МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

АКСАСТРОЛ®

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер:

Торговое название: АКСАСТРОЛ®

Международное непатентованное название (МНН): анастрозол (anastrozole)

Лекарственная форма: таблетки покрытые пленочной оболочкой

СОСТАВ

Одна таблетка покрытая пленочной оболочкой содержит:

активное вещество: анастрозол 1 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 65,00 мг, крахмал кукурузный – 13,00 мг, повидон К-30 – 2,00 мг, целлюлоза микрокристаллическая pH 102 – 12,00 мг, карбоксиметилкрахмал натрия тип А – 4,00 мг, кремния диоксид коллоидный безводный – 0,30 мг, магния стеарат – 0,70 мг, тальк – 2,00 мг;

оболочка: гипромеллоза 5 спз – 1,875 мг, макрогол 400 – 0,197 мг, титана диоксид – 0,711 мг, тальк – 0,217 мг.

ОПИСАНИЕ

Белые круглые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, с диаметром приблизительно 6,6 мм.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА

Противоопухолевое средство, эстрогенов синтеза ингибитор

КОД АТХ: L02BG03

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ

Фармакодинамика

Анастрозол является сильнодействующим и 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 подавляет уровень эстрадиола более чем на 80 %.

Анастрозол не обладает прогестагенной, 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 в кортикоидных добавках нет необходимости.

Фармакокинетика

Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста женщин в постменопаузе.

Всасывание анастрозола быстрое, максимальная концентрация в плазме достигается в течение двух часов после приема внутрь (натощак). Пища немного снижает скорость всасывания, но не его степень, и не приводит к клинически значимому эффекту достижения равновесной концентрации анастрозола в плазме при приеме однократной суточной дозы анастрозола. После приема 7 суточных доз концентрация анастрозола в плазме составляет 90-95 % от равновесной концентрации. Нет подтверждений зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени и дозы.

Анастрозол на 40 % связывается с белками плазмы.

Анастрозол выводится медленно, период полувыведения из плазмы составляет 40-50 часов. Интенсивно метаболизируется у женщин в постменопаузе. Менее 10 % принятой дозы выделяется в неизменном виде с мочой в течение 72 часов после приема. Метаболизм анастрозола происходит через стадии N-деалкилирования,

гидроксилирования и глюкуронизации. Триазол, основной метаболит анастрозола в плазме, не ингибирует ароматазу. Метаболиты выделяются главным образом почками. У добровольцев со стабильным циррозом печени или нарушением функции почек клиренс анастрозола после перорального приема оставался в пределах, наблюдаемых у здоровых добровольцев.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Адъювантная терапия раннего рака молочной железы с положительными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе, в том числе после 2-3-х летней адъювантной терапии тамоксифеном.
- Первая линия терапии местно-распространенного или метастатического рака молочной железы с положительным или неустановленным статусом гормональных рецепторов у женщин в постменопаузе.
- Вторая линия терапии распространенного рака молочной железы, прогрессирующего после лечения тамоксифеном.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

АКСАСТРОЛ® противопоказан в следующих случаях:

- при повышенной чувствительности к анастрозолу или к любому вспомогательному веществу препарата,
- во время беременности и в период лактации,
- у женщин в пременопаузе,
- при тяжелой форме почечной недостаточности (клиренс креатинина менее чем 20 мл/мин),
- при умеренных или тяжелых формах заболевания печени,
- при одновременном приеме тамоксифена,
- детский возраст.

С осторожностью: остеопороз, гиперхолестеринемия, ишемическая болезнь сердца.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь. Проглотить таблетку 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 адъювантной терапии рекомендуемая продолжительность лечения – 5 лет.

Нарушения функции почек: коррекгировка дозы не требуется.

Нарушения функции печени: корректировка дозы не требуется.

Длительность лечения зависит от формы и тяжести заболевания.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Определение частоты побочных реакций: очень часто (более 10%), часто (от 1 до 10%), редко (от 0,1 до 1%), очень редко (менее 0,1%).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто – «приливы» крови к лицу.

