Винкатера

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Концентрат для приготовления раствора для инфузий	**1 мл**
винорелбин (в форме тартрата)	10 мг

1 мл - флаконы (1) - пачки картонные.

Концентрат для приготовления раствора для инфузий	**1 мл**	**1 фл.**
винорелбин (в форме тартрата)	10 мг	50 мг

5 мл - флаконы (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Винорелбин (алкалоид барвинка розового, получаемый полусинтетическим путем) - противоопухолевое средство из группы винкаалкалоидов. Нарушает полимеризацию тубулина в фазах G2 и M клеточного цикла. Блокирует митоз, вызывает разрушение клеток в интерфазе или при последующем митозе. Действует преимущественно на митотические микротрубочки; при применении высоких доз оказывает влияние и на аксональные микротрубочки. Эффект спирализании тубулина, вызываемый винорелбином, выражен слабее, чем у винкристина.

Фармакокинетика

После внутривенного введения препарата прослеживается трехфазная кинетика. Средний $T_{1/2}$ в конечной фазе составляет 40 (27.7-43.6) ч. Связь с белками плазмы составляет 79.6-91.2%. Интенсивно связывается с тромбоцитами, лимфоцитами, альфа1-кислым гликопротеином, альбумином и липопротеинами. Хорошо проникает в ткани и задерживается в них длительное время. Большие количества определяются в селезенке, печени, почках, легких и вилочковой железе, умеренные - в сердце и мышцах, минимальные - в жировой ткани, головном и костном мозге. Концентрация в легких в 300 раз превышает концентрацию в плазме.

Метаболизируется в печени, главным образом, под действием изоформы фермента CYP 3A4, относящегося к системе цитохромов P450. Образует ряд метаболитов; один из метаболитов - диацетилвинорелбин сохраняет противоопухолевую активность. Выводится преимущественно с желчью.

Фармакокинетика винорелбина, вводимого в дозе 20 мг/м^2 еженедельно, у пациентов с умеренной или выраженной печеночной недостаточностью, не меняется. Фармакокинетика винорелбина не зависит от возраста пациентов.

Показания к применению:

— распространенный неоперабельный немелкоклеточный рак легкого;

— распространенный рак молочной железы, рефрактерный или прогрессирующий после химиотерапии, включающей антрациклины;

— рак предстательной железы, резистентный к гормонотерапии (в комбинации с малыми дозами пероральных глюкокортикостероидов).

Относится к болезням:

- Рак
- Рак легких

Противопоказания:

— выраженные нарушения функции печени, не связанные с опухолевым процессом;

— исходное содержание нейтрофилов <1500 клеток/мкл крови и тромбоцитов <75 000 клеток/мкл крови;

— тяжелые инфекционные заболевания во время начала терапии или перенесенные в течение последних 2-х недель;

— беременность и период лактации;

— детский возраст (отсутствие данных по безопасности и эффективности);

— повышенная чувствительность к винкаалкалоидам или другим составным частям препарата.

С осторожностью: при дыхательной недостаточности, угнетении костномозгового кроветворения (в т.ч. после предыдущей химиотерапии или лучевого лечения), запорах или явлениях кишечной непроходимости в анамнезе, нейропатии в анамнезе, одновременный прием ингибиторов изофермента CYP3A4.

Способ применения и дозы:

Винкатера вводится строго внутривенно в виде 6-10 внутривенной болюсной инъекции или 20-30 минутной инфузии.

Винкатера применяется как в виде монотерапии, так и в комбинации с другими противоопухолевыми препаратами. При выборе дозы и режима введения в каждом индивидуальном случае следует обращаться к специальной литературе.

В режиме монотерапии обычная доза препарата составляет 25-30 мг/м^2 поверхности тела один раз в неделю. Препарат разводят в 0.9 % растворе натрия хлорида или 5% растворе декстрозы до концентрации 1.5-3.0 мг/мл. После введения препарата вену следует промыть, введя дополнительно не менее 250 мл 0.9% раствора натрия хлорида.

Для пациентов с площадью поверхности тела ≥2 м^2 разовая доза Винкатеры не должна превышать 60 мг.

