

Фемостон 1/5 Конт



Полезные ссылки:

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

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой оранжево-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "379" на одной стороне таблетки.

	1 таб.
эстрадиола гемигидрат	1.03 мг,
что соответствует содержанию эстрадиола	1 мг
дидрогестерон	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 114.7 мг, гипромеллоза - 2.8 мг, крахмал кукурузный - 14.4 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.4 мг, магния стеарат - 0.7 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай ОУ-8734 оранжевый (гипромеллоза - 2.844 мг, макрогол 400 - 0.284 мг, титана диоксид (E171) - 0.8 мг, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.048 мг, краситель железа оксид красный (E172) - 0.024 мг) - 4 мг.

28 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный противоклимактерический препарат.

Эстрадиол, входящий в состав препарата Фемостон 1/5 конт, идентичен эндогенному эстрадиолу человека, который является наиболее активным эстрогеном. Эстрадиол восполняет дефицит эстрогенов в женском организме после наступления менопаузы и уменьшает климактерические симптомы в течение первых недель лечения.

Дидрогестерон представляет собой гестаген, эффективный при приеме внутрь и имеющий схожую с парентерально вводимым прогестероном активность.

При проведении заместительной гормональной терапии (ЗГТ) включение дидрогестерона обеспечивает полноценную секреторную трансформацию эндометрия, снижая тем самым увеличенный под действием эстрогенов риск развития гиперплазии эндометрия.

ЗГТ препаратом Фемостон 1/5 конт предупреждает потерю костной массы в постменопаузном периоде.

Фармакокинетика

Эстрадиол

Всасывание

Всасывание эстрадиола зависит от размера частиц; микронизированный эстрадиол легко всасывается из ЖКТ.

Распределение

При ежедневном применении препарата Фемостон 1/5 конти C_{ss} эстрадиола в плазме крови достигается примерно через 5 дней.

Эстроген можно обнаружить как в связанном, так и в свободном состоянии. Около 98-99% дозы эстрадиола связывается с белками плазмы, из которых 30-52% связываются с альбумином и около 46-69% - с глобулином, связывающим половые гормоны (ГСПГ).

Эстрогены выделяются с грудным молоком.

Метаболизм

Эстрадиол метаболизируется в печени до эстрона и эстрона сульфата, обладающих эстрогенной активностью. Эстрона сульфат может подвергаться кишечно-печеночной рециркуляции.

Выведение

Эстрон и эстрадиол выводятся в конъюгированном с глюкуроновой кислотой состоянии преимущественно почками. $T_{1/2}$ составляет 10-16 ч.

Дидрогестерон

Всасывание

После приема внутрь быстро всасывается и полностью метаболизируется. Значения времени достижения C_{max} для дидрогестерона варьируют от 30 мин до 2.5 ч. C_{max} 20 α -дигидродидрогестерона (ДГД) в плазме крови достигается приблизительно через 1.5 ч после приема препарата. Биодоступность дидрогестерона - 28%.

Сравнение фармакокинетики при однократном и многократном применении показало, что фармакокинетические свойства дидрогестерона и ДГД не меняются при многократном применении.

Распределение

Более 90% дидрогестерона и ДГД связываются с белками плазмы. C_{ss} дидрогестерона достигается через 3 дня после начала лечения.

Метаболизм

Основным метаболитом дидрогестерона является 20 α -дигидродидрогестерон (ДГД). Концентрация ДГД в плазме крови существенно превышает исходную концентрацию дидрогестерона, соотношения значений AUC и C_{max} ДГД к дидрогестерону составляют около 40 и 25, соответственно.

Общей характерной особенностью всех метаболитов дидрогестерона является сохранение конфигурации 4,6-диен-3-она исходного вещества и отсутствие 17 α -гидроксилирования, что обуславливает отсутствие эстрогенной и андрогенной активности.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет для дидрогестерона 5-7 ч, для ДГД - 14-17 ч.

Полностью дидрогестерон выводится через 72 ч. В среднем, 63% от принятой дозы выводится почками. Общий плазменный клиренс - 6.4 л/мин. ДГД определяется в моче преимущественно в виде конъюгата глюкуроновой кислоты.

