Калумид



Код АТХ:

- L02BB03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бикалутамид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "L" на одной стороне и "RG" - на другой.

	1 таб.
бикалутамид	50 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, повидон K30, карбоксиметилкрахмал натрия (тип A), лактозы моногидрат.

Состав оболочки: опадрай II33G28707 белый (триацетин, макрогол 3000, лактозы моногидрат, титана диоксид, гипромеллоза).

15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с выгравированным знаком "XL" на одной стороне и "RG" - на другой.

	1 таб.
бикалутамид	150 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный - 1.5 мг, магния стеарат - 1.875 мг, повидон - 12 мг, натрия карбоксиметилкрахмал (тип A) - 18 мг, лактозы моногидрат - 191.625 мг.

Состав оболочки: опадрай II.33G28523 белый - 7.5 мг (глицерил триацетат - 6%, макрогол 3000 - 8%, лактозы моногидрат - 21%, титана диоксид - 25%, гипромеллоза - 40%).

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Противоопухолевые средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антиандрогенный нестероидный препарат. Представляет собой рацемическую смесь, причем антиандрогенной активностью обладает преимущественно (R)-энантиомер. Не обладает другими видами эндокринной активности.

Связывается с андрогенными рецепторами и, не активируя экспрессию генов, подавляет стимулирующее влияние андрогенов. Результатом этого является регрессия злокачественных новообразований предстательной железы.

У некоторых пациентов прекращение приема бикалутамида может привести к развитию клинического "синдрома отмены антиандрогенов".

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь бикалутамид быстро и полностью абсорбируется из ЖКТ. Прием пищи не влияет на всасывание.

Распределение

Связывание с белками плазмы высокое (для рацемической смеси 96%, для (R)-энантиомера 99.6%). Интенсивно метаболизируется в печени путем окисления и образования конъюгатов с глюкуроновой кислотой.

При ежедневном приеме препарата Калумид концентрация (R)-энантиомера в плазме увеличивается примерно в 10 раз вследствие длительного $T_{1/2}$, что делает возможным прием препарата 1 раз/сут.

При ежедневном приеме препарата Калумид в дозе 50 мг C_{ss} (R)-энантиомера в плазме составляет около 9 мкг/мл, а при приеме 150 мг препарата Калумид - 22 мкг/мл. При равновесном состоянии около 99% всех циркулирующих в крови энантиомеров составляет активный (R)-энантиомер.

Метаболизм

Интенсивно метаболизируется в печени (путем окисления и образования коньюгатов с глюкуроновой кислотой).

Выведение

Метаболиты выводятся почками и через кишечник примерно в равных соотношениях.

(S)-энантиомер выводится из организма гораздо быстрее (R)-энантиомера, $T_{1/2}$ последнего около 7 дней.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетика (R)-энантиомера не зависит от возраста, нарушения функции почек, а также от легкого или умеренного нарушения функции печени.

Имеются данные о том, что у больных со средними или тяжелыми нарушениями функции печени замедляется элиминация (R)-энантиомера из плазмы и может наблюдаться кумуляция бикалутамида.

Показания к применению:

— распространенный рак предстательной железы в составе комбинированной терапии с аналогом ГнРГ (гонадотропин рилизинг-гормон) или в сочетании с хирургической кастрацией (для таблеток 50 мг);

— местно-распространенный рак предстательной железы (T3-T4, любая N, M0; T1-T2, N+, M0) в качестве монотерапии или адъювантной терапии в сочетании с радикальной простатэктомией или радиотерапией;

— местно-распространенный неметастатический рак предстательной железы в случаях, когда хирургическая кастрация или другие медикаментозные вмешательства неприменимы или неприемлемы.

Относится к болезням:

- Простатит
- Рак

Противопоказания:

— одновременный прием с терфенадином, астемизолом, цизапридом;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Калумид не назначают женщинам и детям.

С *осторожностью* следует назначать препарат при нарушении функции печени, недостаточности лактазы, непереносимости лактозы, мальабсорбции глюкозы/галактозы (в лекарственной форме препарата содержится лактоза).

Способ применения и дозы:

Взрослым мужчинам (в т.ч. пожилого возраста) при *распространенном раке предстательной железы в комбинации с аналогом ГнРГ или хирургической кастрацией* препарат назначают в дозе 50 мг 1 раз/сут. Лечение препаратом Калумид необходимо начинать одновременно с началом приема аналога ГнРГ или хирургической кастрацией.

При *местно-распространенном раке предстательной железы* назначают по 150 мг 1 раз/сут. Калумид следует принимать длительно, как минимум в течение 2 лет. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить.

При **нарушении функции почек** коррекции дозы не требуется.

При **нарушении функции печени легкой степени** коррекции дозы не требуется. У пациентов со средними и тяжелыми нарушениями функции печени может наблюдаться повышенная кумуляция препарата.

Побочное действие:

Фармакологическое действие бикалутамида может обуславливать следующие побочные эффекты:

Очень часто (≥10%): гинекомастия (может сохраняться даже после прекращения терапии, особенно в случае приема препарата в течение длительного времени), болезненность грудных желез, "приливы" жара.