Со стороны костно-мышечной системы: очень часто – артралгия; редко – триггерный палец.

Со стороны репродуктивной системы: часто – сухость влагалища, влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или смены предшествующей гормональной терапии на анастрозол).

Со стороны кожи и кожных покровов: очень часто – кожная сыпь; часто – истончение волос, алопеция; очень редко – полиморфная эритема (синдром Стивенса-Джонсона).

Со стороны системы пищеварения: очень часто – тошнота, часто – диарея, рвота, анорексия.

Со стороны гепатобилиарной системы: часто – повышение активности аланинаминотрансферазы, аспартатаминотрансферазы и щелочной фосфотазы, редко – повышение активности гаммаглутаминтрансферазы и концентрации билирубина, гепатит.

Со стороны нервной системы: очень часто – головная боль; часто – повышенная сонливость, синдром запястного канала (в основном наблюдается у пациенток с факторами риска по данному заболеванию).

Со стороны метаболизма: часто – гиперхолестеринемия. 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.

Аллергические реакции: часто – аллергические реакции; очень редко – анафилактоидные реакции, ангионевротический отек, крапивница, анафилактический шок.

Прочие: очень часто – астения.

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.

Может быть проведен диализ. Если пациент находится в сознании, рекомендуется вызвать рвоту.

Рекомендуется общая поддерживающая терапия, включая частый контроль показателей жизнедеятельности и тщательное наблюдение за пациентом.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Исследования по лекарственному взаимодействию с антипирином и циметидином указывают на то, что совместное применение анастрозола с другими препаратами вряд ли приведет к клинически значимому лекарственному взаимодействию, опосредованному цитохромом Р450.

Нет данных относительно одновременного приема препарата 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 анастрозола у детей не установлена.

У женщин с рецепторотрицательной опухолью к экстрогенам 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 концентрации половых гормонов в сыворотке крови.

Нет данных о применении анастрозола у пациенток с умеренной или тяжелой степенью нарушений функции печени. В случае сохраняющегося маточного кровотечения на фоне приема анастрозола необходима консультация и наблюдение гинеколога.

Препараты, содержащие эстрогены, не должны назначаться одновременно с анастрозолом, так как эти препараты будут нивелировать его фармакологическое действие.

Снижая концентрацию циркулирующего эстрадиола, анастрозол может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани. У пациенток с остеопорозом или с риском возникновения этого заболевания необходимо осуществлять проверку плотности костей методом денситометрии в начале терапии и в динамике. Если необходимо, рекомендуется проводить превентивную и адъювантную терапию под строгим контролем.

Нет данных относительно одновременного приема анастрозола с аналогами гонадотропин-рилизинг-гормона. Неизвестно, улучшает ли анастрозол результаты лечения при совместном использовании с химиотерапией.

Таблетки АКСАСТРОЛА® содержат лактозу. Пациентам с редкой врожденной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или мальабсорбцией глюкозы-галактозы нельзя назначать данное лекарство.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Некоторые побочные действия анастрозола (астения и сонливость) 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.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки покрытые пленочной оболочкой 1 мг.

По 14 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминисвой.

По 2 контурные ячейковые упаковки по 14 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

СРОК ГОДНОСТИ

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

По рецепту.

ВЛАДЕЛЕЦ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

АО «Гриндекс». Ул. Крустпилс, 53, Рига, LV-1057, Латвия

Телефон: +371 67083205

Факс: +371 67083505

Электронная почта: grindeks@grindeks.lv

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

«Ремедика ООО», Кипр

Организация, принимающая претензии: представительство в Москве

Адрес представительства: 123242, Москва, ул. Б. Грузинская, д. 14, комната правления 2, тел. в Москве 7716505*.

Представитель
АО «Гриндекс» **Т.С. Заболотная**

ПРЕДСТАВИТЕЛЬСТВО АКЦИОНЕРНОГО ОБЩЕСТВА "Гриндекс" МОСКВА

* В случае изменения указывается новый номер телефона.