Показания к применению:

— заместительная гормональная терапия расстройств, обусловленных дефицитом эстрогенов у женщин в постменопаузе (не ранее чем через 12 мес после последней менструации);

— профилактика постменопаузного остеопороза у женщин с высоким риском переломов при непереносимости или противопоказаниях к применению других лекарственных препаратов.

Относится к болезням:

- [Остеопороз](#)

Противопоказания:

- беременность;
- период лактации;
- диагностированный или предполагаемый рак молочной железы;
- диагностированные или предполагаемые эстрогензависимые злокачественные новообразования (например, рак эндометрия);
- диагностированные или предполагаемые прогестагензависимые новообразования (например, менингиома);
- кровотечения из влагалища неясной этиологии;
- нелеченная гиперплазия эндометрия;
- тромбоз эмболические заболевания в настоящее время или в анамнезе (в т.ч. тромбоз, тромбоз глубоких вен, эмболия легочной артерии, инфаркт миокарда, ишемические и геморрагические цереброваскулярные нарушения);
- множественные или выраженные факторы артериального или венозного тромбоза, связанные с врожденной или приобретенной предрасположенностью, например, недостаточность протеина С, недостаточность протеина S, недостаточность антитромбина III, наличие антител к фосфолипидам (антитела к кардиолипину, волчаночный антикоагулянт), стенокардия, длительная иммобилизация, тяжелые формы ожирения (ИМТ более 30 кг/м²), заболевания сосудов головного мозга или коронарных артерий, транзиторные ишемические атаки, осложненные поражения клапанного аппарата сердца, фибрилляция предсердий;
- острые или хронические заболевания печени в настоящее время или в анамнезе (до нормализации лабораторных показателей функции печени), в т.ч. злокачественные опухоли печени;
- порфирия;
- непереносимость галактозы, недостаточность лактазы, синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы;
- повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Применение препарата Фемостон 1/5 контри следует прекратить при возникновении следующих состояний:

- желтухи и/или нарушения функции печени;
- неконтролируемой артериальной гипертензии;
- впервые появившейся на фоне применения препаратов для ЗГТ мигреноподобной головной боли.

С *осторожностью* ЗГТ в постменопаузе назначается женщинам, если в настоящее время или в анамнезе у них были диагностированы:

- лейомиома матки, эндометриоз;
- наличие факторов риска для возникновения эстрогензависимых опухолей (например, I степень наследственности рака молочной железы);
- артериальная гипертензия;
- доброкачественные опухоли печени;
- холелитиаз;
- сахарный диабет, как при наличии сосудистых осложнений, так и в случаях их отсутствия;
- мигрень или интенсивная головная боль;
- системная красная волчанка;
- гиперплазия эндометрия в анамнезе;
- эпилепсия;
- бронхиальная астма;
- отосклероз.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь ежедневно, в непрерывном режиме по 1 таб./сут (желательно в одно и то же время суток) независимо от приема пищи.

При переходе с другого непрерывного последовательного или циклического режима приема препарата пациентке следует закончить текущий цикл, а затем перейти на Фемостон 1/5 контри.

При переходе с непрерывного комбинированного режима терапии можно начать прием Фемостон 1/5 контри в любой день.

Если пациентка пропустила прием очередной дозы, таблетку необходимо принять в течение 12 ч после обычного времени приема; в противном случае пропущенную таблетку принимать не следует, на следующий день необходимо принять таблетку в обычное время. Пропуск приема препарата может увеличивать вероятность прорывного маточного кровотечения.

Побочное действие:

В клинических исследованиях у пациенток, получавших терапию комбинацией эстрадиол/дидрогестерон, наиболее часто встречались: головная боль, боль в животе, напряжение/болезненность молочных желез и боль в спине.

В клинических исследованиях (n=4929) наблюдались следующие нежелательные эффекты с частотой развития, указанной ниже (количество зарегистрированных случаев/количество пациентов): очень часто (от 1/10); часто (от 1/100 до 1/10); нечасто (от 1/1000 до 1/100), редко (от 1/10 000 до 1/1000), очень редко (<1/10 000).

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; часто - мигрень, головокружение.

