Эвиста

Код АТХ:

- G03XC01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ралоксифен

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Гормоны и их антагонисты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный модулятор эстрогеновых рецепторов. Действует как агонист на ткани организма, не связанные с репродукцией, и как антагонист - на репродуктивные ткани. Действие обусловлено высокоаффинным связыванием с эстрогеновыми рецепторами и регуляцией экспрессии генов.

Уменьшает процесс резорбции костной ткани и нормализует баланс кальция в организме, прежде всего, за счет уменьшения потерь кальция с мочой.

Не вызывает пролиферации эндометрия, увеличения размеров матки, кровянистых выделений или кровотечений в постклимактерическом периоде. Не описано случаев возникновения рака эндометрия de novo. Не вызывает гиперплазию ткани молочных желез. Уменьшает набухание и болезненность молочных желез.

Уменьшает уровни общего холестерина и ЛПНП. Уровень ЛПВП и триглицеридов достоверно не изменяется. Снижает содержание фибриногена плазмы крови.

Фармакокинетика

После приема внутрь ралоксифен быстро абсорбируется из ЖКТ. Подвергается интенсивному метаболизму путем глюкуронизации при "первом прохождении" через печень. В плазме крови определяются 3 конъюгированных метаболита. Абсолютная биодоступность ралоксифена составляет 2%.

Широко распределяется в организме. V_d не зависит от дозы. Связывание с белками плазмы составляет 98-99%.

Уровень ралоксифена поддерживается благодаря энтерогепатической рециркуляции. $T_{1/2}$ составляет 27.7 ч.

Большая часть дозы в виде неизмененного вещества и метаболитов выводится в течение 5 дней преимущественно с

калом, менее 5% выводится с мочой.

Показания к применению:

Профилактика остеопороза у женщин в постменопаузном периоде.

Противопоказания:

Тромбоэмболия, включая тромбоз глубоких вен, эмболию легочной артерии и тромбоз вен сетчатки, заболевания печени (включая холестаз), тяжелые нарушения функции почек, маточное кровотечение неясной этиологии, рак молочной железы, рак эндометрия, повышенная чувствительность к ралоксифену.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь доза составляет 60 мг/сут. Лечение длительное.

При применении у пациенток пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

Побочное действие:

Со стороны свертывающей системы крови: небольшая тромбоцитопения; редко - венозная тромбоэмболия (включая тромбоз глубоких вен), эмболия легочной артерии, тромбоз вен сетчатки.

Со стороны системы кровообращения: вазодилатация (ощущение жара).

Прочие: спазмы икроножных мышц, периферические отеки.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Предназначен только для применения у женщин в постменопаузном периоде.

Ралоксифен может оказывать повреждающее действие на плод.

Неизвестно, выделяется ли ралоксифен с грудным молоком. При применении в период лактации может оказывать негативное влияние на развитие ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с производными кумарина возможно небольшое уменьшение протромбинового времени.

Колестирамин значительно уменьшает абсорбцию и энтерогепатическую циркуляцию ралоксифена.

При одновременном применении с ампициллином снижается максимальная концентрация ралоксифена в плазме, однако, степень всасывания и скорость элиминации ралоксифена не меняются.

Не рекомендуется комбинированная терапия ралоксифеном и эстрогенами из-за отсутствия клинических данных о безопасности их одновременного применения.

На фоне применения ралоксифена незначительно увеличивается концентрация глобулинов, связывающих гормоны, в т.ч. глобулина, связывающего половые гормоны, тироксин-связывающего глобулина и глобулина, связывающего кортикостероиды, с одновременным повышением суммарной концентрации гормонов. Эти изменения не влияют на концентрацию свободных гормонов.

Особые указания и меры предосторожности:

Не рекомендуется применение у пациентов с выраженными нарушениями функции печени.

Если на фоне применения ралоксифена возникают заболевания или состояния, ведущие к длительной иммобилизации, лечение необходимо прекратить. Возобновление терапии возможно только после восстановления двигательных функций.

В период лечения следует дополнительно назначать препараты кальция. При развитии маточного кровотечения необходимо полное обследование.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при заболеваниях печени (включая холестаз).

Применение в пожилом возрасте

При применении у пациенток пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

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