Часто (≥1% и <10%): диарея, тошнота, транзиторное повышение активности печеночных трансаминаз, холестаз и желтуха (описанные изменения функции печени редко оценивались, как серьезные, носили транзиторный характер, полностью исчезали или уменьшались при продолжении терапии или после отмены препарата), зуд, астения; при применении препарата в суточной дозе 150 мг - алопеция или восстановление роста волос, снижение полового влечения, сексуальные дисфункции, прибавка в весе.

Редко (≥0.1% и <1%): реакции повышенной чувствительности, включая ангионевротический отек и крапивницу, интерстициальные легочные заболевания; при применении препарата в суточной дозе 150 мг - боль в животе, депрессия, диспепсия, гематурия.

Очень редко (≥0.01% и <0.1%): рвота, сухость кожи (при применении препарата в суточной дозе 150 мг сухость кожи наблюдается часто), печеночная недостаточность (причинно-следственная связь с приемом бикалутамида достоверно не установлена).

При одновременном применении бикалутамида и аналогов гонадотропин-рилизинг гормона (ГнРГ) могут наблюдаться также следующие побочные явления с частотой > 1% (причинно-следственная связь с приемом препарата не установлена, некоторые из отмеченных побочных эффектов встречались у пожилых пациентов).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердечная недостаточность.

Со стороны пищеварительной системы: анорексия, сухость во рту, диспепсия, запор, метеоризм.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, бессонница, повышенная сонливость.

Со стороны дыхательной системы: одышка.

Со стороны мочеполовой системы: сексуальная дисфункция, никтурия.

Со стороны кроветворной системы: анемия.

Со стороны кожи и ее придатков: алопеция, сыпь, повышенная потливость, гирсутизм.

Прочие: сахарный диабет, гипергликемия, повышение или снижение массы тела, боль в животе, боль в груди, боль в тазовой области, озноб.

Передозировка:

Случаи передозировки у человека не описаны. Специфический антидот не известен. Лечение симптоматическое. Проведение диализа не эффективно, так как бикалутамид прочно связывается с белками и не выводится с мочой в неизмененном виде. Рекомендуется общее поддерживающее лечение и строгий контроль жизненно важных функций организма.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Бикалутамид противопоказан женщинам и не должен назначаться беременным и кормящим матерям.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Нет данных о фармакокинетических или фармакодинамических взаимодействиях между бикалутамидом и аналогами ГнРГ.

В исследованиях in vitro показано, что (R)-энантиомер бикалутамида ингибирует CYP3A4, в меньшей степени влияя на активность CYP2C9, 2C19 и 2D6.

Потенциальной способности бикалутамида к взаимодействию с другими лекарственными препаратами не обнаружено, однако при использовании бикалутамида в течение 28 дней на фоне приема мидазолама, площадь под кривой AUC мидазолама увеличивается на 80%.

Несовместим с терфенадином, астемизолом, цизапридом.

Следует соблюдать осторожность при назначении бикалутамида одновременно с циклоспорином или блокаторами кальциевых каналов. Возможно, потребуется снижение дозы этих препаратов, особенно, в случае потенциирования или развития побочных явлений. После начала использования или отмены бикалутамида рекомендуют проводить тщательный мониторинг концентрации циклоспорина в плазме и клинического состояния пациента.

Одновременное применение бикалутамида и препаратов, угнетающих микросомальное окисление лекарственных средств, например, с циметидином или кетоконазолом может привести к увеличению концентрации бикалутамида в плазме и, возможно, к увеличению частоты возникновения побочных эффектов.

Усиливает действие антикоагулянтов кумаринового ряда, варфарина (конкуренция за связь с белками).

Особые указания и меры предосторожности:

Учитывая возможность замедления выведения бикалутамида и его кумуляции у больных с нарушением функции печени, целесообразно периодически оценивать функцию печени. Большинство изменений функции печени встречаются в течение первых шести месяцев лечения Калумидом.

В случае развития выраженных изменений функции печени прием Калумида необходимо прекратить.

У пациентов с прогрессированием заболевания на фоне повышения уровня простатспецифического антигена (ПСА) необходимо рассмотреть вопрос о прекращении лечения Калумидом.

При назначении Калумида пациентам, получающим антикоагулянты кумаринового ряда, рекомендуется регулярно контролировать протромбиновое время.

Учитывая возможность ингибирования Калумидом активности цитохрома Р450 (CYP3A4), следует проявлять осторожность при одновременном назначении Калумида с препаратами, преимущественно метаболизирующимися с участием CYP3A4.

Пациентов с непереносимостью лактозы необходимо проинформировать о том, что 1 таблетка 50 мг содержит 63.875 мг лактозы моногидрата, 1 таблетка 150 мг содержит 191.625 мг лактозы моногидрата.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Калумид не влияет на способность пациентов управлять транспортными средствами или заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При **нарушении функции почек** коррекции дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

С осторожностью назначают при нарушениях функции печени. При **незначительных нарушениях функции печени** коррекции дозы не требуется.

Применение в пожилом возрасте

Применение возможно согласно режиму дозирования.

Применение в детском возрасте

Калумид не назначают детям.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С. Срок годности таблеток 50 мг - 5 лет, таблеток 150 мг - 2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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