Со стороны психики: часто - депрессия, нервозность; нечасто - изменение либидо.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - повышение АД, венозная тромбоэмболия; редко - инфаркт миокарда.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - боль в области живота; часто - метеоризм, тошнота, рвота; нечасто - заболевания желчного пузыря, нарушение функции печени, иногда в сочетании с желтухой, астенией, недомоганием, болью в животе.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: очень часто - напряжение/болезненность молочных желез; часто - мажущие кровянистые выделения, метроррагия, обильное менструальноподобное кровотечение, скудные или отсутствие менструальноподобных кровотечений, ациклические кровянистые выделения, болезненные менструальноподобные кровянистые выделения, боль внизу живота, изменение влагалищной секреции, кандидоз влагалища; нечасто - увеличение размеров лейомиомы, увеличение молочных желез, предменструальноподобный синдром.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - цистит.

Со стороны костно-мышечной системы: очень часто - боль в спине (пояснице).

Дерматологические реакции: редко - сосудистая пурпура.

Со стороны иммунной системы: нечасто - повышенная чувствительность к препарату или любому из компонентов препарата; часто - аллергические реакции, такие как крапивница, кожная сыпь и зуд; редко - ангионевротический отек.

Со стороны организма в целом: часто - астенические состояния (слабость, недомогание, усталость), периферические отеки.

Прочие: часто - увеличение массы тела; нечасто - снижение массы тела.

Другие побочные эффекты, вызванные лечением комбинацией эстрогена и прогестагена (включая эстрадиол/дидрогестерон).

Доброкачественные, злокачественные и неуточненные новообразования: например, рак эндометрия, рак яичников, менингиома.

Со стороны системы кроветворения: гемолитическая анемия.

Со стороны иммунной системы: системная красная волчанка.

Со стороны нервной системы: риск развития деменции у женщин, начинающих применение препаратов для ЗГТ в возрасте старше 65 лет, хорея, провоцирование приступов эпилепсии.

Со стороны органа зрения: непереносимость контактных линз, увеличение кривизны роговицы.

Дерматологические реакции: хлоазма и/или меланодермия, которые могут сохраняться после прекращения приема препарата, многоформная эритема, узловатая эритема.

Со стороны костно-мышечной системы: судороги в мышцах нижних конечностей.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная тромбоэмболия.

Со стороны мочевыделительной системы: недержание мочи.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: фиброзно-кистозная мастопатия, эрозия шейки матки.

Врожденные и наследственные нарушения: ухудшение течения сопутствующей порфирии.

Со стороны обмена веществ: гипертриглицеридемия.

Со стороны пищеварительной системы: панкреатит (у пациенток с гипертриглицеридемией).

Со стороны лабораторных показателей: повышение содержания тиреоидных гормонов.

Передозировка:

Эстрадиол и дидрогестерон - вещества с низкой токсичностью.

Симптомы: могут возникнуть тошнота, рвота, напряжение молочных желез, головокружение, боль в области живота, сонливость/слабость, кровотечение отмены.

Лечение: проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания.

При наступлении беременности на фоне лечения препаратом Фемостон 1/5 конти терапию следует немедленно прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Эстрогенное и гестагенное действие препарата Фемостон 1/5 конти может снижаться при одновременном применении с препаратами-индукторами микросомальных ферментов печени (СУР2В6, СУР3А4, СУР3А5, СУР3А7): противосудорожными (фенобарбитал, карбамазепин, фенитоин) и антимикробными препаратами (рифампицин, рифабутин, невирапин, эфавиренз); с препаратами растительного происхождения, содержащими зверобой продырявленный (*Hypericum perforatum*); с ритонавиром и нелфинавиром. Усиление метаболизма эстрогенов и гестагенов клинически может проявляться снижением эффекта от применения препарата и изменением интенсивности кровянистых выделений из влагалища.

Эстрогены могут влиять на метаболизм других лекарственных препаратов за счет конкурентного связывания с ферментами системы цитохрома Р450, участвующими в их расщеплении. Это необходимо учитывать для препаратов с узким профилем терапевтического действия, таких как такролимус и циклоспорин А (СУР3А4, СУР3А3), фентанил (СУР3А4) и теofilлин (СУР1А2), т.к. данный вид взаимодействия может привести к увеличению концентрации в плазме крови вышеуказанных препаратов до токсического уровня. В связи с этим может потребоваться тщательное наблюдение за состоянием пациента в течение длительного периода времени и, возможно, уменьшение дозы такролимуса, фентанила, циклоспорина А и теofilлина.

