

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

АНАСТРОЗОЛ

Регистрационный номер: ЛП-003171

Торговое наименование препарата: Анастрозол.

Международное непатентованное наименование: анастрозол.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав

Одна таблетка содержит:

Действующее вещество: анастрозол 1,00 мг.

Вспомогательные вещества: Ядро - лактозы моногидрат - 16,00 мг, лактоза безводная - 16,00 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 6,00 мг, целлюлоза микрокристаллическая (тип М102) - 18,00 мг, кремния диоксид коллоидный - 2,00 мг, магния стеарат - 1,00 мг; Оболочка - опадрай белый (04F58804) [гипромеллоза 2910 – 1,875 мг, диоксид титана 0,750 мг, макрогол 6000 – 0,375 мг] 3,00 мг.

Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, с риской на одной стороне. На разрезе таблетки белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Противоопухолевое средство, эстрогенов синтеза ингибитор.

Код АТХ

L02BG03

Фармакологические свойства**Фармакодинамика**

Анастрозол является высокоэффективным нестероидным ингибитором ароматазы – фермента с помощью которого у женщин в постменопаузе андростендион в периферических тканях превращается в эстрон и далее в эстрадиол. Снижение концентрации циркуляционного эстрадиола у пациентов с раком молочной железы оказывает терапевтический эффект. У женщин в постменопаузе анастрозол в суточной дозе 1 мг вызывает снижение эстрадиола на 80 %.

Анастрозол не обладает прогестогенной, андрогенной и эстрогенной активностью. В

суточных дозах до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и альдостерона, следовательно, при применении анастрозола не требуется заместительного введения глюкокортикостероидов.

Влияние на минеральную плотность костной ткани

Показано, что у пациенток с гормоноположительным ранним раком молочной железы в постменопаузе, которые принимают анастрозол, изменения костной системы могут быть предупреждены в соответствии со стандартами, установленными для лечения, пациенток с определенным риском переломов. Так, преимущество анастрозола в комбинации с бисфосфонатами (по сравнению с терапией только анастрозолом) 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 анастрозолом и поддерживающего лечения витамином D и кальцием.

Липиды

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

Фармакокинетика

После приема внутрь анастрозол быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта. Максимальная концентрация в плазме крови обычно 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 крови при однократном приеме суточной дозы анастрозола. После 7-дневного приема препарата достигается приблизительно 90 - 95 % равновесной концентрации анастрозола в плазме крови. Сведений о зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени и дозы нет. Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста женщин в постменопаузе. Связь с белками плазмы крови - 40 %.

Анастрозол экстенсивно метаболизируется у женщин в постменопаузе, при этом менее 10% экскретируется почками в неизменном виде в течение 72 ч после приема препарата. Период полувыведения анастрозола из плазмы крови составляет 40 - 50 часов. Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием, гидроксигированием и глюкуронидацией.

Метаболиты анастрозола выводятся преимущественно почками. Основным метаболитом анастрозола - триазол, определяемый в плазме крови, не обладает фармакологической активностью.

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

Показания к применению

- Адювантная 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-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.
- Выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 20 мл/мин).
- Умеренная или выраженная печеночная недостаточность (безопасность и эффективность не установлена).
- Сопутствующая терапия тамоксифеном или препаратами, содержащими эстрогены.
- Беременность и период грудного вскармливания.
- Детский возраст (безопасность и эффективность у детей не установлена).

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

Применение при беременности и в период грудного вскармливания противопоказано.

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 адъювантной терапии рекомендуемая продолжительность лечения - 5 лет.

Пациенткам с почечной недостаточностью легкой и средней степенью тяжести не требуется коррекция дозы.

Пациенткам с печеночной недостаточностью легкой степени тяжести не требуется коррекция дозы.

Побочные действия

Частота побочных реакций, приведённых ниже, определялась соответственно следующим критериям: очень часто (не менее 1/10), часто (более 1/100, менее 1/10); не часто (более 1/1000, менее 1/100); редко (более 1/1000, менее 1/10000); 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 репродуктивной системы: часто - сухость слизистой оболочки влагалища, влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или замены 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 - полиморфная эритема (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 аланин аминотрансферазы, аспартат аминотрансферазы и щелочной фосфатазы; нечасто - повышение активности гамма-глутамилтрансферазы и концентрации билирубина, гепатит.

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; часто - сонливость, синдром запястного канала (в основном наблюдается у пациенток с факторами риска по данному заболеванию), нарушения чувствительности (в том числе извращение вкусовых ощущений).

Со стороны метаболизма: часто - анорексия, гиперхолестеринемия; нечасто - гиперкальциемия (с/без повышения концентрации паратгормона). Прием препарата может вызвать 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, боли в спине.

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

Передозировка

Симптомы.

Описаны единичные случаи случайной передозировки препарата. 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 пациент находится в сознании. Может быть проведён диализ. Рекомендуются общая поддерживающая терапия, наблюдение за пациентом и контроль функций жизненно важных органов и систем.

Взаимодействие 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 анастрозола одновременно с другими часто назначаемыми препаратами отсутствует.

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

В случае сомнений в гормональном статусе пациентки, менопауза должна быть подтверждена определением концентрации половых гормонов в сыворотке крови.

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

Нет данных о применении анастрозола у пациенток с тяжелой степенью нарушений функции печени.

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 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 гонадотропин – рилизинг гормона.

Нет данных о безопасности применения анастрозола у пациентов с тяжелой степенью почечной и печеночной недостаточности.

У женщин с рецептороотрицательной опухолью к эстрогенам эффективность анастрозола не была продемонстрирована, кроме тех случаев, когда имелся предшествующий положительный клинический ответ на тамоксифен.

Препараты, содержащие эстрогены, не должны назначаться одновременно с анастрозолом, так как эти препараты будут нивелировать его фармакологическое действие. 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. Неизвестно, улучшает ли анастрозол результаты лечения при совместном использовании с химиотерапией

Влияние на способность управлять транспортными средствами, 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 данных побочных эффектов воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые плёночной оболочкой, 1 мг.

По 10 или 14 таблеток, в блистер из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 2, 3, 4 или 6 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

По 30 или 60 таблеток во флакон из полиэтилена высокой плотности, отверстие которого закрыто фольгой алюминиевой, с завинчивающейся крышкой из полиэтилена высокой плотности.

По 1 флакону вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

Опускают по рецепту.

Производитель

Джодас Экспоим Pvt. Лтд., Индия

Участок 55, Фаза-3, Биотек Парк, Каркапатла (Вилладж), Мулугу (М), Медак (Дистрикт)-502 279, Телангана, Индия.

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Джодас Экспоим», Россия

140202, Московская обл., р-он Воскресенский, г. Воскресенск, ул. Московская, д. 45м, офис 4.

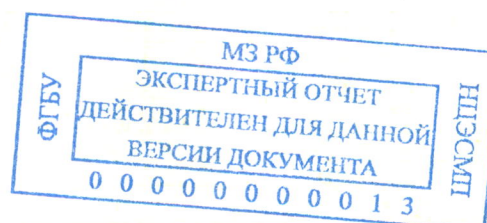
Телефон: (499) 503-01-92

E-mail: info@jodas.ru

Директор по экономике
ООО «Джодас Экспоим»



Джиоти Лумба



124183