

## Теронред



### Код АТХ:

- [L02BX03](#)

### Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Абиратерон](#)

### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)  
[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>  
[РЛС](#) [VIDAL](#) [Mail.Ru](#)

### Форма выпуска:

#### Форма выпуска, описание и состав

**Таблетки, покрытые пленочной оболочкой** белого или почти белого цвета, двояковыпуклые, овальной формы, с тиснением компании на одной стороне и "358" на другой стороне; на поперечном срезе ядро белого или почти белого цвета.

	<b>1 таб.</b>
абиратерона ацетат	250 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая (Avicel PH 101), кроскармеллоза натрия, повидон (К-29/32), натрия лаурилсульфат, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

*Состав пленочной оболочки:* опадрай белый ОУ 58900 (в состав которого входят гипромеллоза 5 сР, титана диоксид (Е171), макрогол-400).

120 шт. - банки из полиэтилена высокой плотности (1) - пачки картонные.

### Фармакотерапевтическая группа:

- [Противоопухолевые средства](#)

### Фармакологические свойства:

#### Фармакодинамика

Средство с антиандрогенной активностью стероидной структуры. Абиратерон является ингибитором биосинтеза андрогенов. В частности, абиратерон селективно подавляет активность фермента 17 $\alpha$ -гидроксилазы/С17,20-лиазы (СYP17). Этот фермент экспрессируется и является необходимым для биосинтеза андрогенов в яичках, надпочечниках и клетках опухоли предстательной железы. СYP17 катализирует превращение прегненолона и прогестерона путем 17 $\alpha$ -гидроксилирования и разрыва связи С17,20 в предшественники тестостерона: дегидроэпиандростерон и андростендион, соответственно. Торможение активности СYP17 также сопровождается

усилением синтеза минералокортикоидов в надпочечниках.

Андроген-чувствительный рак предстательной железы реагирует на лечение, снижающее концентрацию андрогенов. Антиандрогенная терапия, например, применение агонистов лю-либерина или проведение орхидэктомии, ослабляют синтез андрогенов в яичках, но не влияют на синтез андрогенов в надпочечниках и в опухоли. Применение абиратерона совместно с агонистами лю-либерина (или орхидэктомией) снижает концентрацию тестостерона в сыворотке крови до уровня ниже порога определения.

Абиратерон вызывает снижение концентрации тестостерона и других андрогенов в сыворотке ниже тех показателей, которые удается получить на фоне применения агонистов лю-либерина или после орхидэктомии. Это происходит из-за селективного ингибирования фермента CYP17, который требуется для биосинтеза андрогенов. Концентрация ПСА является биомаркером у пациентов с раком предстательной железы.

### **Фармакокинетика**

После приема внутрь натощак время достижения  $C_{max}$  активного вещества в плазме крови составляет приблизительно 2 ч. Прием с пищей, по сравнению с приемом натощак, приводит к 10-кратному увеличению AUC и 17-кратному увеличению  $C_{max}$ , в зависимости от жирности принятой пищи. Связывание с белками плазмы меченного  $^{14}C$ -абиратерона составляет 99.8%. Кажущийся  $V_d$  составляет приблизительно 5.630 л, что свидетельствует о том, что абиратерон активно распределяется в периферических тканях.

Абиратерон подвергается метаболизму, включая сульфатирование, гидроксирование и окисление, главным образом, в печени. Большая часть циркулирующего  $^{14}C$ -абиратерона ацетата (приблизительно 92%) находилась в форме метаболита абиратерона. Из 15 поддающихся обнаружению метаболитов, на каждый из двух основных метаболитов - абиратерона сульфат и диоксид абиратерона сульфат - приходилось по 43% общей радиоактивности.

Средний  $T_{1/2}$  абиратерона в плазме составляет около 15 ч. При пероральном приеме меченного  $^{14}C$ -абиратерона ацетата в дозе 1 г приблизительно 88% радиоактивной дозы выводилось через кишечник и приблизительно 5% выводилось почками. В кале определялись, главным образом, неизмененный абиратерона ацетат и абиратерон (приблизительно 55% и 22% введенной дозы соответственно).

## **Показания к применению:**

Для лечения метастатического кастрационно-резистентного рака предстательной железы (в комбинации с преднизолоном).

## **Относится к болезням:**

- [Рак](#)

## **Противопоказания:**

Тяжелое нарушение функции печени; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к абиратерону.

## **Способ применения и дозы:**

Предназначен для приема внутрь.

