Золадекс



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы для п/к введения пролонгированного действия в виде белых или кремовых цилиндрических кусочков твердого полимерного материала, свободного или практически свободного от видимых включений.

	1 капс.
гозерелин (в форме ацетата)	3.6 мг

Вспомогательные вещества: молочной и гликолевой кислот сополимер (50:50) - до 18 мг, ледяная уксусная кислота (с низким содержанием уксусного ангидрида) - q.s.

Шприц-аппликатор (1) с защитным механизмом (система безопасного введения Safety Glide) - конверты алюминиевые ламинированные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Синтетический аналог природного ГнРГ (гонадотропин рилизинг-гормона). При постоянном применении Золадекс ингибирует выделение гипофизом лютеинизирующего гормона (ЛГ), что приводит к снижению концентрации тестостерона в сыворотке крови у мужчин и концентрации эстрадиола в сыворотке крови у женщин. Данный эффект обратим после отмены терапии. На первоначальной стадии Золадекс, подобно другим агонистам ГнРГ, может вызывать временное увеличение концентрации тестостерона в сыворотке крови у мужчин и концентрации эстрадиола в сыворотке крови у женщин. На ранних стадиях терапии Золадексом у некоторых женщин могут отмечаться вагинальные кровотечения различной продолжительности и интенсивности.

У мужчин примерно к 21 дню после введения первой капсулы концентрация тестостерона снижается до кастрационных уровней и продолжает оставаться сниженной при постоянном лечении, проводимом каждые 28 дней. Такое снижение концентрации тестостерона у большинства больных приводит к регрессии опухоли предстательной железы и к симптоматическому улучшению.

У женщин концентрация эстрадиола в сыворотке снижается также примерно к 21 дню после введения первой капсулы и, при регулярном введении препарата каждые 28 дней, остается сниженной до уровня сравнимого с тем, который наблюдается у женщин в менопаузе.

Данное снижение приводит к положительному эффекту при гормонально-зависимых формах рака молочной железы, эндометриозе, фибромах матки и подавлении развития фолликулов в яичниках. Это также вызывает истончение эндометрия и является причиной возникновения аменореи у большинства пациенток.

Показано, что Золадекс в комбинации с препаратами железа вызывает аменорею и повышение уровня гемоглобина и соответствующих гематологических параметров у женщин с фибромами матки и сопутствующей анемией.

На фоне приема аналогов ГнРГ у женщин возможно наступление менопаузы.

Редко, у некоторых женщин не происходит восстановления менструаций после окончания терапии.

Фармакокинетика

Введение капсулы каждые 4 недели обеспечивает поддержание эффективных концентраций. Кумуляции в тканях при этом не происходит.

Связывание с белками плазмы низкое. У пациентов с нормальной функцией почек $T_{1/2}$ из сыворотки крови составляет 2-4 ч. У пациентов с нарушениями функции почек $T_{1/2}$ увеличивается. При ежемесячном введении препарата данное изменение не будет иметь значительных последствий, поэтому изменять дозу для этой категории пациентов не требуется.

У больных с печеночной недостаточностью значительных изменений фармакокинетики не наблюдается.

Показания к применению:

— рак предстательной железы;

— рак молочной железы;

— эндометриоз;

— фиброма матки;

— для истончения эндометрия при планируемых операциях на эндометрии;

— при экстракорпоральном оплодотворении.

Относится к болезням:

- Рак
- Рак молочной железы
- Фиброз
- Фиброма
- Эндометрит

Противопоказания:

— беременность;

— лактация;

— детский возраст;

— повышенная чувствительность к гозерелину или другим аналогам ГнРГ.

С *осторожностью* следует применять препарат у лиц мужского пола, подверженных особому риску возникновения непроходимости мочеточников или сдавления спинного мозга, а также при экстракорпоральном оплодотворении у пациенток с синдромом поликистозных яичников.

Способ применения и дозы:

Взрослым капсулу Золадекса 3.6 мг вводят п/к в переднюю брюшную стенку каждые 28 дней.

