

## Иматиниб-Медак



### **Полезные ссылки:**

[Цена в Яндексе](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)  
[Госреестр](#) [Википедия](#)  
[РЛС](#) [VIDAL](#) [Mail.Ru Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### **Форма выпуска:**

**Форма выпуска, описание и состав**

<b>Капсулы</b>	<b>1 капс.</b>
иматиниба мезилат	478 мг
что соответствует содержанию иматиниба	400 мг

15 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

### **Фармакологические свойства:**

**Фармакодинамика**

Ингибитор протеинкиназы. Ингибитирует фермент Bcr-Abl-тироzinкиназу на клеточном уровне, *in vitro* и *in vivo*. Селективно подавляет пролиферацию и вызывает апоптоз клеточных линий, позитивных по Bcr-Abl, а также молодых лейкозных клеток при хроническом миелолейкозе с положительной филадельфийской хромосомой и при остром лимфобластном лейкозе.

В исследованиях по трансформации колоний, проведенных на пробах периферической крови и костного мозга, было показано, что иматиниб селективно ингибитирует Bcr-Abl-позитивные колонии, полученные у больных хроническим миелолейкозом.

В исследованиях, проведенных *in vivo* на животных моделях с использованием Bcr-Abl-позитивных опухолевых клеток, было показано, что препарат обладает противоопухолевой активностью при монотерапии.

Кроме того, иматиниб является ингибитором рецепторов тирозин-киназы для фактора роста тромбоцитов и фактора стволовых клеток, а также подавляет клеточные реакции, опосредуемые вышеупомянутыми факторами.

*In vitro* иматиниб ингибирует пролиферацию и индуцирует апоптоз клеток стромальных опухолей ЖКТ, экспрессирующих kit-мутации.

**Фармакокинетика**

После приема внутрь биодоступность в среднем 98%. Коэффициент вариации для AUC составляет 40-60%. При приеме с пищей с высоким содержанием жиров, по сравнению с приемом натощак, отмечается незначительное снижение степени абсорбции (уменьшение  $C_{max}$  на 11%, AUC - на 7.4%) и замедление скорости абсорбции (удлинение  $T_{max}$  на 1.5 ч).

При клинически значимых концентрациях иматиниба его связывание с белками плазмы составляет около 95% (главным образом с альбумином и кислым альфа-гликопротеином, в незначительной степени - с липопротеином).

Основным метаболитом иматиниба, циркулирующим в кровяном русле, является N-деметилированное пиперазиновое

производное, которое *in vitro* обладает фармакологической активностью, сходной с таковой неизмененного активного вещества. Значение AUC для метаболита составляет 16% от AUC иматиниба.

После приема внутрь <sup>14</sup>C-меченого иматиниба за 7 дней было выведено с калом 68% введенной дозы и с мочой 13% дозы. В неизмененном виде выводится около 25% дозы (20% - с калом и 5% - с мочой). Остальное количество иматиниба выводится в виде метаболитов.

T<sub>1/2</sub> иматиниба у здоровых добровольцев составил около 18 ч.

При нарушении функции печени возможно повышение концентрации иматиниба в плазме крови.

## **Показания к применению:**

Хронический миелолейкоз в фазе акселерации, бластного криза, а также в хронической фазе; лечение неоперабельных и/или метастатических злокачественных стромальных опухолей желудочно-кишечного тракта (у взрослых пациентов).

## **Относится к болезням:**

- [Миелома](#)
- [Опухоли](#)

## **Противопоказания:**

Повышенная чувствительность к иматинибу.

## **Способ применения и дозы:**

Индивидуальный, в зависимости от показаний и схемы лечения.

## **Побочное действие:**

*Со стороны системы кроветворения:* часто - нейтропения, тромбоцитопения, анемия, фебрильная нейтропения; возможны панцитопения, угнетение костно-мозгового кроветворения.

*Со стороны пищеварительной системы:* часто - анорексия, тошнота, рвота, диарея, диспепсия, боли в животе, вздутие живота, метеоризм, запор, рефлюкс-эзофагит, изъязвление полости рта, повышение активности печеночных ферментов; возможны гипербилирубинемия, желтуха, гепатит; редко - желудочно-кишечные кровотечения, мелена, асцит, язва желудка, гастрит, гастро-эзофагеальный рефлюкс, сухость во рту, печеночная недостаточность, колит, непроходимость кишечника, панкреатит, повышение аппетита.

