

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА АРИМИДЕКС®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Аримидекс®

Международное непатентованное или группировочное наименование: анастрозол

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

Состав на 1 таблетку

действующее вещество: анастрозол 1,0 мг;

вспомогательные вещества:

ядро таблетки: лактозы моногидрат 93,0 мг, повидон 2,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия 3,0 мг, магния стеарат 1,0 мг;

оболочка: гипромеллоза 1,50 мг, макрогол 300 0,30 мг, титана диоксид 0,45 мг.

Описание

Круглые, двояковыпуклые таблетки белого цвета, покрытые пленочной оболочкой; с гравировкой в виде буквы А с продолжением правой стороны в виде стрелки, направленной вниз, – на одной стороне и Adx на другой.

Фармакотерапевтическая группа: противоопухолевые гормональные препараты; антагонисты гормонов и родственные соединения; ингибиторы ароматазы.

Код АТХ: L02BG03

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Аримидекс® 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 уровня циркулирующего эстрадиола у больных раком молочной железы оказывает терапевтический эффект. У женщин в постменопаузе Аримидекс® в суточной дозе 1 мг вызывает снижение уровня эстрадиола на 80 %.

Аримидекс® не обладает прогестогенной, андрогенной и эстрогенной активностью.

Аримидекс® в суточных дозах до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и альдостерона, следовательно, при применении препарата Аримидекс® не требуется заместительного введения кортикостероидов.

Влияние на минеральную плотность костной ткани

Показано, что у пациенток с гормоноположительным ранним раком молочной железы в постменопаузе, которые принимают Аримидекс®, изменения костной системы могут быть предупреждены в соответствии со стандартами, установленными для лечения пациенток с определенным риском переломов. Так, преимущество препарата Аримидекс® в комбинации с бисфосфонатами (по сравнению с терапией только препаратом Аримидекс®) у пациентов со средним и высоким риском возникновения переломов было продемонстрировано уже через 12 месяцев по показателям минеральной костной плотности, структурного изменения костной ткани и маркерам костной резорбции. Более того, в группе низкого риска не было отмечено изменения показателя минеральной костной плотности на фоне терапии одним препаратом Аримидекс® и поддерживающего лечения витамином D и кальцием.

Липиды

При терапии препаратом Аримидекс®, в том числе при приеме в комбинации с бисфосфонатами, не выявлено изменений уровня липидов в плазме.

Фармакокинетика

Всасывание анастрозола быстрое, максимальная концентрация в плазме достигается в течение 2 часов после приема внутрь (натощак). Пища незначительно уменьшает скорость всасывания, но не его степень, и не приводит к клинически значимому влиянию на равновесную концентрацию препарата в плазме при однократном приеме суточной дозы препарата Аримидекс®. После 7-дневного приема препарата достигается приблизительно 90–95 % равновесной концентрации анастрозола в плазме. 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 % дозы выделяется с мочой в неизменном виде в течение 72 часов после приема препарата. Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием,

гидроксированием и глюкуронизацией. Метаболиты выводятся преимущественно с мочой. Триазол – основной метаболит, определяемый в плазме, не ингибирует ароматазу. Клиренс анастрозола после перорального приема при циррозе печени или нарушении функции почек не изменяется.

Показания

- Адъювантная терапия раннего рака молочной железы, с положительными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе, в том числе после адъювантной 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 вспомогательным веществам препарата.
- Беременность и период грудного вскармливания.
- У женщин в пременопаузе.
- Почечная недостаточность тяжелой степени тяжести (клиренс креатинина менее 20 мл/мин).
- Средняя или 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, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Способ применения и дозы

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

Взрослые, включая пациентов пожилого возраста: 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.

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

Пациенткам с нарушением функции почек легкой и средней степени тяжести не требуется коррекция дозы.

Пациенты с нарушением функции печени

Пациенткам с нарушением функции печени легкой степени тяжести не требуется коррекция дозы.

Побочное действие

Частота встречаемости была рассчитана из числа нежелательных явлений, наблюдаемых в рамках исследования III фазы у 9366 женщин с операбельным раком молочной железы в постменопаузе, получавших лечение в течение 5 лет, при этом частота нежелательных явлений в группах сравнения и мнение исследователя относительно зависимости нежелательного явления от исследуемого препарата не учтены. Дополнительно, где применимо, представлена информация из постмаркетинговых исследований.

Нежелательные реакции сгруппированы по системно-органным классам. Внутри каждого класса нежелательные реакции перечислены в порядке убывания частоты. Частота возникновения побочных реакций представлена в следующей градации: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$).

Нарушения метаболизма 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.

Психические нарушения

Очень часто – депрессия.

Нарушения 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).

Нарушения со стороны сосудов

Очень часто – «приливы».

Желудочно-кишечные нарушения

Очень часто – тошнота;

Часто – диарея, рвота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Часто – повышение активности щелочной фосфатазы, аланинаминотрансферазы, аспартатаминотрансферазы;

Нечасто – повышение активности гамма-глутамилтрансферазы и концентрации билирубина, гепатит.

