Эстрацит

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы желатиновые, белые, непрозрачные; содержимое капсул - порошок белого цвета.

	1 капс.
эстрамустина фосфата динатриевая соль (эквивалентно эстрамустина фосфата)	140 мг

Вспомогательные вещества: натрия лаурилсульфат, тальк, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

40 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
100 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Лиофилизат для приготовления раствора для в/в введения	**1 фл.**
эстрамустина фосфата динатриевая соль (эквивалентно эстрамустина фосфата)	300 мг

Вспомогательные вещества: меглумин, маннитол.

Растворитель: вода д/и - 8 мл.

Флаконы стеклянные (10) в комплекте с растворителем (амп. 10 шт.) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Эстрацит (конъюгат эстрадиола и азотистого иприта) представляет собой противоопухолевый препарат с двойным механизмом действия. Установлено, что эстрон и эстрадиол (получающиеся в результате биотрансформации эстрамустина фосфата) обладают антигонадотропной активностью и вызывают снижение уровня тестостерона, сходное с таковым после хирургической кастрации.

В процессе дефосфорилирования эстрацита образуется эстрамустин, который далее биотрансформируется в эстромустин. Эти метаболиты обладают антимитотическим действием за счет ингибирования образования микротрубочек в метафазу и их разрушением в интерфазу митоза.

Фармакокинетика

Распределение и метаболизм

После в/в введения неизмененный эстрамустина фосфат обнаруживается в плазме крови, однако он быстро биотрансформируется с образованием эстрамустина и далее - эстромустина, который является основным метаболитом, присутствующим в плазме. Связывание эстрамустина и эстромустина с белками плазмы высокое.

Эстрамустин и эстромустин подвергаются дальнейшей биотрансформации с образованием эстрогенов - эстрадиола и эстрона.

После введения препарата эстрамустин и эстромустин обнаруживаются в опухолевой ткани предстательной железы человека. Концентрации эстрамустина и эстромустина в опухолевой ткани выше, чем в плазме. Возможно, это объясняется тем, что эстрамустин и эстромустин поглощаются тканью предстательной железы за счет их связывания с особым белком, который был обнаружен в опухолевой ткани предстательной железы.

Выведение

Эстрамустин и эстромустин выделяются с желчью и калом и не обнаруживаются в моче. Эстрадиол и эстрон подвергаются дальнейшему метаболизму и частично выделяются с мочой.

Показания к применению:

—поздние стадии рака предстательной железы, особенно при рефрактерности к гормональной терапии;

—первичная терапия рака предстательной железы при наличии прогностических факторов, указывающих на возможную низкую эффективность гормональной терапии.

Относится к болезням:

- Рак

Противопоказания:

—тяжелые заболевания печени;

—тяжелые заболевания сердечно-сосудистой системы, такие как ИБС, тромбоэмболия и осложнения, вызванные задержкой жидкости в организме;

—повышенная чувствительность к производным эстрадиола и/или азотистого иприта.

Способ применения и дозы:

Доза Эстрацита для приема внутрь может составлять от 7 до 14 мг/кг массы тела в 2-3 приема (4-8 капсул/сут). Рекомендуемая начальная доза составляет 4-6 капс./сут для достижения дозы не менее 10 мг/кг массы тела.

Капсулы следует принимать не менее чем за 1 ч до еды или через 2 ч после еды, запивать водой. Нельзя принимать Эстрацит одновременно с лекарственными средствами, содержащими кальций, магний или алюминий (в т.ч. с антацидами), а также одновременно с употреблением молока, молочных продуктов.

Рекомендуемая доза Эстрацита в форме инъекций составляет 5 мг/кг массы тела (300-450 мг) ежедневно в течение 3 недель, затем по 300 мг 2 раза в неделю в качестве поддерживающей терапии.

При отсутствии эффекта от проводимой в течение 4-6 недель терапии препарат следует отменить.

Способ приготовления и введения раствора

Содержимое 1 флакона с Эстрацитом (300 мг) растворяют в 8 мл воды для инъекций, медленно добавляя содержимое ампулы с растворителем во флакон с порошком для инъекций. При этом флакон нельзя встряхивать.