Имеются отдельные сообщения о развитии цитолитического или холестатического гепатита и печеночной недостаточности, в некоторых случаях приводивших к летальному исходу; гастроэнтерит.

*Со стороны обмена веществ:* редко - дегидратация, гиперурикемия, гипокалиемия, гиперкалиемия, гипонатриемия, повышение концентрации мочевой кислоты в крови, подагра), гипофосфатемия, гиперкалиемия, гипонатриемия.

*Со стороны ЦНС и периферической нервной системы:* часто - головная боль, головокружение, нарушение вкуса, парестезии, бессонница; возможны геморрагический инсульт, обморок, периферическая невропатия, гипестезия, сонливость, мигрень, депрессия, нарушение памяти, тревога, снижение либido; редко - спутанность сознания, отек мозга, повышение внутричерепного давления, судороги.

*Со стороны органа зрения:* часто - конъюнктивит, повышение слезоотделения, затуманивание зрения; возможны раздражение глаз, кровоизлияние в конъюнктиву, сухость конъюнктивы, отечность век; редко - макулярный отек, папиллярный отек, ретинальные геморрагии, геморрагии в стекловидное тело, глаукома.

*Слуховые и вестибулярные нарушения:* возможны головокружение, шум в ушах.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* возможны сердечная недостаточность, отек легких, тахикардия, гематомы, артериальная гипертензия, артериальная гипотензия, приливы к лицу, похолодание конечностей; редко - гидроперикардит, перикардит, тромбоз/эмболия.

*Со стороны дыхательной системы:* часто - диспноэ; возможны плевральный выпот, боли в глотке или горлани, кашель; редко - легочный фиброз, интерстициальная пневмония.

**Дерматологические реакции:** часто - периорбитальные отеки, дерматит, экзема, сыпь, отечность лица, отечность век, зуд, эритема, сухость кожи, алопеция, ночная потливость; возможны петехии, повышенное потоотделение, уртикария, повреждение ногтей, реакции фотосенсибилизации, пурпур, гипотрихоз, хейлит, гиперпигментация кожи, гипопигментация кожи, псориаз, эксфолиативный дерматит, буллезная сыпь; редко - ангионевротический отек, везикулярная сыпь, синдром Стивенса-Джонсона.

**Со стороны костно-мышечной системы:** часто - мышечные спазмы и судороги, мышечно-скелетные боли и артралгии, припухание суставов; возможны ишиалгии, скованность мышц и суставов.

**Со стороны мочевыделительной системы:** возможны почечная недостаточность, боли в почках, частое мочеиспускание, гематурия.

**Со стороны репродуктивной системы:** возможны гинекомастия, увеличение молочных желез, отек мошонки, боль в сосках, снижение потенции.

**Со стороны организма в целом:** часто - задержка жидкости, отеки; часто - лихорадка, слабость, озноб; иногда - сильное недомогание, геморрагии; редко - анасарка, геморрагии в опухоли, некроз опухоли.

**Прочие:** часто - увеличение массы тела, носовые кровотечения; иногда - повышение ЩФ, креатинина, КФК, ЛДГ, снижение массы тела.

Возможны сепсис, герпес простой, герпес опоясывающий, инфекции верхних отделов дыхательных путей.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

При одновременном применении с препаратами, ингибирующими изофермент CYP3A4 (в т.ч. кетоконазола) возможно повышение концентрации иматиниба в плазме крови.

Напротив, одновременное применение препаратов, являющихся индукторами изофермента CYP3A4 (например, дексаметазона), может привести к усилению метаболизма иматиниба и снижению его концентрации в плазме.

При одновременном применении с симвастатином отмечается увеличение  $C_{max}$  и AUC симвастатина в 2 и 3.5 раза соответственно, что является следствием ингибирования изофермента CYP3A4 под влиянием иматиниба.

Рекомендуется с осторожностью применять иматиниб одновременно с препаратами, являющимися субстратами CYP3A4 и имеющими узкий диапазон терапевтической концентрации, а также с препаратами, содержащими парацетамол.

В исследованиях *in vitro* было показано, что иматиниб ингибирует изофермент CYP2D6 в тех же концентрациях, в которых он ингибирует CYP3A4. В связи с этим следует учитывать возможность усиления эффектов препаратов, являющихся субстратами изофермента CYP2D6, при их совместном применении с иматинибом.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

### Диагнозы

- Лимфогранулематоз
- Лучевая терапия
- Меланома
- Особенности ухода за онкологическими больными

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Imatinib-Medak>