Теронред



Код АТХ:

- L02BX03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Абиратерон

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
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.

	1 таб.
абиратерона ацетат	250 мг

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

Состав пленочной оболочки: опадрай белый OY 58900 (в состав которого входят гипромеллоза 5 cP, титана диоксид (E171), 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 17α-гидроксилазы/C17,20-лиазы (CYP17). Этот фермент экспрессируется и является необходимым для биосинтеза андрогенов в яичках, надпочечниках и клетках опухоли предстательной железы. CYP17 катализирует превращение прегненолона и прогестерона путем 17α-гидроксилирования и разрыва связи C17,20 в предшественники тестостерона: дегидроэпиандростерон и андростендион, соответственно. Торможение активности CYP17 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, гидроксилирование 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,

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