Коррекция режима дозирования Винкатеры в зависимости от гематологических показателей:

Число нейтрофилов в день введения препарата(клетки/мкл)	Процент от стартовой дозы препарата Винкатера
≥/=1500	100%
1499-1000	50%
<1000	Препарат не вводится. Повторяют определение количества нейтрофилов через 1 неделю. Если из-за гранулоцитопении пришлось воздержаться от 3-х еженедельных введений препарата, применение винорелбина рекомендуется прекратить

У пациентов с гипертермией и/или сепсисом на фоне нейтропении в период лечения или при пропуске 2 еженедельных введений препарата подряд из-за низкого числа нейтрофилов дозы при последующих введениях должны составлять в процентном соотношении к предыдущим дозам:

>/=1500	75%
1499-1000	37.5%
<1000	препарат не вводится

Коррекция режима дозирования препарата Винкатера при **печеночной недостаточности:** больным с печеночной недостаточностью Винкатера должна назначаться с осторожностью, при появлении гипербилирубинемии на фоне лечения Винкатерой последующие дозы должны быть уменьшены согласно следующим рекомендациям:

Концентрация общего билирубина (мкмоль/л)	Процент от стартовой дозы винорелбина
<34.2	100%
35.9-51.3	50%
>51.3	25%

Дети: безопасность и эффективность Винкатеры у детей не изучена.

Пожилые люди: какие-либо специальные инструкции по применению Винкатеры у пожилых людей отсутствуют.

Побочное действие:

Со стороны системы кроветворения: нейтропения, анемия; редко - тромбоцитопения. Наименьшее число гранулоцитов наблюдается на 7-10 день от начала терапии, восстановление происходит в последующие 7-14 дней. Кумулирования гематотоксичности не отмечено.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: снижение или выпадение глубоких сухожильных рефлексов, парестезии, гиперестезии, слабость в ногах, боль в области челюстей, головная боль, парез кишечника, редко - паралитическая непроходимость кишечника.

Со стороны системы пищеварения: тошнота, рвота, анорексия, запор, диарея, дисфагия, мукозиты, панкреатит, повышение концентрации билирубина и повышение активности печеночных трансаминаз.

Со стороны органов дыхания: затруднение дыхания, одышка, бронхоспазм, интерстициальная пневмония, острый респираторный дистресс-синдром.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: боль в грудной клетке, повышение или снижение артериального давления, тахикардия, "'приливы" жара к лицу; редко - инфаркт миокарда, отек легких.

Местные реакции: боль или покраснение в месте инъекции; при экстравазации - воспаление подкожной клетчатки, флебит и, возможно, некроз окружающих тканей.

Прочие: аллергические реакции; слабость, миалгия, артралгия, кожные высыпания, повышение концентрации креатинина, гипонатриемия, геморрагический цистит и синдром неадекватной секреции антидиуретического гормона.

Передозировка:

Основные ожидаемые проявления передозировки включают в себя подавление функции костного мозга и проявления нейротоксичности. Специфический антидот не известен. В случае передозировки больного следует госпитализировать и тщательно контролировать функции жизненно важных органов. Лечение симптоматическое.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При совместном применении с другими цитостатиками возможно взаимное усугубление побочных эффектов, в первую очередь - миелосуппрессии.

При совместном применении с митомицином С возможно развитие острой дыхательной недостаточности.

При применении совместно с паклитакселом повышается риск нейротоксичности. Применение на фоне лучевой терапии приводит к радиосенсибилизации. Применение винорелбина после лучевой терапии может привести к повторному появлению лучевых реакций.

Одновременное применение препарата с индукторами и ингибиторами цитохрома P450 может привести к изменению фармакокинетики винорелбина.

Особые указания и меры предосторожности:

Лечение препаратом Винкатера следуег проводить под наблюдением врача, имеющего опыт работы с противоопухолевыми препаратами.

Лечение проводят под строгим гематологическим контролем, определяя число лейкоцитов, нейтрофилов, тромбоцитов и уровень гемоглобина перед каждой инъекцией.

При нарушении функции печени дозы Винкатеры следует снизить.

При нарушении функции почек необходимо усиленное наблюдение за больным.

При появлении признаков нейротоксичности 2-ой и более степени лечение препаратом следует отменить.

При появлении одышки, кашля или гипоксии невыясненной этиологии следует обследовать больного для исключения легочной токсичности.

При экстравазации инфузию препарата следует немедленно прекратить, оставшуюся дозу вводят в другую вену.

Во время и в течение, по крайней мере, трех месяцев после прекращения терапии, необходимо использовать надежные методы контрацепции.

При попадании Винкатеры в глаза их следует обильно и тщательно промыть водой.

При нарушениях функции почек

При нарушении функции почек необходимо усиленное наблюдение за больным.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при выраженных нарушениях функции печени, не связанных с опухолевым процессом.

Больным с печеночной недостаточностью Винкатера должна назначаться с осторожностью, при появлении гипербилирубинемии на фоне лечения Винкатерой последующие дозы должны быть уменьшены.

Применение в пожилом возрасте

Какие-либо специальные инструкции по применению Винкатеры у пожилых людей отсутствуют

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям. Безопасность и эффективность Винкатеры у детей не изучена.

Условия хранения:

Список Б. При температуре от 2 до 4°С в защищенном от света месте. Хранить в недоступном для детей месте. После дополнительного разведения препарата срок хранения составляет 24 ч (при комнатной температуре).

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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