Нарушения 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 отек.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани

Очень часто – артралгия / скованность суставов, артрит, остеопороз;

Часто – боль в костях, миалгия;

Нечасто – триггерный палец, тендинит, включая теносиновит;

Редко – разрыв сухожилия.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез

Часто – сухость слизистой оболочки влагалища; влагалищные кровотечения (в основном, в течение первых недель после отмены или смены предшествующей гормональной терапии на препарат Аримидекс®).

Общие нарушения и реакции в месте введения

Очень часто – астения легкой или умеренной степени выраженности.

Нежелательные явления, отмеченные в ходе клинических исследований, не связанные с приемом препарата Аримидекс®: анемия, запор, диспепсия, боль в спине, абдоминальные

боли, повышение артериального давления, повышение массы тела, бессонница, головокружение, тревожность.

Передозировка

Описаны единичные клинические случаи случайной передозировки препарата. Разовая доза препарата Аримидекс®, которая могла бы привести к симптомам, угрожающим жизни, не установлена.

Специфического антидота не существует, в случае передозировки лечение должно быть симптоматическим. Можно вызвать рвоту, если пациент находится в сознании. Может быть проведен диализ. Рекомендуется общая поддерживающая терапия, наблюдение за пациентом и контроль функции жизненно важных органов и систем.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды лекарственного взаимодействия

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

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

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

Препараты, содержащие эстрогены, уменьшают фармакологическое действие препарата Аримидекс®, в связи с чем они не должны назначаться одновременно с препаратом Аримидекс®.

Не следует назначать тамоксифен одновременно с препаратом Аримидекс®, поскольку он может ослабить фармакологическое действие последнего.

Особые указания

У женщин с рецептороотрицательной к эстрогенам опухолью эффективность препарата Аримидекс® 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 препарата Аримидекс® у пациентов с умеренной или выраженной печеночной недостаточностью и у пациентов с выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 20 мл/мин).

В случае сохраняющегося маточного кровотечения на фоне приема препарата Аримидекс® необходима консультация и наблюдение гинеколога.

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

Снижая уровень циркулирующего эстрадиола, Аримидекс® может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани с последующим повышением риска перелома.

Пациентки с таким высоким риском подлежат лечению в соответствии с руководством по терапии данных осложнений.

У пациенток, страдающих остеопорозом или имеющих риск развития остеопороза, минеральная плотность костной ткани должна оцениваться методом денситометрии, например, DEXA сканированием (Dual-Energy X-ray Absorptiometry – двухэнергетической рентгеновской абсорбциометрией), 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 ЛГРГ.

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

Данные по безопасности при длительном лечении анастрозолом пока не получены.

При применении препарата Аримидекс® чаще, чем при терапии тамоксифеном, наблюдались ишемические заболевания, однако статистической значимости при этом не отмечено.

Эффективность и безопасность препарата Аримидекс® 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.

Могут возникнуть тендинит и разрывы сухожилий. Тщательное наблюдение за пациентами и соответствующее лечение (например, иммобилизация) должны быть предприняты для пораженного сухожилия.

Влияние на способность управлять автомобилем и другими механизмами

Некоторые побочные действия препарата Аримидекс®, 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.

14 таблеток в блистере из Ал/ПВХ; по 2 блистера с инструкцией по применению в картонной пачке с контролем первого вскрытия.

Условия хранения

При температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

АстраЗенека ЮК Лимитед, 1 Френсис Крик Авеню, Кембридж Биомедикал Кампус, Кембридж, Великобритания CB2 0AA

AstraZeneca UK Limited, 1 Francis Crick Avenue, Cambridge Biomedical Campus, Cambridge, United Kingdom CB2 0AA

Производитель

АстраЗенека Фармасьютикалс ЛП, 587 Олд Балтимор Пайк, Ньюарк, Делавэр, 19702, США

AstraZeneca Pharmaceuticals LP, 587 Old Baltimore Pike, Newark, Delaware, 19702, USA

Фасовщик (первичная упаковка), упаковщик (вторичная (потребительская) упаковка), выпускающий контроль качества

АстраЗенека ЮК Лимитед, Силк Роуд Бизнес Парк, Макклсфилд, Чешир SK10 2NA, Великобритания

AstraZeneca UK Limited, Silk Road Business Park, Macclesfield, Cheshire SK10 2NA, United Kingdom

Наименование, адрес организации, уполномоченной держателем или владельцем регистрационного удостоверения лекарственного препарата для медицинского применения на принятие претензий от потребителя:

Российская Федерация

ООО «АстраЗенека Фармасьютикалз»

123112, г. Москва, 1-й Красногвардейский проезд, д. 21, стр. 1, этаж 30, комнаты 13 и 14

тел. +7 (495) 799 56 99

факс +7 (495) 799 56 98

Электронная почта: Safety.Russia@astrazeneca.com

ProductQuality.ru@astrazeneca.com

Аримидекс – товарный знак, собственность группы компаний АстраЗенека.

© AstraZeneca 2009–2024