В составе комбинированной терапии с преднизолоном в низких дозах рекомендуемая суточная доза абиратерона - 1 г 1 раз/сут за 1 ч до еды или через 2 ч после еды.

Если в ходе лечения у пациентов развились признаки гепатотоксичности (повышение активности АЛТ в 5 раз выше ВГН или концентрации билирубина в 3 раза выше ВГН), терапию следует немедленно прекратить до полной нормализации показателей функции печени. Повторную терапию у пациентов с нормализовавшимися показателями функции печени можно начать с уменьшенной дозы 500 мг 1 раз/сут. Если симптомы гепатотоксичности возникают при дозе 500 мг, терапию абиратероном следует прекратить. При развитии тяжелой формы гепатотоксичности (активность АЛТ превышает ВГН в 20 раз) в любом периоде терапии абиратерон следует отменить, повторное применение в таких случаях невозможно.

## **Побочное действие:**

*Со стороны печени:* гепатотоксичность, сопровождавшаяся повышением активности АЛТ, АСТ и общего билирубина (механизм развития гепатотоксичности в настоящее время неизвестен).

*Со стороны мочевыделительной системы:* очень часто - инфекции мочевыводящих путей; часто - гематурия.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* очень часто - артериальная гипертензия; часто - сердечная недостаточность, в т.ч. острая сердечная недостаточность, левожелудочковая недостаточность, уменьшение фракции выброса левого желудочка, стенокардия, аритмия, фибрилляция предсердий, тахикардия.

*Со стороны пищеварительной системы:* часто - диспепсия.

*Со стороны костно-мышечной системы:* часто - переломы (за исключением патологических переломов).

*Со стороны эндокринной системы:* нечасто - недостаточность функции надпочечников.

*Со стороны дыхательной системы:* редко - аллергический альвеолит.

*Со стороны лабораторных показателей:* очень часто - гипокалиемия; часто - гипертриглицеридемия, повышение активности АЛТ.

*Общие нарушения:* очень часто - периферические отеки.

## **Применение при беременности и кормлении грудью:**

Абиратерон не предназначен для применения у женщин.

Для предотвращения случайного воздействия, беременные женщины или женщины детородного возраста не должны работать с абиратероном без перчаток.

Неизвестно, присутствует ли абиратерон или его метаболиты в сперме. В период лечения необходимо использовать презерватив, если планируется половой акт с беременной женщиной. Если половой акт планируется с женщиной детородного возраста, необходимо использовать презерватив наряду с другими эффективными методами контрацепции.

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

Диагнозы

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

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

С осторожностью применять у пациентов с нарушением функции почек тяжелой степени, поскольку клинические данные о применении у данной категории пациентов отсутствуют.

Необходима осторожность при применении у пациентов, состояние которых может ухудшаться при повышении АД или развитии гипокалиемии, например, при сердечной недостаточности, недавно перенесенном инфаркте миокарда или желудочковой аритмии; при фракции выброса левого желудочка менее 50%, сердечной недостаточности III-IV функционального класса по классификации NYHA. Безопасность препарата у пациентов с фракцией выброса левого желудочка < 50% или с сердечной недостаточностью III-IV функционального класса по классификации NYHA не установлена. Перед началом применения абиратерона следует устранить гипокалиемию и артериальную гипертензию.

У пациентов, получающих абиратерон, может наблюдаться повышение АД, гипокалиемия и задержка жидкости вследствие повышения концентрации, минералокортикоидов в крови из-за ингибирования CYP17. Введение ГКС одновременно с абиратероном ослабляет стимулирующее действие АКТГ, что приводит к снижению частоты и тяжести этих неблагоприятных реакций.

АД, концентрацию калия в плазме крови и степень задержки жидкости следует контролировать, как минимум, 1 раз в месяц.

Активность сывороточных трансаминаз и уровень билирубина в крови следует измерять до начала лечения, каждые 2 недели в первые 3 месяца лечения, а затем ежемесячно. При развитии клинических симптомов и признаков,

## **Теронред**

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

---

позволяющих предположить нарушение функции печени, следует немедленно определить активность сывороточных трансаминаз, в частности, АЛТ. При повышении, активности АЛТ в 5 раз выше ВГН или концентрации билирубина в 3 раза выше ВГН, применение абиратерона следует немедленно прекратить; необходим тщательный контроль функции печени.

При отмене преднизолона необходима осторожность и контроль симптомов недостаточности функции коры надпочечников.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Teronred>