

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-003206-180920
СОГЛАСОВАНО

по медицинскому применению лекарственного препарата

Анастрозол

Регистрационный номер: ЛП-003206 от 17.09.2015

Торговое наименование препарата: Анастрозол

Международное непатентованное или группировочное наименование: Анастрозол

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

активное вещество: анастрозол 1,051* мг.

вспомогательные вещества: лактозы безводной 15,00 мг, микрокристаллическая целлюлоза 63,46 мг, кросповидон 3,99 мг, карбоксиметилкрахмал натрия 2,01 мг, магния стеарат 1,51 мг.

состав пленочной оболочки: гипромеллоза 1,196 мг, макрогол 0,598 мг, тальк 0,598 мг, титана диоксид 0,598 мг.

*в процессе производства закладывается 5,1 % избыток анастрозола с целью компенсации возможных потерь.

Описание: Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На поперечном разрезе ядро белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противоопухолевое средство, ингибитор синтеза эстрогенов.

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

Анастрозол не обладает прогестогенной, андрогенной и эстрогенной активностью. Анастрозол в суточных дозах до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и

альдостерона, следовательно, при применении анастрозола не требуется заместительного введения кортикостероидов.

Фармакокинетика. Всасывание анастрозола быстрое, максимальная концентрация в плазме достигается примерно 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 анастрозола. 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. Фармакокинетика анастрозола у детей не изучалась. Связь с белками плазмы крови - 40%. Анастрозол выводится медленно, период полувыведения из плазмы составляет около 40-50 часов. Экстенсивно метаболизируется у женщин в постменопаузе. Менее 10% дозы выделяется почками в неизменном виде в течение 72 часов после приема препарата. Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием, гидроксилированием и глюкуронизацией. Метаболиты выводятся преимущественно почками. Триазол, основной метаболит, определяемый в плазме, не ингибирует ароматазу. 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, 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 составным частям препарата;
- Беременность и период кормления грудью;
- У женщин в пременопаузе;
- Почечная недостаточность тяжелой степени тяжести (клиренс креатинина менее 20 мл/мин);

- Печеночная недостаточность тяжелой степени тяжести (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, непереносимость галактозы, недостаточность лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в лекарственной форме препарата содержится лактоза).

Применение при беременности и в период кормления грудью

Применение при беременности и в период кормления грудью противопоказано.

Способ применения и дозы

Внутрь. Проглотить таблетку целиком, запивая водой. Рекомендуется принимать препарат в одно и то же 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: пациенткам с почечной недостаточностью легкой и средней степени тяжести не требуется коррекция дозы.

Нарушения функции печени: пациенткам с печеночной недостаточностью легкой степени тяжести не требуется коррекция дозы.

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 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 половых органов и молочной железы: часто - сухость слизистой оболочки влагалища, влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или смены 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, анафилактоидная реакция, кожный васкулит (включая отдельные случаи пурпуры (синдром Шенлейна-Геноха)), очень редко – 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 щелочной фосфатазы, аланин аминотрансферазы, аспартат аминотрансферазы; нечасто – повышения 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), нарушения чувствительности (в том числе, парестезия, потеря или извращение вкусовых ощущений).

Со стороны обмена веществ и питания: 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.

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

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. Рекомендуется общая поддерживающая терапия, наблюдение за больным и контроль функции 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 приёме 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

Безопасность и эффективность у детей не установлена.

У женщин с рецептороотрицательной опухолью к эстрогенам эффективность анастрозола 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 анастрозола у пациентов с печеночной недостаточностью тяжелой степени тяжести или у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени тяжести (клиренс креатинина менее 20 мл/мин).

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

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

Снижая концентрацию циркулирующего эстрадиола, анастрозол может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани.

У пациенток с остеопорозом или имеющих риск развития остеопороза, минеральная плотность костной ткани должна оцениваться методом денситометрии (например, DEXA сканированием) 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 (лютеинизирующего гормона рилизинг-гормона). Неизвестно, улучшает ли анастрозол результаты лечения при совместном использовании с химиотерапией.

Данные по безопасности при длительном лечении анастрозолом пока не получены.

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

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Некоторые побочные действия анастрозола, такие как астения, головная боль, головокружение, нарушение сна, 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.

Первичная упаковка лекарственного препарата

По 7 или 10 таблеток, покрытый пленочной оболочкой в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 7, 14, 28, 30, 60 или 100 таблеток, покрытых пленочной оболочкой в банку полимерную из полиэтилена с крышкой натягиваемой с контролем первого вскрытия. Свободное пространство заполняют ватой медицинской. На банку наклеивают этикетку из бумаги этикеточной или писчей или из полимерных материалов, самоклеющуюся.

Вторичная упаковка лекарственного препарата

По 1, 2, 3, 4, 6 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона подгрупп хромовый или хром-эрзац или другого аналогичного качества. Пачки помещают в групповую упаковку.

Банки вместе с равным количеством инструкций по применению помещают в групповую упаковку – короб из гофрированного картона (для стационаров).

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения:

АО «Фармасинтез-Норд», Россия

Юридический адрес: 194356, г. Санкт-Петербург, дорога в Каменку, д. 74, пом. 1-Н.

тел. +7 (812) 240-45-15

Производитель

АО «Фармасинтез-Норд», Россия

Юридический адрес: 194356, г. Санкт-Петербург, дорога в Каменку, д. 74, пом. 1-Н,

Тел.: +7 (812) 240-45-15

Адрес производственной площадки: г. Санкт-Петербург, дорога в Каменку, д. 74, лит. А.

Организация, принимающая претензии:

АО «Фармасинтез-Норд», Россия, г. Санкт-Петербург, дорога в Каменку, д. 74, лит. А.

Тел: 8-800-100-1550, www.pharmasyntez.com

Представитель АО «ФАРМАСИНТЕЗ-НОРД»



Малых Н.Ю.