

[Зитига](#)



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки от белого до почти белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с гравировкой "AA250".

	1 таб.
абиратерона ацетат	250 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 198.65 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 141.22 мг, кроскармеллоза натрия - 42.9 мг, повидон (К29/К32) - 35.75 мг, натрия лаурилсульфат - 28.6 мг, кремния диоксид коллоидный - 7.15 мг, магния стеарат - 10.73 мг.

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Препарат Зитига снижает концентрацию 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 служит биомаркером у пациентов с раком предстательной железы.

Анальгетический эффект

Доля пациентов, у которых отмечался паллиативный анальгетический эффект, была достоверно выше при использовании препарата Зитига, по сравнению с группой плацебо. Кроме того, по сравнению с пациентами, получавшими плацебо, у меньшей доли пациентов, получавших препарат Зитига, отмечалось прогрессирование болевого синдрома.

Риск развития костных осложнений

По сравнению с группой плацебо у меньшей доли пациентов, получавших препарат Зитига, отмечались случаи поражения костной ткани, к которым были отнесены патологический перелом, спинальная компрессия, паллиативное облучение кости, хирургическое лечение кости.

Фармакокинетика

Фармакокинетика абиратерона ацетата и абиратерона была изучена у здоровых добровольцев, у больных с поздними стадиями метастатического рака предстательной железы и у неонкологических пациентов, с почечной или печеночной недостаточностью. Абиратерона ацетат *in vivo* быстро превращается в абиратерон, который является ингибитором биосинтеза андрогенов.

Абсорбция

При пероральном применении препарата Зитига натощак время достижения C_{max} в плазме крови составляет приблизительно 2 ч. Прием препарата Зитига с пищей, по сравнению с приемом препарата натощак, приводит к 10-кратному увеличению AUC и 17-кратному увеличению C_{max} абиратерона, в зависимости от жирности принятой пищи. Принимая во внимание нормальное разнообразие содержания и состава пищи, прием препарата Зитига с пищей обладает способностью оказывать разнообразное системное воздействие. Поэтому, препарат Зитига нельзя принимать с пищей.

Распределение

Связывание с белками плазмы меченого ^{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.

Метаболизм

При пероральном применении ^{14}C -абиратерона ацетата в капсулах, абиратерона ацетат гидролизуется до абиратерона, который в свою очередь подвергается метаболизму, включая сульфатирование, гидроксигирование 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 N-оксид абиратерона сульфат - приходилось по 43% общей радиоактивности.

Выведение

По данным исследований, проведенных с участием здоровых добровольцев, средний $T_{1/2}$ абиратерона в плазме составляет приблизительно 15 ч. При пероральном приеме меченого ^{14}C -абиратерона ацетата в дозе 1 г приблизительно 88% радиоактивной дозы выводилось через кишечник и приблизительно 5% выводилось почками. Основными веществами, найденными в фекалиях, являлись неизмененный абиратерона ацетат и абиратерон (приблизительно 55% и 22% введенной дозы соответственно).

Особые группы пациентов

Фармакокинетика абиратерона ацетата изучалась у пациентов с легкой и умеренной степенью печеночной недостаточности (класс А и В по классификации Чайлд-Пью соответственно) и у здоровых добровольцев. Системное воздействие абиратерона ацетата после однократного применения внутрь в дозе 1 г увеличивалось приблизительно на 11% у пациентов с легкой степенью печеночной недостаточности и на 260% у пациентов с умеренной степенью печеночной недостаточности. Средний $T_{1/2}$ абиратерона увеличивается приблизительно до 18 ч у пациентов с легкой степенью печеночной недостаточности и приблизительно до 19 ч у пациентов с умеренной степенью печеночной недостаточности. Для пациентов, имеющих легкую степень печеночной недостаточности, коррекции дозы препарата не требуется. Препарат Зитига не рекомендуется назначать пациентам с умеренной или тяжелой степенью печеночной недостаточности (класс В или С по Чайлд-Пью), поскольку в этом случае невозможно предсказать необходимую коррекцию дозы. Поэтому препарат Зитига следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени умеренной степени, только если польза от лечения явно перевешивает возможный риск. Препарат Зитига нельзя назначать пациентам с тяжелой недостаточностью функции печени. Пациентам, у которых в процессе терапии препаратом развилась гепатотоксичность, может потребоваться временная отмена препарата и коррекция дозы.