При *злокачественных новообразованиях* препарат применяют длительно, при *доброкачественных гинекологических заболеваниях* - не более 6 месяцев.

Для *истончения эндометрия* делают 2 инъекции с интервалом в 4 недели, при этом абляцию матки рекомендуется производить в первые 2 недели после введения 2-ой дозы.

Экстракорпоральное оплодотворение

Препарат Золадекс 3.6 мг применяют для десенсибилизации гипофиза. Десенсибилизация определяется по концентрации эстрадиола в сыворотке крови. Как правило, необходимый уровень эстрадиола, который соответствует таковому в раннюю фолликулярную фазу цикла (приблизительно 150 пмоль/л), достигается между 7 и 21 днями. При

наступлении десенсибилизации начинают стимуляцию суперовуляции (контролируемая стимуляция яичников) с помощью гонадотропина. Вызываемая десенсибилизация гипофиза при применении депо агониста ГнРГ может быть более стойкой, что может привести к повышенной потребности в гонадотропине. На соответствующей стадии развития фолликула введение гонадотропина прекращают и далее для индукции овуляции вводят человеческий хорионический гонадотропин. Контроль за проводимым лечением, процедуры извлечения ооцита и оплодотворения проводятся в соответствии с установленной практикой данного лечебного учреждения.

Пациентам пожилого возраста, а также **больным с почечной или печеночной недостаточностью** коррекция дозы не требуется.

Побочное действие:

Частота возникновения нежелательных эффектов представлена следующим образом: часто (> 1/100, < 1/10); нечасто (> 1/1000, < 1/100); редко (> 1/10 000, < 1/1 000); очень редко (< 1/10 000, включая отдельные сообщения).

Новообразования: очень редко - опухоль гипофиза; неуточненной частоты - дегенерация фиброматозных узлов у женщин с фибромой матки.

Со стороны иммунной системы: нечасто - реакции гиперчувствительности; редко - анафилактические реакции.

Со стороны эндокринной системы: очень редко - кровоизлияние в гипофиз.

Метаболические нарушения: часто - нарушение толерантности к глюкозе. У мужчин, получавших агонисты ГнРГ, наблюдалось снижение толерантности к глюкозе. Снижение толерантности к глюкозе проявлялось развитием сахарного диабета или ухудшением контроля над уровнем глюкозы в крови у пациентов с сахарным диабетом в анамнезе; нечасто - гиперкальциемия (у женщин).

Со стороны нервной системы и психической сферы: очень часто - снижение либидо, связанное с фармакологическим действием препарата и, в редких случаях, приводившее к его отмене; часто - снижение настроения, депрессия (у женщин), парестезия, сдавление спинного мозга (у мужчин), головная боль (у женщин); очень редко - психотическое расстройство.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - приливы, связанные с фармакологическим действием препарата и, в редких случаях, приводившие к его отмене; часто - инфаркт миокарда (у мужчин), сердечная недостаточность (у мужчин), риск которой повышается при одновременном назначении антиандрогенных препаратов. Изменение уровня АД, проявляющиеся как гипотензия или гипертензия. Эти изменения обычно транзиторные, и разрешаются либо в процессе терапии препаратом Золадекс, либо после ее прекращения. В редких случаях эти изменения требовали медицинского вмешательства, включая отмену препарата Золадекс.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: очень часто - повышенная потоотделение, связанное с фармакологическим действием препарата и, в редких случаях, приводившее к его отмене; часто - алопеция (у женщин), как правило, незначительно выраженная (в т.ч. у молодых пациенток с доброкачественными новообразованиями), сыпь, в основном, незначительно выраженная, которая часто разрешалась на фоне продолжения терапии; неуточненной частоты - алопеция (у мужчин), которая проявлялась как выпадение волос по всему телу вследствие снижение уровня андрогенов.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - артралгия (у женщин), боль в костях (у мужчин). В начале лечения больные раком предстательной железы часто могут испытывать временное усиление боли в костях, которая лечится симптоматически; нечасто - артралгия (у мужчин).

