

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ
ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

АНАСТРОЗОЛ

Регистрационный номер: ЛП 001675-280412

Торговое название препарата: Анастрозол

Международное непатентованное название: анастрозол (anastrozole)

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

1 таблетка покрытая пленочной оболочкой содержит:

Действующее вещество: анастрозол - 1 мг;

Вспомогательные вещества: лактоза моногидрат (Flowlac 100)-84,70мг, лактозамонгидрат (Granulac 200)-5мг, карбоксиметилкрахмал натрия-7мг, повидон (Plasdone K-29/32)-1,5мг, магния стеарат-0,8мг, Опадрай II белый (Y-1-7000): (гипромеллоза-1,5мг, титана диоксид-0,75мг, макрогол 400-0,15 мг.

Описание

Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с гравировкой «Н» на одной стороне таблетки и «1» на другой. На поперечном разрезе ядро 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. Снижение концентрации циркулирующего эстрадиола у больных 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 неизменном 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. Основным 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

- Адьювантная 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-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.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к анастрозолу или другим компонентам препарата.
- Пременопаузальный период;
- Выраженная печеночная недостаточность (безопасность и эффективность не установлена)
- Сопутствующая терапия тамоксифеном или эстрогенами;
- 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 адьювантной 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, боль в костях, скованность суставов, артрит; редко - триггерный палец.

Со стороны репродуктивной системы: часто - сухость влагалища, влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или смены предшествующей гормональной терапии на анастрозол).

Со стороны кожи и кожных придатков: очень часто - кожная сыпь; часто - истончение волос, алопеция; нечасто - крапивница, васкулит, пурпура (Шенлейна-Геноха), мультиформная эритема; 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 больной находится в сознании. Может быть проведен диализ. Рекомендуются общая поддерживающая терапия, наблюдение за больным и контроль функций жизненно важных органов и систем.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Исследования по лекарственному взаимодействию с феназоном 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 должны быть начаты лечение или профилактика остеопороза под тщательным наблюдением за состоянием пациентки. На настоящий момент отсутствуют достаточные данные относительно положительного влияния бисфосфонатов на потерю минеральной плотности костей, 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 10 таблеток в блистере ПВДХ/А1.

По 3 или 6 блистеров с инструкцией по применению в пачке из картона.

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, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

«Хетеро Драг Лимитед»

22-110,1.D.A., Джидиметла, Хайдарабад-500055, Индия

Юридический адрес производителя

«Хетеро Драге Лимитед»

7-2-A2, Индастриал Эстэйтс, Санас Нагар,

Хайдарабад-500 018, Андхра Прадеш, Индия

Претензии потребителей направлять в адрес Московского Представительства «Хетеро Драге Лимитед» (Индия):

119602, Россия, г.Москва, ул. Никулинская, д. 27, корп. 2 Телефон/факс: +(495) 937 85 02