Фармакокинетику абиратерона ацетата сравнивали у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, получающих стандартную схему гемодиализа, и у пациентов с нормальной функцией почек. Системное воздействие абиратерона ацетата после приема внутрь в дозе 1 г у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, получающих гемодиализ, не увеличивалось. Следует с осторожностью назначать препарат Зитига пациентам, больным раком предстательной железы с нарушением функции почек тяжелой степени, поскольку клинические данные о применении препарата Зитига у таких пациентов отсутствуют.

Установлено, что препарат Зитига не оказывает значимого влияния на интервал Q-T/QTc.

Показания к применению:

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

Относится к болезням:

- [Рак](#)

Противопоказания:

— гиперчувствительность к активному компоненту или любому вспомогательному веществу препарата;

- детский возраст до 18 лет;
- тяжелое нарушение функции печени.

С осторожностью:

- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- пациенты с нарушением функции почек тяжелой степени, поскольку клинические данные о применении препарата Зитига у таких пациентов отсутствуют;
- следует проявлять осторожность при лечении больных, состояние которых может ухудшаться при повышении АД или развитии гипокалиемии, например, больных с сердечной недостаточностью, с недавно перенесенным инфарктом миокарда или желудочковой аритмией; фракцией выброса левого желудочка менее 50%, сердечной недостаточностью III-IV функционального класса по классификации NYHA.

Способ применения и дозы:

Рекомендуемая суточная доза препарата Зитига составляет 1 г (4 таб. по 250 мг) 1 раз/сут за 1 ч до еды или через 2 ч после еды.

Таблетки следует проглатывать целиком, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды.

Препарат Зитига применяется вместе с низкими дозами преднизолона. Рекомендуемая доза преднизолона составляет 10 мг/сут.

Препарат Зитига нельзя принимать с пищей. В течение 1 часа после приема препарата не рекомендуется прием пищи.

До начала лечения препаратом Зитига, каждые 2 недели в течение первых трех месяцев лечения, а затем ежемесячно следует измерять активность сывороточных трансаминаз и концентрацию билирубина. АД, концентрацию калия в крови и степень задержки жидкости в организме следует оценивать ежемесячно. При пропуске очередной суточной дозы препарата Зитига, преднизона или преднизолона на следующий день следует принять обычную дозу пропущенного препарата.

Коррекция дозы у пациентов с нарушением функции печени

Коррекция дозы у пациентов с нарушением функции печени легкой степени не требуется.

Нет данных об эффективности и безопасности абиратерона ацетата при неоднократном применении у пациентов с нарушением функции печени умеренной или тяжелой степени (класс В или С по Чайлд-Пью), поэтому невозможно предсказать необходимую коррекцию дозы. Препарат Зитига следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени умеренной степени и только в том случае, если польза от лечения явно перевешивает возможный риск. Препарат Зитига нельзя назначать пациентам с нарушением функции печени тяжелой степени.

Если в ходе лечения препаратом у пациентов развились признаки гепатотоксичности (повышение активности АЛТ или АСТ 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 (2 таб.) 1 раз/сут. В этом случае контроль активности сывороточных трансаминаз и концентрации билирубина должен осуществляться, как минимум, каждые 2 недели в течение 3 месяцев, а затем ежемесячно. Если признаки гепатотоксичности возникают при приеме в дозе 500 мг, терапию препаратом Зитига следует прекратить.

Если у пациентов в любой период терапии развивается тяжелая форма гепатотоксичности (активность АЛТ или АСТ превышает ВГН в 20 раз), препарат Зитига следует отменить, повторное назначение препарата у таких пациентов невозможно.

Особые группы пациентов**Применение у пациентов с печеночной недостаточностью**

Для больных, имеющих до начала лечения нарушение функций печени легкой степени (класс А по классификации Чайлд-Пью) коррекции дозы препарата не требуется. Препарат Зитига следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени умеренной степени, и только в том случае, если польза от лечения явно перевешивает возможный риск. Препарат Зитига нельзя назначать пациентам с нарушением функции печени тяжелой степени, класс В и С по классификации Чайлд-Пью.

Применение у пациентов с почечной недостаточностью

Для больных с нарушением функции почек коррекции дозы не требуется.

Тем не менее, следует с осторожностью назначать препарат Зитига пациентам, больным раком предстательной железы с нарушением функции почек тяжелой степени, поскольку клинические данные о применении препарата Зитига у таких пациентов отсутствуют.

Дети

Для детей применение препарата Зитига неактуально, поскольку у данной возрастной категории не бывает рака предстательной железы.

