СиинУ



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ломустин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, размер №3, непрозрачные, белого цвета, с надписями черным цветом вдоль капсулы "BRISTOL" над "3030" - на крышечке, "10 mg" - на корпусе; содержимое капсул - порошок белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

	1 капс.
ломустин	10 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, маннитол.

Состав оболочки капсулы: желатин, титана диоксид (E171), вода.

20 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Капсулы твердые желатиновые, размер №2, непрозрачные, с крышечкой белого цвета и корпусом темно-зеленого цвета, с надписями черным цветом вдоль капсулы "BRISTOL" над "3031" - на крышечке, "40 mg" - на корпусе; содержимое капсул - порошок белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

	1 капс.
ломустин	40 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, маннитол.

Состав оболочки капсулы: желатин, железа оксид желтый (E172), титана диоксид (E171), FD&C голубой №2 (E132), вода.

20 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Капсулы твердые желатиновые, размер №1, непрозрачные, темно-зеленого цвета, с надписями черным цветом вдоль капсулы "BRISTOL" над "3032" - на крышечке, "100 mg" - на корпусе; содержимое капсул - порошок белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

	1 капс.
ломустин	100 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, маннитол.

Состав оболочки капсулы: желатин, железа оксид желтый (E172), титана диоксид (E171), FD&C голубой №2 (E132), вода.

20 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоопухолевый препарат алкилирующего действия из группы нитрозомочевины. Механизм действия заключается в алкилировании ДНК и РНК. Ингибирование синтеза ДНК обусловлено карбамоилированием ДНК-полимеразы и других ферментов репарации ДНК и повреждением ДНК-матрицы. Препарат может также тормозить ключевые ферментативные процессы путем изменения структуры и функции многих белков и ферментов. Ломустин действует в поздней фазе G1 и ранней S-фазе клеточного цикла. Наиболее высокая чувствительность к ломустину у клеток в стационарной фазе роста (фактор, определяющий активность при солидных опухолях с низким пролиферативным пулом).

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро и практически полностью всасывается из ЖКТ. C_{max} препарата в плазме крови достигается через 1-4 часа.

Связь с белками плазмы - 50%. Проникает через гематоэнцефалический барьер и в грудное молоко. В спинномозговой жидкости определяется более 50% от концентрации в плазме крови.

Метаболизируется в печени с образованием активных метаболитов (оксиметилдиазония и изоцианата). Оксиметилдиазоний ионизируется и превращается в ион метилдиазония, который трансформируется в более устойчивую таутомерную форму (диазометан), либо распадается на метилкарбониевый ион и азот.

$T_{1/2}$ активных метаболитов колеблется в пределах от 16 до 48 ч. Выводится преимущественно почками в виде метаболитов, менее 5% - через кишечник.

Показания к применению:

В монотерапии и в комбинированной терапии следующих заболеваний:

— первичные и метастатические опухоли мозга после хирургического лечения и/или радиотерапии;

— лимфогранулематоз (болезнь Ходжкина) в качестве терапии второй линии;

— рак желудка и кишечника, мелкоклеточный рак легкого, рак почки, множественная миелома, злокачественная меланома.

Относится к болезням:

- Лимфогранулематоз
- Лимфогранулематоз
- Лимфома
- Меланома
- Миелома
- Опухоли
- Рак
- Рак легких

Противопоказания:

— беременность;

— период кормления грудью;

— пвышенная чувствительность к ломустину, другим производным нитрозомочевины или составным частям препарата.

С *осторожностью:* миелосупрессия (в т.ч. на фоне сопутствующей лучевой или химиотерапии, интоксикации); ветряная оспа (в т.ч. недавно перенесенная или после контакта с заболевшими), опоясывающий герпес и другие острые инфекционные заболевания вирусной, грибковой или бактериальной природы; кахексия, интоксикации, почечная и/или печеночная недостаточность, дыхательная недостаточность, лечение цитостатиками и лучевая терапия в анамнезе.

Способ применения и дозы:

СиинУ следует принимать внутрь вечером, перед сном или через 3 часа после приема пищи. Рекомендуемая доза СиинУ у **взрослых и детей** составляет 130 мг/м при однократном приеме внутрь каждые 6 недель.

У больных с пониженной функцией костного мозга дозу можно снизить до 100 мг/м^2 при сохранении шестинедельного интервала между приемами.

В случае комбинированной терапии препарат применяется в дозе 70-100 мг/м^2.

Повторные курсы не следует назначать при количестве тромбоцитов менее 100000/мкл и лейкоцитов менее 4000/мкл.

Суммарная доза за все курсы лечения не должна превышать 1000 мг/м .