Эстрацит обладает местным раздражающим эффектом, поэтому он должен вводиться в/в медленно тонкой иглой в периферическую вену или через центральный венозный катетер.

Эстрацит можно развести в 250 мл 5% раствора глюкозы и вводить в/в капельно в течение не более 3 ч.

Побочное действие:

Со стороны эндокринной системы: часто - гинекомастия, импотенция.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота (особенно в течение первых 2 недель лечения); возможно - диарея, нарушение функции печени.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: задержка жидкости, ИБС (включая инфаркт миокарда), застойная сердечная недостаточность, тромбоэмболия, артериальная гипертензия.

Со стороны системы кроветворения: редко - анемия, лейкопения и тромбоцитопения.

Со стороны ЦНС: редко - мышечная слабость, депрессия, головная боль, спутанность сознания, летаргия.

Аллергические реакции: кожная сыпь, ангионевротический отек (отек Квинке и отек гортани). Во многих случаях пациенты одновременно с Эстрацитом получали ингибиторы АПФ).

Местные реакции: в месте в/в введения - флебит.

Передозировка:

Симптомы: возможно усиление побочных эффектов, особенно со стороны пищеварительной системы.

Лечение: проводят промывание желудка и симптоматическую терапию. В течение 6 недель после передозировки Эстрацита следует контролировать картину крови и функциональное состояние печени.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Клинические исследования показали, что эстрогены повышают как терапевтическую активность, так и токсичность трициклических антидепрессантов возможно путем ингибирования их метаболизма.

При одновременном приеме Эстрацита и препаратов, содержащих кальций, магний или алюминий, возможно значительное снижение всасывания эстрамустина за счет образования с поливалентными ионами металлов нерастворимых солей.

При одновременном применении Эстрацита и ингибиторов АПФ повышается вероятность развития ангионевротического отека.

Фармацевтическая несовместимость

Для приготовления инъекционного раствора эстрамустина не рекомендуют использовать физиологический раствор из-за выпадения осадка.

Особые указания и меры предосторожности:

Эстрацит должен применяться врачами, имеющими опыт применения противоопухолевых препаратов.

С осторожностью следует назначать Эстрацит пациентам с тромбофлебитом, тромбозом или тромбоэмболическими нарушениями в анамнезе (особенно связанных с применением эстрогенов); при атеросклерозе сосудов головного мозга или коронарной патологии.

Из-за возможного снижения толерантности к глюкозе пациенты с сахарным диабетом должны находиться под строгим наблюдением в процессе лечения Эстрацитом.

У пациентов с артериальной гипертензией необходим систематический контроль АД.

При применении Эстрацита возможна задержка жидкости в организме, поэтому пациенты с эпилепсией, мигренью или нарушениями функции почек, прогрессирующими в случае задержки жидкости, требуют особого внимания.

С осторожностью назначают Эстрацит пациентам с метаболическими поражениями костной ткани, сопровождающимися гиперкальциемией, а также пациентам с почечной недотаточностью, т.к. препарат может оказывать влияние на метаболизм кальция или фосфора.

С осторожностью назначают препарат пациентам с нарушениями функции печени, т.к. он может недостаточно метаболизироваться у таких пациентов. Требуется регулярный контроль лабораторных показателей функции печени.

Известно, что эстрамустин мутагенен, поэтому при применении Эстрацита пациенты детородного возраста должны использовать надежные методы контрацепции.

Поскольку некоторые эндокринные функции и функции печени подвержены влиянию эстрогеносодержащих препаратов, это может отразиться на соответствующих значениях лабораторных показателей.

При приготовлении раствора следует избегать контакта Эстрацита с кожей. Если это произошло, следует тщательно промыть место контакта холодной водой с мылом и уничтожить использованные при этом материалы путем

сжигания.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых заболеваниях печени.

Условия хранения:

Препарат в форме капсул следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Лиофилизированный порошок следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C. Срок годности - 3 года. Приготовленный инфузионный раствор необходимо использовать в течение 12 ч при хранении при комнатной температуре и в течение 24 ч при хранении при температуре от 2° до 8°C..

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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