МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 001327- 300117
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного препарата

Анастрозол Сан

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Анастрозол Сан

Международное непатентованное наименование: анастрозол

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

СОСТАВ

Одна таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

действующее вещество – анастрозол 1,00 мг;

вспомогательные вещества: карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) – 3,00 мг, лактозы моногидрат – 68,75 мг, повидон-К30 – 1,5 мг, магния стеарат – 0,75 мг;

состав оболочки: опадрай белый (03В58625) [гипромеллоза-2910 (Е464), титана диоксид (Е171), макрогол-400] – 2,25 мг.

ОПИСАНИЕ

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого или почти белого цвета; на одной стороне таблетки имеется гравировка “А1”.

Вид таблетки на поперечном срезе: белого или почти белого цвета.

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. У женщин в постменопаузе анастрозол в суточной дозе 1 мг вызывает снижение концентрации эстрадиола на 80 %.

Анастрозол не обладает прогестогенной, андрогенной и эстрогенной активностью. Анастрозол в суточных дозах до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и альдостерона.

Фармакокинетика: Всасывание анастрозола быстрое, максимальная концентрация в плазме крови достигается в течение 2 часов после приема внутрь (натощак). Приём пищи

незначительно уменьшает скорость всасывания, но не степень всасывания и не приводит к клинически значимому влиянию на равновесную концентрацию препарата в плазме крови при однократном приёме суточной дозы анастрозола. После 7-дневного приема препарата достигается приблизительно 90 – 95 % равновесной концентрации анастрозола в плазме крови.

Связь с белками плазмы крови – 40 %.

Период полувыведения из плазмы крови составляет около 50 часов. Менее 10 % дозы выводится почками в неизменённом виде в течение 72 часов после приёма препарата. Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием, гидроксилированием и глюкуронизацией. Метаболиты (триазол, глюкуроновый конъюгат гидроксианасторозола и глюкуроновый конъюгат анастрозола) выводятся преимущественно через почки. Триазол, основной метаболит, определяемый в плазме крови, не ингибирует ароматазу. Клиренс анастрозола после перорального приёма при циррозе печени или нарушении функции почек не изменяется.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Адъювантная 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-распространённого или метастатического рака молочной железы, с положительными или неизвестными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе.
- Вторая линия терапии распространённого рака молочной железы, прогрессирующего после лечения тамоксифеном, у женщин в постменопаузе.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Повышенная чувствительность к анастрозолу или другим компонентам препарата;
- Пременопаузальный период;
- Печёночная недостаточность тяжёлой степени (безопасность и эффективность не установлены);
- Почечная недостаточность тяжёлой степени (клиренс креатинина менее 20 мл/мин.);
- Эстрогензависимые опухоли молочной железы у женщин в пременопаузальном периоде
- Сопутствующая терапия тамоксифеном или препаратами, содержащими эстрогены;
- Беременность и период грудного вскармливания;

- Детский возраст (безопасность и эффективность не установлена).

С ОСТОРОЖНОСТЬЮ принимается при остеопорозе, гиперхолестеринемии, ишемической болезни сердца, нарушении функции печени, недостаточности лактазы, непереносимости лактозы, глюкозо-галактозной мальабсорбции.

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

Применение препарата в период беременности и в период грудного вскармливания противопоказано.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь. Проглотить таблетку целиком, запивая водой. Рекомендуется принимать препарат в одно и то же время.

Взрослые, включая пожилых: по 1 мг 1 раз в сутки. Длительность лечения зависит от формы и тяжести заболевания (при адъювантной терапии рекомендуемая продолжительность лечения – 5 лет. При появлении признаков прогрессирования заболевания приём препарата следует прекратить.

Нарушения функции почек: коррекция дозы у пациентов с легкой и умеренной степенью нарушения функции почек не требуется. Пациентам с почечной недостаточностью тяжёлой степени препарат следует применять с осторожностью.

Нарушения функции печени: коррекция дозы у пациентов с легкой степенью нарушения функции печени не требуется.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Определение частоты побочных реакций: очень часто (более или равно 1/10); часто (более 1/100, менее 1/10); нечасто (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, анафилактоидная реакция, кожный васкулит (включая отдельные случаи

пурпуры (синдром Шенлейна-Геноха)); очень редко – синдром Стивенса-Джонсона, ангионевротический отёк.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: очень часто – тошнота; часто – диарея, рвота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: часто – повышение активности щелочной фосфатазы, аланинаминотрансферазы, аспартатаминотрансферазы; 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). Приём 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 и умеренной степени выраженности.

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

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: Разовая доза анастрозола, которая могла бы привести к симптомам, угрожающим жизни, не установлена.

Лечение: Специфического антидота не существует; в случае передозировки лечение должно быть симптоматическим. 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.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Клинически значимое лекарственное взаимодействие при приёме анастрозола одновременно с другими часто назначаемыми препаратами отсутствует.

Исследования по лекарственному взаимодействию с феназоном и циметидином указывают на то, что совместное применение анастрозола с другими препаратами с низкой вероятностью приведёт к клинически значимому лекарственному

взаимодействию, опосредованному цитохромом Р450. На данный момент нет сведений о применении анастрозола в комбинации с другими противоопухолевыми препаратами.

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

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

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

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.

Нет данных о применении анастрозола у пациентов с тяжёлой степенью нарушений функции печени или у пациентов с выраженными нарушениями функции почек (клиренс креатинина менее 20 мл/мин.).

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.

На настоящий момент отсутствуют достаточные данные относительно положительного влияния бисфосфонатов на потерю минеральной плотности костной ткани, вызванную анастрозолом, или их пользы при применении с целью профилактики.

У пациенток, страдающих остеопорозом или имеющих риск развития остеопороза, минеральная плотность костной ткани должна оцениваться методом денситометрии в начале лечения и в динамике. При необходимости должны быть начаты лечение или профилактика остеопороза под тщательным наблюдением врача.

Нет данных об одновременном применении анастрозола и препаратов аналогов гонадотропин-рилизинг-гормона.

Данные по безопасности при длительном лечении анастрозолом пока не получены.

Эффективность и безопасность анастрозола и тамоксифена при их одновременном применении вне зависимости от статуса гормональных рецепторов сравнимы с таковыми при применении одного тамоксифена. Точный механизм данного явления пока не известен.

Неизвестно улучшает ли анастрозол результаты лечения при совместном использовании с химиотерапией.

При сохранении метроррагии на фоне лечения необходима консультация гинеколога.

ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ АВТОМОБИЛЕМ И ДРУГИМИ МЕХАНИЗМАМИ

Некоторые побочные действия анастрозола, такие как астения и сонливость, могут отрицательно влиять на способность выполнения потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В этой связи рекомендуется при появлении этих симптомов соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 1 мг.

По 5 таблеток в блистере, изготовленном из ПВХ пленки и алюминиевой фольги. По 5 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

По 14 таблеток в блистере, изготовленном из ПВХ пленки и алюминиевой фольги. По 2 блистера вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

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

Хранить в недоступном для детей месте.

СРОК ГОДНОСТИ

2 года.

Не использовать после истечения срока годности.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Отпускают по рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

"Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд."

Халол Барода Хайвэй, Халол – 389 350, Дист. Панчмахал, Гуджарат, Индия.

Претензии потребителей направлять в представительство компании Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд. по адресу: 129223, г. Москва, пр. Мира, дом. 119, стр. 537/2.

Тел.: (495)234-56-11/15, факс: (495)234-56-19.

Руководитель отдела регистрации Л. С. Туниева

Исполнитель:

Специалист отдела регистрации А. Г. Сафронов