Дальнейшие дозы препарата должны подбираться в зависимости от гематологического ответа больного на предыдущую дозу. При подборе доз можно ориентироваться на следующую схему:

Минимальные показатели после приема предыдущей дозы		**Рекомендуемая следующая доза**
Лейкоциты/мкл	Тромбоциты/мкл	(% от предыдущей дозы)
3000-4000	75 000-100000	100%
2000-2999	25 000-74 999	70%
< 2000	< 25 000	50%

Побочное действие:

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопеиия развивается спустя 4 недели, лейкопения спустя 5-6 недель после применения препарата и может продолжаться 1-2 недели. Обычно тромбоцитопения имеет более тяжелый характер, чем лейкопения. Реже наблюдается анемия и гранулоцитопения.

СиинУ может вызывать кумулятивную миелосупрессию, причем после приема повторных доз может отмечаться более выраженное подавление костного мозга, или же продолжительность миелосупрессии может быть большей.

Со стороны органов пищеварения: тошнота и рвота (через 3-6 часов после приема СиинУ, обычно продолжаются до 24 ч), анорексия. Частота и продолжительность этих побочных эффектов могут быть снижены за счет профилактического применения противорвотных препаратов, а также путем назначения СиинУ больным натощак. Редко - диарея, стоматит, повышение активности печеночных ферментов и концентрации билирубина.

Со стороны органов дыхания: редко - кашель, дыхательная недостаточность, сопутствующие появлению инфильтратов и/или фиброза легких (отмечалось через 6 месяцев или через более длительные сроки после начала лечения при суммарных дозах препарата более 1100 мг/м^2. Сообщалось об одном случае легочной токсичности при кумулятивной дозе 600 мг/м^2).

Со стороны нервной системы: дезориентация, летаргия, атаксия, расстройство артикуляции речи, повышенная утомляемость.

Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи, отеки стоп или нижних конечностей, азотемия, уменьшение размеров почек (обычно при высоких кумулятивных дозах препарата в условиях продолжительного лечения СиинУ и другими препаратами нитрозомочевины).

Со стороны репродуктивной системы: азооспермия (в некоторых случаях необратимая), аменорея.

Прочие: редко - алопеция, необратимое поражение зрительных нервов, приводящее к слепоте (при сочетании с лучевой терапией головного мозга). Сообщалось об острых лейкемиях и дисплазиях костного мозга в результате лечения препаратами нитрозомочевины.

Передозировка:

При передозировке следует ожидать усиления выраженности побочных эффектов - угнетения костномозгового кроветворения, нарушений со стороны ЖКТ, ухудшения функции печени и неврологических расстройств.

Антидот не известен. Лечение симптоматическое.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Лекарственные средства, вызывающие миелосупрессию, а также другие цитостатики и радиотерапия могут усиливать лейкопению и тромбоцитопению, вызванные ломустином. Сочетанное применение ломустина с амфотерицином В повышает риск нефротоксического действия, снижения артериального давления крови и бронхоспазма.

Описан случай существенного усиления лейкопении и нейтропении при совместном применении ломустина и цимстидина.

Усиление токсичности может наблюдаться при одновременном приеме ломустина и теофиллина.

Фенобарбитал, активирующий микросомальные ферменты, может усиливать метаболизм ломустина.

У пациентов, получающих ломустин может наступить ослабление защитных механизмов организма, что может вызывать снижение образования антител при введении противовирусных вакцин. Такое состояние продолжается от 3 месяцев до 1 года после проведения последнего курса химиотерапии. Особую осторожность следует соблюдать в случае применения вакцин, содержащих живые вирусы.

Особые указания и меры предосторожности:

СииНУ должен применяться пол наблюдением врачей, имеющих опыт работы с противоопухолевыми препаратами.

Необходим систематический (не реже 1 раза в неделю) контроль картины периферической крови во время терапии и в течение 6 недель после окончания лечения, а также периодический контроль лабораторных показателей функции печени и почек. На фоне тромбоцитопении и лейкопении у ослабленных больных могут возникать кровотечения и тяжелые инфекции.

До начала терапии и в процессе лечения следует оценивать функцию легких. Пациенты с изначально сниженной жизненной емкостью легких более подвержены легочной токсичности СииНУ.

Не рекомендуется применение препарата чаще чем 1 раз в 6 недель.

Мужчинам и женщинам детородного возраста следует во время лечения и, как минимум, в течение 6 месяцев, после применять надежные методы контрацепции.

Не вскрывать капсулы (порошок обладает раздражающим действием), избегать попадания порошка на кожу и слизистые оболочки.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью:* почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью:* печеночная недостаточность.

Условия хранения:

Список Б. Хранить плотно закрытым при температуре не выше 25°С, в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/SiiNU