

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

АНАСТРОЗОЛ

Регистрационный номер: ЛП-002323

Торговое название препарата: Анастрозол

Международное непатентованное название (МНН): анастрозол

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Активное вещество: анастрозол -1,0 мг;

Вспомогательные вещества (ядро): лактозы моногидрат (сахар молочный) - 72,0 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 15,6 мг, повидон (поливинилпирролидон) - 3,0 мг, магния стеарат - 0,9 мг, кремния диоксид коллоидный - 0,5 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 2,0 мг.

Вспомогательные вещества (оболочка): гипромеллоза - 1,65 мг, макрогол-4000 - 0,45 мг, титана диоксид - 0,90 мг.

Описание: таблетки круглые двояковыпуклой формы, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, на изломе видны два слоя - ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Фармакотерапевтическая группа: противоопухолевое средство, эстрогенов синтеза ингибитор.

Код АТХ: L02BG03

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Анастрозол является высокоселективным нестероидным ингибитором ароматазы - фермента, с помощью которого у женщин в постменопаузе андростендион в периферических тканях превращается в эстрон и далее в эстрадиол. Снижение циркулирующих концентраций эстрадиола, как выяснилось, оказывает положительное действие на женщин с раком молочной железы. У женщин в постменопаузе анастрозол в суточной дозе 1 мг вызывает снижение концентрации эстрадиола на 80 %.

Анастрозол не обладает прогестогенной, андрогенной или эстрогенной активностью. Регулярный прием суточных доз анастрозола вплоть до 10 мг не оказывает влияния на секрецию кортизола или альдостерона, следовательно, при его назначении не требуется заместительного введения кортикостероидов.

Фармакокинетика

Всасывание анастрозола быстрое, максимальная концентрация в плазме достигается в течение двух часов после приема внутрь (натощак). Пища незначительно снижает скорость всасывания, но не его степень и не приводит к клинически значимому влиянию на равновесную концентрацию анастрозола в плазме при однократном приеме суточной дозы анастрозола. После семидневного приема препарата достигается приблизительно 90-95% равновесной концентрации анастрозола в плазме крови. Сведений о зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени или дозы нет. Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста женщин в постменопаузе. Связь с белками плазмы крови - 40 %.

Анастрозол выводится медленно, период полувыведения из плазмы составляет 40-50 часов. Экстенсивно метаболизируется у женщин в постменопаузе. Менее 10% принятой дозы выделяется почками в неизменном виде в течение 72 часов после приема препарата. Метаболизм анастрозола происходит через стадии N-деалкилирования, гидроксилирования и глюкуронидации. Триазол, основной метаболит анастрозола в плазме, не ингибирует ароматазу. Метаболиты выделяются главным образом почками.

Клиренс анастрозола после перорального приема при циррозе печени или нарушении функции почек не изменяется.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Адьювантная терапия раннего рака молочной железы, с положительными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе, в том

числе, после адьювантной терапии тамоксифеном в течение 2-3 лет.

- Первая линия терапии местно-распространенного или метастатического рака молочной железы, с положительными или неизвестными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе.

- Вторая линия терапии распространенного рака молочной железы, прогрессирующего после лечения тамоксифеном, у женщин в постменопаузе.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Повышенная чувствительность к анастрозолу или другим компонентам препарата;

- Беременность и период кормления грудью;

- Пременопаузальный период;

- Тяжелая степень почечной недостаточности (клиренс креатинина < 20 мл/мин);

- Средняя степень печеночной недостаточности;

- Тяжелая степень печеночной недостаточности (безопасность и эффективность не установлены);

- Сопутствующая терапия тамоксифеном или препаратами, содержащими эстрогены;

- Детский возраст до 18 лет (безопасность и эффективность у детей не установлены).

С осторожностью: остеопороз, гиперхолестеринемия, ишемическая болезнь сердца, нарушение функции печени, недостаточность лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в лекарственной форме препарата содержится лактоза).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Противопоказано при беременности. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь. Таблетку проглатывают целиком, запивая водой. Рекомендуется принимать препарат в одно и то же время вне зависимости от приема пищи. Взрослые, включая пожилых: по 1 мг внутрь 1 раз в сутки длительно. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить. В качестве адьювантной терапии рекомендуемая продолжительность лечения - 5 лет.

Легкая и средняя степень почечной недостаточности: коррекции дозы у пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции почек не требуется.

Легкая степень печеночной недостаточности: коррекции дозы у пациентов с легкой степенью печеночной недостаточности не требуется.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соотвественно следующим критериям: очень часто (не менее 1/10); часто (более 1/100, менее 1/10); иногда (более 1/1000, менее 1/100); редко (более 1/10000, менее 1/1000); очень редко (менее 1/10000), включая отдельные сообщения.

Со стороны сосудов: очень часто - «приливы» крови к лицу.

Со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: очень часто - артралгия/скованность суставов, артрит; часто - боль в костях, миалгия; нечасто - триггерный палец.

Со стороны половых органов и молочной железы: часто - сухость слизистой оболочки влагалища, влагалищные кровотечения (в основном, в течение первых недель после отмены или смены предшествующей гормональной терапии на анастрозол).

