Фарестон



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, плоские, со скошенным краем, с кодом "ТО20" на одной стороне.

	1 таб.
торемифен (в форме цитрата)	20 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, лактоза, повидон, натрия крахмала гликолат (тип А), магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, кремний коллоидный безводный.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.
30 шт. - флаконы полиэтиленовые (1) - пачки картонные.
60 шт. - флаконы полиэтиленовые (1) - пачки картонные.
100 шт. - флаконы полиэтиленовые (1) - пачки картонные.

Таблетки белого цвета, круглые, плоские, со скошенным краем, с кодом "ТО60" на одной стороне.

	1 таб.
торемифен (в форме цитрата)	60 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, лактоза, повидон, натрия крахмала гликолат (тип А), магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, кремний коллоидный безводный.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
30 шт. - флаконы полиэтиленовые (1) - пачки картонные.
60 шт. - флаконы полиэтиленовые (1) - пачки картонные.
100 шт. - флаконы полиэтиленовые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоопухолевый антиэстрогенный нестероидный препарат, производное трифенилэтилена.

Торемифен специфически связывается с эстрогенными рецепторами, конкурируя с эстрадиолом, ингибирует вызванный эстрогенами синтез ДНК и репликацию клеток. В высоких дозах торемифен может оказывать противоопухолевый эффект, не связанный с эстрогенозависимым действием.

У больных раком молочной железы противоопухолевое действие торемифена в основном связано с его антиэстрогенной активностью, хотя нельзя исключить и другие механизмы (регуляция экспрессии онкогена, секреции фактора роста, индукция апоптоза, влияние на кинетику клеточного цикла).

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь торемифен полностью абсорбируется. C_{max} в плазме крови достигается через 3 ч (2-5 ч). Прием пищи не оказывает влияния на полноту абсорбции, но может увеличить время достижения C_{max} на 1.5-2 ч. Эти изменения не имеют клинического значения.

Распределение

Связывание с белками плазмы (главным образом с альбумином) - 99.5%. C_{ss} в плазме крови устанавливается в течение 3-4 недель (при дозе 60 мг/сут).

Метаболизм и выведение

За быстрой фазой распределения со средним $T_{1/2}$ около 4 ч (2-12 ч) наступает фаза медленного выведения со средним $T_{1/2}$ около 5 сут (2-10 сут).

Торемифен метаболизируется в печени путем гидроксилирования и деметилирования при участии изофермента CYP3A4 с образованием активного метаболита - N-деметилторемифена. Средний $T_{1/2}$ N-деметилторемифена - 11 сут (4-20 сут). В сыворотке крови обнаружены еще 3 метаболита: деаминогидрокситоремифен, 4-гидрокситоремифен и N,N-дидеметилторемифен. Общий клиренс - 5 л/ч.

Выводится через кишечник, в основном в виде метаболитов; около 10% - почками.

Показания к применению:

— эстрогенозависимый рак молочной железы у женщин в постменопаузном периоде.

Относится к болезням:

- Рак
- Рак молочной железы

Противопоказания:

— гиперплазия эндометрия (в т.ч. в анамнезе);

— тяжелая печеночная недостаточность (в т.ч. в анамнезе);

— тромбоэмболия (в т.ч. в анамнезе);

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к препарату.

С *осторожностью* назначают препарат при лейкопении, тромбоцитопении, гиперкальциемии (в т.ч. при метастазах в костную ткань).

Способ применения и дозы:

Назначают внутрь. Режим дозирования устанавливается индивидуально.

В качестве стандартной дозы для первой линии гормонотерапии рекомендуется прием в дозе 60 мг ежедневно длительно.

При назначении Фарестона в качестве второй линии гормонального лечения доза препарата может быть увеличена до 240 мг/сут (по 120 мг 2 раза/сут).

При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата отменяют.

Побочное действие:

Эффекты, обусловленные антиэстрогенным действием: наиболее часто - приступообразные ощущения жара

(приливы), повышенная потливость, влагалищные кровотечения или выделения, повышенная утомляемость, тошнота, сыпь, зуд в области гениталий, задержка жидкости, головокружение, депрессия. Эти эффекты выражены обычно в легкой степени.

Со стороны эндокринной системы: редко - увеличение массы тела.

Со стороны пищеварительной системы: редко - анорексия, рвота, запор.

Со стороны ЦНС: редко - головная боль, бессонница, повышение уровня трансаминаз; в отдельных случаях - тяжелые нарушения функции печени (желтуха).

Со стороны органа зрения: редко - нарушение зрения, включая изменения роговицы, катаракту.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - тромбоз глубоких вен, эмболия легочной артерии.

Дерматологические реакции: редко - кожная сыпь, алопеция.

Прочие: редко - одышка.

У пациенток с метастазами в кости отмечались случаи развития гиперкальциемии в самом начале лечения.

Повышается риск изменений эндометрия, таких как гиперплазия, полипоз и рак. Это может быть вызвано главным фармакологическим свойством препарата - эстрогенной стимуляцией.

Передозировка:

Симптомы: при суточной дозе Фарестона 680 мг наблюдались головокружение, головные боли, тошнота и/или рвота. Теоретически передозировка может проявляться усилением антиэстрогенных эффектов (приливы) или эстрогенных эффектов (вагинальные кровотечения).

Лечение: проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Фарестон противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Препараты, снижающие почечную экскрецию кальция (в т.ч. тиазидные диуретики), могут повышать риск возникновения гиперкальциемии.

Индукторы микросомального окисления (например, фенобарбитал, фенитоин или карбамазепин), могут ускорять метаболизм торемифена, снижая его концентрацию в сыворотке. В таких случаях суточную дозу следует удвоить.

Взаимодействие между антиэстрогенами и варфарином может привести к выраженному увеличению времени кровотечения (следует избегать одновременного применения торемифена и препаратов этой группы).

Теоретически метаболизм торемифена может замедляться под влиянием препаратов, ингибирующих изофермент CYP3A4, при участии которого осуществляется метаболизм торемифена. К таким препаратам относятся кетоконазол и другие подобные противогрибковые препараты, а также эритромицин, олеандомицин.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом лечения пациентка должна пройти обследование у гинеколога. Особое внимание следует уделить состоянию слизистой эндометрия. Затем гинекологические обследования необходимо повторять не менее 1 раза в год.

Пациентки, страдающие такими заболеваниями как артериальная гипертензия, сахарный диабет, имеющие высокий уровень индекса массы тела (>30) или получавшие длительную ЗГТ, находятся в группе риска по возникновению рака эндометрия и поэтому нуждаются в тщательном мониторинге.

Торемифен не рекомендуется применять у пациенток, у которых в анамнезе были случаи тяжелой тромбоэмболической болезни.

Больные с декомпенсированной сердечной недостаточностью или тяжелой стенокардией нуждаются в тщательном

мониторинге.

Поскольку у больных с метастазами в кости в начале лечения препаратом может развиться гиперкальциемия, эти пациентки нуждаются в тщательном мониторинге.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности (в т.ч. в анамнезе).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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