

Орета



Полезные ссылки:

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

[Госреестр](#) [Википедия](#)

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой темно-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с тиснением "LET" на одной стороне и "2.5" - на другой.

	1 таб.
летрозол	2.5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 91.5 мг, кроскармеллоза натрия - 2 мг, повидон К30 - 1 мг, кремния диоксид коллоидный - 2 мг, магния стеарат - 1 мг.

Состав оболочки: опадрай желтый (гипромеллоза 2910 (6сР) - 60%, титана диоксид (E171) - 14.11%, макрогол 3350 - 10%, краситель железа оксид желтый (E172) - 10.89%, тальк - 5%) - 2.5 мг.

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Летрозол селективно ингибирует ароматазу (фермент синтеза эстрогенов) путем высокоспецифичного конкурентного связывания с субъединицей этого фермента - гемом цитохрома P450. Блокирует синтез эстрогенов как в периферической, так и в опухолевой тканях.

У женщин в постменопаузальном периоде эстрогены образуются преимущественно, при участии фермента ароматазы, который превращает синтезирующиеся в надпочечниках андрогены (в первую очередь, андростендион и тестостерон) в эстрон и эстрадиол. Ежедневный прием летрозолоа приводит к снижению концентрации эстрадиола, эстрона и эстрона сульфата в плазме крови на 75-95% от исходного содержания. Нарушения синтеза стероидных гормонов в надпочечниках при этом не наблюдается. Супрессия синтеза эстрогенов поддерживается на всем протяжении лечения.

Блокада биосинтеза эстрогенов не приводит к накоплению андрогенов, являющихся предшественниками эстрогенов. У пациенток, получавших летрозол, не было отмечено изменений концентраций лютеинизирующего и фолликулостимулирующего гормонов в плазме крови, а также не было отмечено изменений функции щитовидной железы.

Фармакокинетика

Летрозол быстро и полностью всасывается из ЖКТ, в среднем биодоступность составляет 99.9%. Пища незначительно снижает скорость абсорбции, однако клинического значения это не имеет, поэтому летрозол можно принимать независимо от приема пищи.

Связь летрозолоа с белками плазмы крови составляет, приблизительно, 60% (преимущественно с альбумином - 55%).

Равновесная концентрация достигается в течение 2-6 недель ежедневного приема суточной дозы 2.5 мг. Фармакокинетика нелинейна. Кумуляции при длительном применении не отмечено.

Летрозол в значительной степени подвергается метаболизму под действием изоферментов CYP3A4 и CYP2A6, с образованием фармакологически неактивного карбинолового соединения.

Выводится, преимущественно, почками в виде метаболитов, в меньшей степени - через кишечник. Период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет 48 ч. Выводится из плазмы посредством гемодиализа.

Фармакокинетические параметры летрозола не зависят от возраста пациента. При почечной недостаточности фармакокинетические параметры не изменяются. При умеренно выраженном нарушении функции печени (Child-Pugh B) средние величины AUC (площадь под фармакокинетической кривой «концентрация-время») хотя и выше на 37%, но остаются в пределах того диапазона значений, которые отмечаются у лиц без нарушений функции печени. У больных с циррозом печени и тяжелыми нарушениями ее функции AUC увеличивается на 95% и $T_{1/2}$ на 187%. Однако, учитывая хорошую переносимость высоких доз препарата (5-10 мг/сут) в этих случаях необходимости изменять дозу летрозола нет.

Показания к применению:

- ранние стадии рака молочной железы, клетки которого имеют рецепторы к гормонам, у женщин в постменопаузе, в качестве адьювантной терапии;
- ранние стадии рака молочной железы у женщин в постменопаузе после завершения стандартной адьювантной терапии тамоксифеном в качестве продленной адьювантной терапии;
- распространенные гормонозависимые формы рака молочной железы у женщин в постменопаузе (терапия первой линии);
- распространенные формы рака молочной железы у женщин в постменопаузе (естественной или вызванной искусственно), получавших предшествующую терапию антиэстрогенами.

Относится к болезням:

- [Рак](#)

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к летрозолу или любому другому компоненту препарата;
- эндокринный статус, характерный для пременопаузного периода;
- беременность;
- период кормления грудью;
- возраст до 18 лет.

С осторожностью

При выраженных нарушениях функции печени и почек (КК менее 10 мл/мин) перед назначением летрозола следует тщательно взвесить соотношение между потенциальным риском и ожидаемым эффектом лечения.

Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (лекарственная форма содержит лактозу).

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи.