Побочное действие:

Наиболее частыми нежелательными явлениями при лечении препаратом Зитига являются: периферические отеки, гипокалиемия, повышение АД, инфекции мочевыводящих путей, гематурия, увеличение активности АЛТ или АСТ, диспепсия, переломы.

Нежелательные реакции систематизированы относительно каждой из систем органов с использованием следующей классификации частоты встречаемости: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10\ 000$, включая единичные случаи).

Инфекционные заболевания: очень часто - инфекции мочевыводящих путей.

Со стороны эндокринной системы: нечасто - недостаточность функции надпочечников.

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

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

Со стороны почек и мочевыводящих путей: часто - гематурия.

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

Со стороны дыхательной системы: редко - аллергический альвеолит.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия.

Общие нарушения: очень часто - периферические отеки.

Передозировка:

Данные о передозировке препаратом Зитига ограничены.

Специфического антидота нет. В случае передозировки прием препарата Зитига следует прекратить, и следует проводить общие поддерживающие мероприятия, включая контроль ритмии. Также следует контролировать функцию печени.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат Зитига не предназначен для применения у женщин. Данных о применении препарата Зитига у беременных женщин нет. Предполагается, что прием ингибиторов CYP17 беременными женщинами изменит концентрацию гормонов, что может повлиять на развитие плода.

Препарат Зитига противопоказан беременным и способным забеременеть женщинам. Для предотвращения случайного воздействия, беременные или способные забеременеть женщины не должны работать с препаратом без перчаток.

Неизвестно, выделяется ли абиратерона ацетат или его метаболиты с грудным молоком.

Контрацепция у мужчин и женщин

Неизвестно, присутствует ли абиратерон или его метаболиты в сперме. 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.

Способность к зачатию

Исследований токсичности абиратерона ацетата для репродуктивной системы не проводилось, данных о влиянии препарата на способность к зачатию нет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

В исследованиях *in vitro* было показано, что абиратерон ингибирует печеночные изоферменты, участвующие в метаболизме лекарственных препаратов - CYP1A2, CYP2D6 и CYP2C8.

Рекомендуется с осторожностью назначать препарат Зитига пациентам, получающим препараты, которые метаболизируются при участии CYP2D6, особенно это касается препаратов с узким терапевтическим индексом. В таких случаях следует рассмотреть возможность снижения дозы препаратов с узким терапевтическим индексом, метаболизирующихся изоферментом CYP2D6, в т.ч. таких препаратов как метопролол, пропранолол, дезипрамин, венлафаксин, галоперидол, рисперидон, пропafenон, флекаинид, кодеин, оксикодон и трамадол.

Отсутствуют клинические данные по применению препарата Зитига с препаратами, являющимися субстратами изофермента CYP2C8 (например, с паклитакселом и репаглинидом).

На основании данных *in vitro* установлено, что абиратерон является субстратом изофермента CYP3A4. Следует проявлять осторожность при одновременном приеме с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 (кетоназол, итраконазол, кларитромицин, атазанавир, нефазодон, саквинавир, телитромицин, ритонавир, индинавир, нелфинавир, вориконазол) и индукторов (фенитоин, карбамазепин, рифампицин, рифабутин, рифапентин, фенобарбитал).

При исследовании фармакокинетического взаимодействия сильного индуктора изофермента CYP3A4 на здоровых добровольцах - рифампицин, 600 мг в день в течение 6 дней и затем разовой дозы абиратерона ацетата 1000 мг, средняя плазменная AUC_∞ абиратерона снижалась на 55%.

Следует избегать совместного применения препарата Зитига® и сильных индукторов изофермента CYP3A4 (например, фенитоин, карбамазепин, рифампицин, рифабутин, рифапентин, фенобарбитал). Назначение данной группы препаратов возможно только после тщательной оценки клинической эффективности.

В клинических фармакокинетических исследованиях на здоровых добровольцах одновременный прием кетоназола, сильного ингибитора CYP3A4, не оказывал клинически значимого эффекта на фармакокинетику абиратерона.

Особые указания и меры предосторожности:

Прием препарата Зитига одновременно с пищей значительно увеличивает всасывание абиратерона ацетата. Эффективность и безопасность препарата Зитига, принятого с пищей, не установлена. Препарат Зитига нельзя принимать с пищей.