Исследования по изучению взаимодействия с другими лекарственными препаратами не проводились.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат назначают только при наличии симптомов, неблагоприятно влияющих на качество жизни. Терапию следует продолжать до тех пор, пока польза от приема препарата превышает риск развития побочных эффектов. Опыт применения препарата у женщин старше 65 лет ограничен.

Медицинское обследование

Перед назначением или возобновлением терапии препаратом Фемостон 1/5 конти необходимо собрать полный медицинский и семейный анамнез и провести общее и гинекологическое (в т.ч. молочных желез) обследование пациентки с целью выявления возможных противопоказаний и состояний, требующих соблюдения мер предосторожности. Во время лечения препаратом Фемостон 1/5 конти рекомендуется проводить периодические обследования, частоту и характер которых определяют индивидуально, но не менее 1 раза в 6 мес. Целесообразно проведение маммографии для дополнительного исследования молочных желез. Женщины должны быть проинформированы о тех возможных изменениях молочных желез, о которых требуется сообщить лечащему врачу.

Применение эстрогенов может повлиять на результаты следующих лабораторных тестов: определение толерантности к глюкозе, исследование функций щитовидной железы и печени.

Гиперплазия эндометрия

Риск развития гиперплазии и рака эндометрия при применении пациентками только эстрогенов зависит от дозы и продолжительности лечения и увеличивается от 2 до 12 раз по сравнению с отсутствием лечения; риск может оставаться повышенным в течение 10 лет после прекращения терапии.

Циклическое применение гестагена (по крайней мере, в течение 12 дней 28-дневного цикла) или применение непрерывного комбинированного режима ЗГТ у женщин с сохраненной маткой могут предотвратить повышенный в результате применения эстрогенов риск гиперплазии и рака эндометрия.

В целях своевременной диагностики целесообразно проведение ультразвукового скрининга, при необходимости - проведение гистологического (цитологического) исследования.

Кровянистые выделения из влагалища

В первые месяцы лечения препаратом могут отмечаться прорывные кровотечения и/или ациклические менструальноподобные кровянистые выделения из влагалища. Если подобные кровотечения появляются через некоторое время после начала терапии или продолжаются после прекращения лечения, следует установить их причину. Возможно проведение биопсии эндометрия для исключения злокачественного новообразования.

Венозная тромбоэмболия

ЗГТ связана с 1.3-3-кратным риском развития венозной тромбоэмболии (ВТЭ), т.е. тромбоза глубоких вен или эмболии легочной артерии. Такое явление наиболее вероятно в течение первого года ЗГТ.

При наличии тромбоэмболических осложнений у родственников 1-й степени родства в молодом возрасте, а также при привычном невынашивании беременности в анамнезе, необходимо проводить исследование гемостаза. Если пациентка принимает антикоагулянты, необходимо тщательно оценить целесообразность назначения препарата Фемостон 1/5 конти с точки зрения соотношения польза/риск. До завершения тщательной оценки факторов возможного развития тромбоэмболии или начала антикоагулянтной терапии препарат Фемостон 1/5 конти не следует назначать.

При выявлении тромбофилического состояния у члена семьи и/или в случае выраженности или тяжести дефекта (например, недостаточность антитромбина III, протеина S или C, а также при комбинации дефектов), препарат Фемостон 1/5 конти противопоказан.

Поскольку у пациенток с диагностированными тромбофилическими состояниями существует повышенный риск развития венозной тромбоэмболии, применение препарата Фемостон 1/5 конти, который увеличивает этот риск, противопоказано.

В большинстве случаев к факторам риска развития ВТЭ относятся: применение эстрогенов, пожилой возраст, обширные хирургические вмешательства, длительная иммобилизация, ожирение (ИМТ > 30 кг/м²), беременность или послеродовой период, системная красная волчанка и злокачественные новообразования. Нет единого мнения о возможной роли варикозного расширения вен в развитии ВТЭ.

Для предотвращения ВТЭ после хирургического вмешательства у всех послеоперационных больных необходимо рассмотреть вопрос о проведении профилактических мероприятий.

