

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
Анастрозол-Тева

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Анастрозол-Тева

Международное непатентованное название: анастрозол (anastrozole).

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

активное вещество анастрозол 1,0 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (200 меш), повидон-К30, лактозы моногидрат (высушенный распылением), карбоксиметилкрахмал натрия, тип А, магния стеарат, оболочка Опадрай белый 02G28619 (гипромеллоза Е464, титана диоксид Е171, макрогол-6000, макрогол-400).

Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого или почти белого цвета с гравировкой «93» на одной стороне и «A10» на другой.

Фармакотерапевтическая группа: противоопухолевое средство – эстрогенов синтеза ингибитор.

Код АТХ: L02B G03.

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 концентрации циркулирующего эстрадиола у пациентов с раком молочной железы оказывает терапевтический эффект. У женщин в постменопаузе анастрозол в суточной дозе 1 мг вызывает снижение концентрации 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 кортикостероидов.

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 или 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 неизмененном виде в течение 72 ч после приема препарата. Период полувыведения анастрозола из плазмы крови составляет 40-50 часов. Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием, гидроксилированием и глюкуронидацией.

Метаболиты анастрозола выводятся преимущественно почками. Основной метаболит 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

- Адъювантная терапия раннего рака молочной железы с положительными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе.
- Первая линия терапии местно-распространенного рака молочной железы, с положительными или неизвестными гормональными рецепторами у женщин в постменопаузе.
- Вторая линия терапии распространенного рака молочной железы, прогрессирующего после лечения тамоксифеном.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к анастрозолу или другим компонентам препарата.
- Пременопаузальный период.
- Выраженная печеночная недостаточность (безопасность и эффективность не установлена).
- Сопутствующая терапия тамоксифеном или препаратами, содержащими эстрогены.
- Беременность и период кормления грудью.
- Детский возраст (безопасность и эффективность у детей не установлена).

С осторожностью: остеопороз, гиперхолестеринемия, ишемическая болезнь сердца, нарушение функции печени, тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина <20 мл/мин), недостаточность лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в лекарственной форме препарата содержится лактоза).

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.

Нарушения функции почек: коррекция дозы у пациентов с нарушением функции почек не требуется.

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

Побочное действие

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно 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 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 слизистой оболочки влагалища, влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или замены предшествующей гормональной терапии на анастрозол).

Со стороны кожи и кожных придатков: 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 фосфатазы; редко – повышение активности гамма-глутамилтрансферазы и концентрации билирубина, гепатит.

Со стороны нервной системы: очень часто – головная боль; часто – повышенная сонливость, синдром запястного канала (в основном наблюдался 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 – анафилактикоидные 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. Можно индуцировать рвоту, если пациент находится в сознании. Может быть проведен 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 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 гонадотропин – рилизинг гормона.

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 к вождению автомобиля и управлению 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 7 таблеток в блистере из ПВХ/ПВДХ/алюминиевой фольги; 4 или 8 блистеров с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения

Список Б.

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Владелец РУ: Тева Фармацевтические Предприятия Лтд.,
5 Базель Ст., а/я 3190, Петах-Тиква 49131, Израиль.

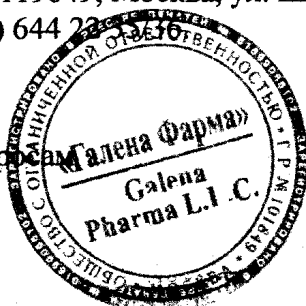
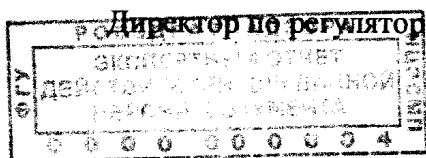
Производство, упаковка и выпуск: Тева Фармацевтические Предприятия Лтд.,
64 ХаШикма Стр., а/я 353, Кфар-Сава 44102, Израиль.

Альтернативное место вторичной упаковки

Фармацевтический завод Тева Прайвэт Ко. Лтд.,
ул. Танчич Михали 82, Н-2100 Годолло, Венгрия.

Адрес для приема претензий: 119049, Москва, ул. Шаболовка, 10, стр.1.

тел.: (495) 644 22 34, факс: (495) 644 22 35



И.В. Редзюк

5 3 9 9 5