

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

АРИМИДЕКС® (ARIMIDEX®)
наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Аримидекс®

Международное непатентованное название: анастрозол (anastrozole)

Лекарственная форма: таблетки, покрытые плёночной оболочкой

Состав

1 таблетка, покрытая плёночной оболочкой, содержит:

активное вещество: анастрозол 1,0 мг

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 93,0 мг, повидон 2,0 мг,
карбоксиметилкрахмал натрия 3,0 мг, магния стеарат 1,0 мг

состав плёночной оболочки: гипромеллоза 1,50 мг, макрогол 300 0,30 мг, титана
диоксид 0,45 мг

Описание

Круглые, двояковыпуклые таблетки белого цвета, покрытые плёночной оболочкой; с
гравировкой А – на одной стороне и Adx на другой.

Фармакотерапевтическая группа: противоопухолевое средство, эстрогенов синтеза
ингибитор.

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 гормоночувствительным 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 неизмененном виде в течение 72 часов после приема препарата. Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием, гидроксилированием 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 гормоноположительного рака молочной железы в постменопаузе.
- Лечение распространенного рака молочной железы у женщин в постменопаузе.
- Адъювантная терапия раннего гормоноположительного рака молочной железы у женщин в постменопаузе после терапии тамоксифеном в течение 2-3 лет.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к анастрозолу или другим составным частям препарата
- Беременность и период кормления грудью
- У женщин в пременопаузе
- 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
- Детский возраст (безопасность и эффективность у детей не установлена)

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 тоже время.

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: корректировка дозы у пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции почек не требуется

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

Побочное действие

Частота встречаемости была рассчитана из числа нежелательных явлений, наблюдаемых в рамках III фазы исследования у 9366 постменопаузальных женщин с операбельным раком молочной железы, 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.

Определение частоты побочных реакций: очень часто (более или равно 10%); часто (от 1 до менее 10%); нечасто (от 0,1 до менее 1%); редко (от 0,01 до менее 0,1%), очень редко (менее 0,01%)

Со стороны сосудистой системы:

очень часто – приливы.

Со стороны костно-мышечной системы:

очень часто – артралгия / скованность суставов, артрит

часто – боль в костях

нечасто – триггерный палец.

Со стороны репродуктивной системы:

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

Со стороны кожи и кожных придатков:

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.

Со стороны системы пищеварения:

очень часто — тошнота,

часто — диарея, рвота.

Со стороны гепатобилиарной системы:

часто — повышение активности щелочной фосфатазы, аланин аминотрансферазы, аспартат аминотрансферазы,

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).

Со стороны метаболизма:

часто — анорексия, 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.

Прочие:

очень часто.

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 индуцировать рвоту, если больной находится в сознании. Может быть проведен диализ. Рекомендуются общая поддерживающая терапия, наблюдение за больным и контроль функции жизненно важных органов и систем.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды лекарственного взаимодействия

Исследования по лекарственному взаимодействию с феназоном (антипирином) 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

Безопасность и эффективность у детей не установлена.

У женщин с рецептороотрицательной опухолью к эстрогенам 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 соответственно руководству 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.

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 плёночной оболочкой, по 1 мг. 14 таблеток в блистере из Ал/ПВХ; по 2 блистера в картонной пачке с инструкцией по применению.

Условия хранения

При температуре не выше 30°C, в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Фирма-производитель

АстраЗенека ЮК Лимитед, Великобритания, произведено АстраЗенека Фармасьютикалс
ЛП, США, 578 Олд Балтимор Пайк, Ньюарк, Делавэр

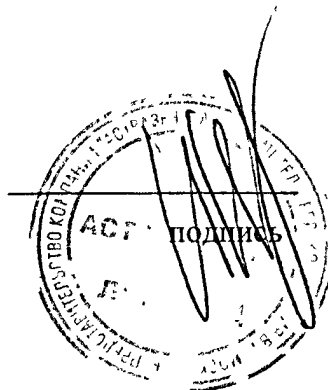
Дальнейшая информация предоставляется по требованию:

Представительство АстраЗенека ЮК Лимитед, Великобритания, в г. Москве
и ООО АстраЗенека Фармасьютикалз
125284 Москва, ул. Беговая д.3 стр. 1.
тел. (495) 799 56 99, факс (495) 799 56 98

Аримидекс – товарный знак, собственность компании АстраЗенека.

© AstraZeneca 2009

Менеджер по регистрации
лекарственных препаратов



Снегирёва П.Б.

ФИО