Со стороны мочеполовой системы: очень часто - эректильная дисфункция (у мужчин), сухость слизистой оболочки влагалища и увеличение размера молочных желез (у женщин); часто - гинекомастия (у мужчин); нечасто - болезненность грудных желез (у мужчин), обструкция мочеточников (у мужчин); редко - киста яичника (у женщин), синдром гиперстимуляции яичников (у женщин, при совместном применении с гонадотропинами); неуточненной частоты - вагинальное кровотечение (у женщин).

Прочие: очень часто - реакция в месте введения препарата (у женщин); часто - реакция в месте введения препарата (у мужчин), временное усиление симптомов заболевания у пациенток с раком молочной железы в начале терапии.

Со стороны лабораторных исследований: часто - снижение минеральной плотности костной ткани, увеличение массы тела.

Передозировка:

Опыт передозировки препарата у людей ограничен. В случае непреднамеренного введения Золадекса прежде срока или в более высокой дозе не отмечалось клинически значимых нежелательных явлений.

Лечение: проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Лекарственное взаимодействие препарата Золадекс не описано.

Особые указания и меры предосторожности:

Следует с осторожностью назначать Золадекс мужчинам, подверженным особому риску развития непроходимости мочеточников или сдавливания спинного мозга. У этой категории пациентов следует проводить тщательный мониторинг в течение первого месяца терапии. В том случае, если наблюдаются или развиваются сдавливание спинного мозга или почечная недостаточность, обусловленная непроходимостью мочеточников, следует назначать стандартное для данных осложнений лечение.

При использовании препарата Золадекс у женщин до восстановления менструаций должны применяться негормональные методы контрацепции.

Как и при использовании других аналогов ГнРГ, при применении препарата Золадекс в комбинации с гонадотропином, сообщалось о редких случаях развития синдрома гиперстимуляции яичников (СГСЯ). Предполагается, что десенсибилизация, вызванная применением препарата Золадекс, может приводить в ряде случаев к увеличению необходимой дозы гонадотропина. Необходимо тщательно мониторировать стимуляцию цикла, чтобы выявить пациенток с риском развития СГСЯ, поскольку выраженность и частота проявлений синдрома может зависеть от дозового режима гонадотропина. Введение хорионического гонадотропина человека необходимо прекратить, если это требуется.

Применение аналогов ГнРГ у женщин может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани. После окончания лечения у большинства женщин происходит восстановление минеральной плотности костной ткани. У пациенток, получавших препарат Золадекс для лечения эндометриоза, добавление гормонозаместительной терапии (эстрогенный и прогестагенный препараты ежедневно) снижало потерю минеральной плотности костей и вазомоторные симптомы.

Возобновление менструаций после окончания лечения препаратом Золадекс у некоторых больных может происходить с задержкой. В редких случаях у некоторых женщин во время лечения аналогами ГнРГ может иметь место наступление менопаузы без восстановления менструаций после окончания терапии.

Применение препарата Золадекс может приводить к увеличению цервикальной резистентности, необходимо соблюдать осторожность при дилатации шейки матки.

Нет данных об эффективности и безопасности терапии препаратом Золадекс доброкачественных гинекологических заболеваний продолжительностью более 6 месяцев.

Препарат Золадекс должен применяться при экстракорпоральном оплодотворении только под наблюдением специалиста, имеющего опыт работы в этой области.

Рекомендуется с осторожностью применять препарат Золадекс при экстракорпоральном оплодотворении у пациенток с синдромом поликистозных яичников, т.к. возможна стимуляция большого количества фолликулов.

По предварительным данным применение бисфосфоната в комбинации с агонистами ГнРГ у мужчин способствует уменьшению потери минеральной плотности костной ткани. В связи с возможностью развития снижения толерантности к глюкозе на фоне приема агонистов ГнРГ у мужчин, рекомендуется периодически контролировать содержание глюкозы в крови.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Нет данных о том, что Золадекс ухудшает способность к вождению автотранспорта и работе с механизмами.

При нарушениях функции почек

Больным с почечной недостаточностью коррекция дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Больным с печеночной недостаточностью коррекция дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре ниже 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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