В случае длительной иммобилизации после оперативного вмешательства (за 4-6 недель) рекомендуется прекратить применение препарата Фемостон 1/5 конти и не следует возобновлять до тех пор, пока у женщины полностью не восстановится подвижность. Если ВТЭ развивается уже после начала терапии, то следует прекратить применение препарата, а пациентки должны быть информированы о том, что следует немедленно обратиться к врачу в случае возникновения какого-либо симптома, свидетельствующего о развитии тромбоэмболии (например, болезненность или отечность нижних конечностей, внезапная боль в груди, одышка).

Рак молочной железы и рак яичников

У женщин, длительно получавших ЗГТ с применением только эстрогенов или комплекса эстроген/прогестерон, увеличивается частота диагностирования рака молочной железы, которая возвращается к исходному уровню в течение 5 лет после прекращения терапии.

Увеличение подобного риска зависит от длительности применения ЗГТ. У женщин, принимающих комбинированную эстроген-гестагеновую ЗГТ более 5 лет, риск развития рака молочной железы может увеличиться в 2 раза.

На фоне ЗГТ может наблюдаться увеличение плотности тканей молочной железы при проведении маммографии, что может затруднять диагностирование рака молочной железы.

Рак яичников встречается значительно реже рака молочной железы. Длительное применение (не менее 5-10 лет) эстрогенов в режиме монотерапии при ЗГТ связано с незначительным повышением риска развития рака яичников. Данные некоторых исследований, включая WHI, указывают на то, что комбинированная ЗГТ может в такой же или несколько меньшей степени повышать риск развития данной патологии.

Риск ишемического инсульта

Комбинированная терапия эстрогеном и гестагеном или терапия только эстрогеном связаны с повышением относительного риска ишемического инсульта в 1.5 раза. Риск геморрагического инсульта при получении ЗГТ не повышается.

Относительный риск не зависит от возраста или продолжительности терапии, однако исходный риск сильно зависит от возраста, таким образом, общий риск инсульта у женщин, получающих ЗГТ, будет повышаться с возрастом.

Ишемическая болезнь сердца (ИБС)

Относительный риск ИБС во время применения комбинированной ЗГТ (эстроген+гестаген) незначительно повышается. В связи с тем, что абсолютный риск ИБС сильно зависит от возраста, число дополнительных случаев ИБС из-за приема комбинированной ЗГТ у здоровых женщин в пременопаузе очень невелико, однако оно повышается с возрастом.

Другие состояния

Эстрогены могут вызвать задержку жидкости, что может неблагоприятно сказаться на состоянии пациенток с нарушением функции почек и сердца.

У женщин с гипертриглицеридемией на фоне проведения ЗГТ в очень редких случаях может иметь место значительное повышение концентрации триглицеридов в плазме крови, что способствует развитию панкреатита.

Эстрогены увеличивают содержание тиреоид-связывающего глобулина, что приводит к общему увеличению концентрации циркулирующих гормонов щитовидной железы (концентрации свободных гормонов Т3 и Т4 обычно не изменяются). Концентрации других связывающих белков в сыворотке крови (транскортин, глобулин, связывающий половые гормоны) могут также повышаться, что приводит к увеличению концентрации циркулирующих кортикостероидов и половых гормонов. Концентрации свободных или биологически активных гормонов не изменяются. Возможно увеличение концентрации других плазменных белков (субстрат ангиотензиноген/ренина, α -1-антитрипсин, церулоплазмин).

Применение ЗГТ не улучшает когнитивные функции. Имеются сообщения о повышении риска развития деменции у женщин, начавших применение ЗГТ (комбинированной или только эстрогенсодержащей) после 65 лет.

Препарат Фемостон 1/5 конт не является контрацептивным средством.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами, учитывая риск возникновения побочных реакций со стороны нервной системы.

При нарушениях функции почек

Эстрогены могут вызвать задержку жидкости, что может неблагоприятно сказаться на состоянии пациенток с нарушением функции почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при острых или хронических заболеваниях печени в настоящее время или в анамнезе (до нормализации лабораторных показателей функции печени), в т.ч. злокачественных опухолях печени.

Применение препарата следует прекратить при возникновении желтухи и/или нарушении функции печени.

С осторожностью следует применять препарат при доброкачественных опухолях печени.

Применение в пожилом возрасте

Опыт применения препарата у женщин старше 65 лет ограничен.

Имеются сообщения о повышении риска развития деменции у женщин, начавших применение ЗГТ (комбинированной или только эстрогенсодержащей) после 65 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте, при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Femoston_15_Konti