Рекомендуемая доза летрозола составляет 2.5 мг один раз в сутки, ежедневно, длительно. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием летрозола следует прекратить.

У пациенток **пожилого возраста** коррекция дозы летрозола не требуется.

Пациентки с нарушением функции печени и/или почек.

У пациенток с **нарушениями функции печени или почек (клиренс креатинина >10 мл/мин)** коррекции дозы препарата не требуется. Тем не менее, пациентки с тяжелыми нарушениями функции печени должны находиться под постоянным наблюдением.

Побочное действие:

Частота возникновения побочных эффектов: очень часто - >10%, часто - >1-10%, иногда ->0.1% - <1%, редко - >0.01-0.1%, очень редко - <0.01%, включая отдельные сообщения.

Со стороны системы пищеварения: часто - тошнота, рвота, диспепсия, запор, диарея; иногда - боли в абдоминальной области, стоматит, сухость во рту, повышение активности "печеночных" ферментов; очень редко - гепатит.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: часто - головная боль, слабость, депрессия, раздражительность; иногда - нервозность, гипестезия, тревога, сонливость, бессонница, ухудшение памяти, дизестезия; редко - гиперестезия.

Со стороны системы кроветворения и лимфатической системы: иногда - лейкопения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда - ощущение сердцебиения, тахикардия, тромбоз глубоких и поверхностных вен, повышение артериального давления (АД), стенокардия, инфаркт миокарда, сердечная недостаточность; редко - эмболия легочной артерии, тромбоз артерий, нарушения мозгового кровообращения.

Со стороны дыхательной системы: иногда - одышка, кашель.

Со стороны кожи и кожных придатков: часто - алопеция, повышенная потливость, кожная сыпь (эритематозная, макулопапулезная, везикулезная, псориазоподобная); иногда - кожный зуд, сухость кожи, крапивница; очень редко - ангионевротический отек, анафилактические реакции, синдромы Лайелла, Стивена-Джонсона.

Со стороны скелетно-мышечной системы: очень часто - артралгия; часто - миалгия, оссалгия, остеопороз, переломы костей; иногда - артрит.

Со стороны органов чувств: иногда - катаракта, раздражение глаз, "затуманивание" зрения, нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны мочевыводящей системы: иногда - учащенное мочеиспускание.

Со стороны репродуктивной системы: иногда - боль в молочных железах, вагинальные кровотечения, выделения из влагалища, сухость влагалища.

Прочие: очень часто - приступообразные ощущения жара ("приливы"), часто - повышенная утомляемость, астения, общее недомогание, периферические отеки, увеличение массы тела, гиперхолестеринемия, повышение аппетита; иногда - жажда, снижение массы тела, боли в опухолевых узлах, инфекции мочевыводящих путей; редко - лихорадочное состояние.

Передозировка:

Симптомы: при передозировке препарата Орета возможно развитие симптомов, сходных с побочным действием препарата.

Лечение: специфические методы лечения передозировки неизвестны. Показана симптоматическая и поддерживающая терапия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано при беременности и лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Клинического опыта по применению летрозол в комбинации с другими противоопухолевыми средствами в настоящее время не имеется.

Согласно результатам исследований *in vitro*, летрозол подавляет активность изоферментов цитохрома P450 - CYP2A6 и CYP2C19 (последнего - умеренно). При решении вопроса о значении этих данных для клиники необходимо учитывать, что изофермент CYP2A6 не играет существенной роли в метаболизме лекарственных препаратов. В экспериментах *in vitro* было показано, что летрозол, в концентрациях в 100 раз превышающих равновесные значения

Орета

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

в плазме, не обладает способностью существенно подавлять метаболизм диазепама (субстрата для CYP2C19). Таким образом, клинически значимые взаимодействия с изоферментом CYP2C19 маловероятны. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при совместном применении летрозола и препаратов, метаболизирующихся, преимущественно, при участии вышеназванных изоферментов и имеющих узкий терапевтический индекс.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациентки с тяжелыми нарушениями функции печени должны находиться под постоянным наблюдением.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

Некоторые побочные эффекты препарата, такие как общая слабость и головокружение, могут влиять на способность выполнения потенциально опасных видов деятельности, требующих концентрации внимания и быстрых реакций. В этой связи следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами.

При нарушениях функции почек

Применение препарата с осторожностью при выраженных нарушениях функции почек (КК менее 10 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Применение препарата с осторожностью при выраженных нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

У пациенток **пожилого возраста** коррекция дозы летрозола не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказано детям до 18 лет.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Oreta>