Повышение АД, гипокалиемия и задержка жидкости вследствие избытка минералокортикоидов

Препарат Зитига может вызвать повышение АД, гипокалиемию и задержку жидкости из-за повышения концентрации минералокортикоидов вследствие ингибирования фермента CYP17. Прием кортикостероидов ослабляет стимулирующее действие АКГГ, что приводит к снижению частоты и тяжести этих побочных реакций. Следует проявлять осторожность при лечении пациентов, клиническое состояние которых может ухудшиться при повышении АД, развитии гипокалиемии или задержке жидкости в организме (например, у пациентов с сердечной недостаточностью, недавно перенесенным инфарктом миокарда или с желудочковой аритмией).

Препарат Зитига следует с осторожностью назначать пациентам с сердечно-сосудистыми заболеваниями в анамнезе. 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 препарата Зитига следует скорректировать гипокалиемию и повышение АД. Артериальное давление, концентрацию калия в плазме крови и степень задержки жидкости следует контролировать, как минимум, 1 раз в месяц.

Гепатотоксичность и нарушение функции печени

В клинических исследованиях зарегистрировано выраженное повышение активности печеночных ферментов, требовавшее отмены или коррекции дозы препарата. Активность, сывороточных трансаминаз и билирубина следует измерять до начала применения препарата Зитига, каждые 2 недели в первые 3 месяца лечения, а затем ежемесячно. При развитии клинических симптомов и признаков, позволяющих предположить нарушение функции печени, следует немедленно измерить активность сывороточных трансаминаз.

Зитига

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

При повышении активности АЛТ или АСТ в 5 раз выше ВГН или концентрации билирубина в 3 раза выше ВГН, применение препарата Зитига следует немедленно прекратить, и следует тщательно контролировать функцию печени. Препарат Зитига можно применять снова только после возвращения показателей функции печени к исходным значениям, и только при условии назначения в более низких дозах.

Если у пациентов в любой период терапии развивается тяжелая форма гепатотоксичности (активность АЛТ или АСТ превышает ВГН в 20 раз), препарат Зитига следует отменить, повторное назначение препарата у таких пациентов невозможно.

Коррекция дозы у пациентов с нарушением функции печени легкой степени не требуется. Нет данных об эффективности и безопасности неоднократного применения абиратерона ацетата у пациентов с нарушением функции печени умеренной или тяжелой степени (класс В или С по шкале Чайлд-Пью), поэтому необходимость коррекции дозы невозможно предсказать. Препарат Зитига следует применять с осторожностью у пациентов с нарушениями функции печени умеренной степени, только в том случае, если польза от лечения явно превышает возможный риск. Препарат Зитига нельзя назначать пациентам с нарушением функции печени тяжелой степени.

Отмена ГКС и купирование стрессовых ситуаций

При отмене преднизолона следует проявлять осторожность и контролировать признаки недостаточности функции коры надпочечников. Если применение препарата Зитига продолжается после отмены ГКС, то следует контролировать появление симптомов избытка минералокортикоидов. У пациентов, получающих преднизон или преднизолон, при развитии стрессовых ситуаций может потребоваться повышенная доза ГКС перед, во время и после стрессовой ситуации.

Одновременное назначение препарата Зитига и химиотерапии

Безопасность и эффективность одновременного назначения препарата Зитига и цитотоксической химиотерапии не установлены.

Информация о некоторых вспомогательных веществах, входящих в состав препарата Зитига

Данный лекарственный препарат содержит 1 ммоль (27.2 мг) натрия в каждой дозе (четыре таблетки), что необходимо принимать во внимание при лечении пациентов получающих диету с контролируемым содержанием натрия.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Препарат Зитига не влияет или оказывает ничтожно малое влияние на способность управлять автомобилем и движущимися механизмами.

При нарушениях функции почек

Следует с осторожностью назначать препарат Зитига пациентам, больным раком предстательной железы с нарушением функции почек тяжелой степени, поскольку клинические данные о применении препарата Зитига у таких пациентов отсутствуют.

При нарушениях функции печени

Для больных, имеющих до начала лечения нарушение функции печени легкой степени (класс А по классификации Чайлд-Пью) коррекции дозы препарата не требуется. Препарат Зитига нельзя применять у пациентов с умеренной или тяжелой степенью печеночной недостаточности, класс В и С по классификации Чайлд-Пью.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Для детей и подростков применение препарата Зитига неактуально, поскольку у данной возрастной категории не бывает рака предстательной железы.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в оригинальной упаковке в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

2 года.

Зитига

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

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Zitiga>