Со стороны кожи и подкожных тканей: очень часто - кожная сыпь; часто - истончение волос, алопеция, аллергические реакции; нечасто - крапивница; редко - мультиформная эритема, анафилактикоидная реакция, кожный васкулит (включая отдельные случаи пурпуры (синдром Шенлейна-Геноха), очень редко - синдром Стивенса-Джонсона, ангионевротический отек.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: очень

часто - тошнота; часто - диарея, рвота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: часто - повышение активности щелочной фосфатазы, аланинаминотрансферазы, аспартатамиотрансферазы; нечасто - повышение активности гамма-глутамилтрансферазы и концентрации билирубина, гепатит. Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; часто - сонливость, синдром запястного канала (в основном, наблюдался у пациенток с факторами риска данного заболевания), нарушения чувствительности (в том числе, парестезия, потеря или извращение вкусовых ощущений).

Со стороны обмена веществ и питания: часто - анорексия, гиперхолестеринемия; нечасто - гиперкальциемия (с/без повышения концентрации паратгормона). Прием препарата может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани в связи со снижением концентрации циркулирующего эстрадиола, тем самым, повышая риск возникновения остеопороза и переломов костей.

Общие расстройства: очень часто - астения легкой или умеренной степени выраженности.

Нежелательные явления, отмеченные в ходе клинических исследований, не связанные с приемом анастрозола: анемия, запор, диспепсия, боль в спине, абдоминальные боли, повышение артериального давления, повышение массы тела, депрессия, бессонница, головокружение, тревожность, парестезии.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Описаны единичные клинические случаи случайной передозировки препарата. Разовая доза анастрозола, которая могла бы привести к симптомам, угрожающим жизни, не установлена. Специфического антидота не существует, в случае передозировки лечение должно быть симптоматическим.

Лечение: можно индуцировать рвоту, если больной находится в сознании. Может быть проведен диализ. Рекомендуется общая поддерживающая терапия, наблюдение за больным и контроль функции жизненно важных органов и систем.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Исследования по лекарственному взаимодействию с феназоном (Антипирином) и циметидином указывают на то, что совместное применение анастрозола с другими препаратами вряд ли приведет к клинически значимому лекарственному взаимодействию, опосредованному цитохромом P450.

Клинически значимое лекарственное взаимодействие при приеме препарата Анастрозол одновременно с другими часто назначаемыми препаратами отсутствует.

На данный момент нет сведений о применении препарата Анастрозола в комбинации с другими противоопухолевыми препаратами.

Препараты, содержащие эстрогены, уменьшают фармакологическое действие анастрозола, в связи с чем, они не должны назначаться с ним одновременно.

Не следует назначать тамоксифен одновременно с анастрозолом, поскольку он может ослабить фармакологическое действие последнего.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Безопасность и эффективность у детей не установлены.

У женщин с рецептороотрицательной опухолью к эстрогенам эффективность анастрозола не была продемонстрирована, кроме тех случаев, когда имелся предшествующий положительный клинический ответ на тамоксифен. В случае сомнений в гормональном статусе пациентки менопауза должна быть подтверждена определением половых гормонов в сыворотке крови.

Препараты, содержащие эстрогены, не должны назначаться одновременно с анастрозолом, так

как эти препараты будут нивелировать его фармакологическое действие.

Нет данных о применении анастрозола у пациенток со средней и тяжелой степенью печеночной недостаточности.

В случае сохраняющегося маточного кровотечения на фоне приема анастрозола необходима консультация и наблюдение гинеколога.

У пациенток с остеопорозом или с повышенным риском развития остеопороза, минеральную плотность костной ткани следует оценивать методом денситометрии, например, DEXA - сканированием (двухэнергетическая рентгеновская абсорбциометрия), в начале лечения и регулярно на его протяжении. При необходимости следует назначать лечение или профилактику остеопороза и тщательно наблюдать за состоянием пациентки. Поскольку анастрозол снижает концентрацию циркулирующего эстрадиола, это может привести к снижению минеральной плотности костной ткани. На настоящий момент отсутствуют достаточные данные относительно положительного влияния бисфосфонатов на потерю минеральной плотности костной ткани, вызванной анастрозолом или их пользы при применении с целью профилактики.

Нет данных об одновременном применении анастрозола и препаратов-аналогов ЛГРГ (лютеинизирующего гормона рилизинг-гормона). Неизвестно улучшает ли анастрозол результаты лечения при совместном использовании с химиотерапией. Данные по безопасности при длительном лечении анастрозолом пока не получены. При применении анастрозола чаще, чем при терапии тамоксифеном, наблюдались ишемические заболевания, однако статистической значимости при этом не отмечено. Эффективность и безопасность анастрозола и тамоксифена при их одновременном применении вне зависимости от статуса гормональных рецепторов сравнимы с таковыми при использовании одного тамоксифена. Точный механизм данного явления пока не известен.

Влияние на способность управлять автотранспортом и работать с механизмами

Некоторые побочные действия анастрозола (астения, сонливость, головная боль, головокружение) могут отрицательно влиять на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. Поэтому в период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении транспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. При появлении описанных нежелательных явлений следует воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.
ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 1 мг.

По 10, 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50, 60, 100 или 120 таблеток в банки полимерные для лекарственных средств. Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать препарат после истечения срока годности.

Условия отпуска

По рецепту.

Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11. Адрес места производства (адрес для переписки, в том числе для приема претензий): 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6. Тел./факс: (84862) 3-41-09, 7-18-51 E-mail: ozon_pharm@samtel.ru www.ozonpharm.ru