостерон в тканях превращаются в эстрон и эстрадиол соответственно. Снижение концентрации циркулирующего эстрадиола у больных раком молочной железы оказывает терапевтический эффект. У женщин в постменопаузе анастрозол в суточной дозе 1 мг вызывает снижение 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

После приема внутрь анастрозол быстро всасывается из ЖКТ. Максимальная концентрация в плазме крови обычно достигается в течение 2 часов после приема внутрь (натощак). Пища незначительно уменьшает скорость всасывания, но не его степень и не приводит к клинически значимому влиянию на равновесную концентрацию анастрозола в плазме крови при однократном приёме суточной дозы. После 7-дневного приема препарата достигается приблизительно 90-95% равновесной концентрации анастрозола в плазме крови. Сведений о зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени или дозы нет. Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста женщин в постменопаузе.

Распределение

Связь с белками плазмы крови - 40%.

Метаболизм

Анастрозол экстенсивно метаболизируется у женщин в постменопаузе, при этом менее 10% экскретируется почками в неизмененном виде в течение 72 ч после приема препарата.

Выведение

Период полувыведения анастрозола из плазмы крови составляет 40-50 часов. 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.

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

Показания к применению:

— адъювантная терапия раннего рака молочной железы с положительным или неустановленным статусом гормональных рецепторов у женщин в постменопаузе;

— первая линия терапии местно-распространенного или метастатического рака молочной железы, с положительными или неизвестными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе;

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

Относится к болезням:

- Рак

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к анастрозолу или другим компонентам препарата;

— пременопауза;

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

— сопутствующая терапия тамоксифеном или препаратами, содержащими эстрогены;

— беременность и период кормления грудью;

— детский возраст (безопасность и эффективность у детей не установлены).

С осторожностью: остеопороз, гиперхолестеринемия, ишемическая болезнь сердца, нарушение функции печени, тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина <20 мл/мин), недостаточность лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в лекарственной форме препарата содержится лактозы моногидрат).

Способ применения и дозы:

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

Взрослые, включая пожилых: по 1 мг внутрь 1 раз в сутки длительно. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить. В качестве адъювантной терапии рекомендуемая продолжительность лечения - 5 лет. Нарушения функции почек: коррекция дозы у пациентов с нарушением функции почек не требуется.

Нарушения функции печени: коррекция дозы у пациентов с легкой и умеренной степенью нарушения 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); нечасто (более 1/1000, менее 1/100); редко (более 1/10000, менее 1/1000); очень редко (менее 1/10000), 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.

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 - злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона).

Со стороны системы пищеварения: очень часто - тошнота; часто - диарея, рвота, анорексия.

Со стороны гепатобилиарной системы: часто - повышение активности аланинаминотрансферазы, аспартатаминотрансферазы и щелочной фосфатазы; редко -повышение активности гамма-глутамилтрансферазы и концентрации билирубина, 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).

Со стороны метаболизма: часто - гиперхолестеринемия. 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.

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

Прочие: очень часто - астения.

Передозировка:

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

Специфического антидота не существует, в случае передозировки лечение должно быть симптоматическим. Можно индуцировать рвоту, если больной находится в сознании. Может быть проведен диализ. Рекомендуется общая поддерживающая терапия, наблюдение за больным и контроль функций жизненно важных органов и систем.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано при беременности и 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.

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.

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. Поскольку анастрозол снижает концентрацию циркулирующего эстрадиола, это может привести к снижению минеральной плотности костной ткани. На настоящий момент отсутствуют достаточные данные относительно положительного влияния бисфосфонатов на потерю минеральной плотности костной ткани, вызванной анастрозолом или их пользы при применении с целью профилактики.

Нет данных об одновременном применении анастрозола и препаратов-аналогов гонадотропин - рилизинг гормона.

При рецепторонегативном раке молочной железы или при неэффективности предшествующей терапии тамоксифеном эффективность анастрозола достаточно низкая. Препараты, содержащие эстрогены, не должны назначаться одновременно с анастрозолом, так как 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 применении одного тамоксифена. Точный механизм данного явления пока не известен.

Неизвестно улучшает ли анастрозол результаты лечения при совместном применении 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

Применение с осторожностью при тяжелой почечной недостаточности (КК < 20 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказано при выраженной печеночной недостаточности. Применнение препарата с осторожностью при нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказано детям (безопасность и эффективность у детей не установлены).

Условия хранения:

При температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте! Срок годности - 30 месяцев.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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