Темозоломид



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Темозоломид

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоопухолевое средство алкилирующего действия, имеет имидазотетразиновую структуру.

В системном кровотоке при физиологических значениях pH подвергается быстрому химическому превращению с образованием активного соединения - монометилтриазеноимидазолкарбоксамида (МТИК). Считается, что цитотоксичность МТИК обусловлена, в первую очередь, алкилированием гуанина в положении O^6 и дополнительным алкилированием в положении N^7. По-видимому, цитотоксические повреждения, возникающие вследствие этого, запускают механизм аберрантного восстановления метилового остатка.

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро всасывается из ЖКТ.

C_{max}темозоломида в плазме достигается в среднем через 0.5-1.5 ч (минимум - через 20 мин) после приема однократной дозы.

При приеме вместе с пищей наблюдалось снижение C_{max} на 33% и уменьшение AUC на 9%.

Темозоломид быстро проникает через ГЭБ и поступает в спинномозговую жидкость.

Связывание с белками плазмы составляет 10-20%.

$T_{1/2}$ из плазмы составляет примерно 1.8 ч. Быстро выводится из организма главным образом почками.

Через 24 ч после приема внутрь около 5-10% дозы определяется в неизмененном виде в моче; остальная часть выводится в виде 4-амино-5-имидазол-карбоксамида гидрохлорида или неидентифицированных полярных метаболитов.

Показания к применению:

Злокачественные глиомы (в т.ч. мультиформная глиобластома, анапластическая астроцитома) при наличии рецидива или прогрессирования заболевания после стандартной терапии; распространенная метастазирующая злокачественная меланома (в качестве терапевтического средства первого ряда).

Относится к болезням:

- Меланома

Противопоказания:

Тяжелая миелодепрессия, беременность, лактация (грудное вскармливание), повышенная чувствительность к темозоломиду или к дакарбазину.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный, в зависимости от возраста и предшествующей химиотерапии.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, запор, анорексия, диарея, боли в животе, диспепсия, нарушение вкуса.

Со стороны ЦНС: утомляемость, головная боль, сонливость, головокружение, парестезии.

Дерматологические реакции: кожные высыпания, алопеция, кожный зуд.

Со стороны дыхательной системы: одышка.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения и нейтропения 3 или 4 степени, панцитопения, лейкопения и анемия.

Прочие: лихорадка, астения, снижение массы тела, недомогание, озноб.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Мужчины и женщины детородного возраста должны пользоваться эффективными противозачаточными средствами во время лечения и в течение как минимум 6 мес после окончания лечения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении темозоломида с вальпроевой кислотой наблюдается слабовыраженное, но статистически значимое снижение клиренса темозоломида.

Про одновременном применении темозоломида с другими препаратами, оказывающими угнетающее влияние на костный мозг, возможно повышение риска развития миелосупрессии.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени или почек, больных пожилого возраста (т.к. у лиц старше 70 лет риск развития нейтропении и тромбоцитопении выше, чем у более молодых).

Клинический опыт применения при мультиформной глиобластоме у детей до 3 лет и при злокачественной меланоме у детей и подростков до 18 лет отсутствует. Клинический опыт применения при глиоме у детей старше 3 лет ограничен.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Темозоломид может вызывать сонливость и чувство усталости и поэтому отрицательно влиять на способность к вождению автотранспорта и управлению сложными механизмами.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применять у больных пожилого возраста (т.к. у лиц старше 70 лет риск развития нейтропении и тромбоцитопении выше, чем у более молодых).

Применение в детском возрасте

Клинический опыт применения при мультиформной глиобластоме у детей до 3 лет и при злокачественной меланоме у детей и подростков до 18 лет отсутствует. Клинический опыт применения при глиоме у детей старше 3 лет ограничен.

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