

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ЕСТРАМОН 50

Склад:

діюча речовина: естрадіол (17-бета-естрадіол) 50 мкг/24 год;

1 трансдермальний пластир розміром 20 см² містить естрадіолу хемігідрату 4,13 мг в перерахуванні на естрадіол 4 мг, що відповідає добовій дозі в середньому 50 мкг;

допоміжні речовини: d- α -токоферол концентрат, сополімер акриловий, фольга Pegoterat.

Лікарська форма.

Пластир трансдермальний.

Фармакотерапевтична група.

Гормони статевих залоз і препарати, які застосовують при патології статевої сфери.

Код АТС G03C A03.

Клінічні характеристики.

Показання.

Клімактеричний синдром, захворювання, обумовлені дефіцитом естрогенів, інволютивні зміни статевих органів і сечових шляхів, замісна терапія після оваріоектомії, профілактика остеопорозу в постменопаузі.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до естрадіолу або до будь-якого з наповнювачів. Діагностований або попередній рак молочної залози або ймовірний рак молочної залози; діагностована або ймовірна естрогензалежна злоякісна пухлина (особливо карцинома ендометрія); піхвова кровотеча нез'ясованого генезу; нелікована гіперплазія ендометрія; наявність в анамнезі ідіопатичної жовтухи або тромбоемболічних захворювань вен (особливо тромбоз глибоких вен, легенева емболія); активні або тромбоемболічні захворювання артерій (особливо стенокардія, інфаркт міокарда); тяжкі захворювання печінки (синдроми Дубіна-Джонсона, Ротора); порфірія; період вагітності та лактації.

Спосіб застосування та дози.

1 трансдермальний пластир слід наклеювати на шкіру з інтервалом 3 - 4 дні, у середньому по 2 пластиря на тиждень.

Лікування слід починати з призначення трансдермального пластиру із середнім дозуванням (Естрамон 50). Якщо при застосуванні Естрамону 50 супутні клімактеричні скарги не зникають, дозу препарату збільшують вдвічі.

Спосіб застосування.

1. Безпосередньо перед застосуванням необхідно відірвати захисну оболонку пакетика, розрізавши його ближче до краю і вийняти пластир, не пошкоджуючи його.
2. Пластир слід обережно згинати вздовж перфорації догори і донизу, доки більша частина захисної плівки не відділиться вздовж перфорованої смуги від клейкої поверхні трансдермального пластиру. Ця частина захисної плівки знімається за один з отриманих кінчиків.
3. Відкриту клейку поверхню пластиру накладають на здорову, очищену шкіру зовнішньої поверхні стегна.
4. Потім опуклу частину трансдермального пластиру злегка піднімають так, щоб залишок захисної плівки можна було б видалити, і закріплюють повністю.
5. Після повної фіксації пластиру його необхідно притиснути рукою протягом 10 сек.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

При використанні кожного нового пластиру необхідно міняти місце аплікації.

Пластир не можна накладати на груди.

Слід запобігати будь-якого дотикання клейкої поверхні.

Безпосередньо перед аплікацією ділянку шкіри слід знежирити.

Пластир слід захищати від прямого сонячного світла.

Трансдермальний пластир добре прилипає до шкіри, і його функція гарантована навіть при прийманні ванни, душа або під час фізичної роботи. Якщо пластир відділився від шкіри у гарячій воді, слід використати новий пластир.

Тривалість лікування.

Пластир застосовується циклічно: після 3 тижнів застосування – 1 тиждень перерви.

Жінкам після гістеректомії або у разі, коли симптоми дефіциту естрогенів інтенсивно рецидивують протягом вільного від лікування періоду, може призначатися безперервне, нециклічне лікування.

Терапію естрогенами слід доповнювати регулярним застосуванням гестагенів. Гестагени повинні застосовуватися протягом останніх 12 - 14 днів терапії естрадіолом, потім слід робити перерву на 1 тиждень.

Побічні реакції.

Найбільш поширені побічні явища: гіперемія та подразнення шкіри, свербіж у місці аплікації; головний біль, набухання молочних залоз.

Психічні розлади: часто – депресія.

З боку центральної нервової системи: дуже часто – головний біль; часто – роздратованість, зміна настрою, безсоння; у поодиноких випадках – мігрень, запаморочення, порушення лібідо, парестезії.

Судинні порушення: у поодиноких випадках – гіпертензія, тромбоемболія вен.

Шлунково-кишкові розлади: часто – нудота, диспепсія, діарея, біль у животі, відчуття переповнення шлунка; у поодиноких випадках – блювання, захворювання жовчного міхура, жовчні камені.

Шкіра і підшкірні тканини: дуже часто – еритема, свербіж; часто – реакція у місці аплікації, прищі, екзантема, свербіж, сухість шкіри; у поодиноких випадках – знебарвлення шкіри.

Скелетно-м'язові порушення: у поодиноких випадках – міастенія.

Ендокринний та гінекологічний статус: дуже часто – набухання молочних залоз і біль, дисменорея, порушення менструального циклу; часто – збільшення молочних залоз, менорагія, нерегулярні піхвові кровотечі, спазм матки, вагініт, гіперплазія ендометрія; у поодиноких випадках – мастопатія, лейоміома матки, паратрубчасті кісти, поліпи шийки матки.

Загальні порушення: часто – біль, дорсалгія, астенія, периферичний набряк, зміна маси тіла; у поодиноких випадках – алергічні реакції.

Лабораторні показники: у поодиноких випадках – підвищення рівня трансаміназ.

Передозування.

Випадки гострої інтоксикації при застосуванні трансдермального пластиру не описані. Ознаками передозування можуть бути набухання молочних залоз, піхвові кровотечі, затримка рідини або метеоризм. При підозрі на передозування необхідно зняти пластир (після чого концентрація естрадіолу в сироватці крові знижується протягом 24 год) та звернутися до лікаря.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Естрамон не показаний у період вагітності. Якщо вагітність настає під час лікування естрамоном, лікування слід негайно припинити. Результати більшості епідеміологічних досліджень не показали ніякої тератогенної дії. Естрамон не показаний у період лактації.

Діти.

Естрамон не показаний дітям.

Особливості застосування.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Препарат можна застосовувати тільки після ретельного обстеження і співставлення можливих негативних наслідків з очікуваним клінічним ефектом при бронхіальній астмі, епілепсії, серцевій недостатності, тяжкій артеріальній гіпертензії, порушенні функції печінки/нирок, розсіяному склерозі, порфірії, тетанії, тромбоемболічних ускладненнях, оскільки їх перебіг може погіршатися під час застосування естрогенів.

Жінки повинні повідомляти лікарю про будь-які зміни у молочних залозах.

Стани, при яких необхідне ретельне спостереження: лейоміома (фіброзні зміни матки) або ендометріоз, тромбоемболія в анамнезі, фактори ризику розвитку естрогензалежних пухлин (спадковість I ступеня рака молочної залози), гіпертензія, захворювання печінки (аденома печінки), цукровий діабет, холелітіаз, мігрень або сильний головний біль, системний еритематозний вовчак, гіперплазія ендометрія в анамнезі, епілепсія, астма, отосклероз.

Слід негайно відмінити препарат при появі жовтухи або погіршенні функції печінки, при різкому підвищенні артеріального тиску, нападу мігреноподібного головного болю, вагітності.

Замісна гормональна терапія, особливо комбіноване лікування естрогенами і гестагенами, призводить до підвищення щільності мамографічних зображень, що може негативно впливати на радіологічне виявлення рака молочної залози.

Естрогени можуть спричинити затримку рідини, тому слід ретельно спостерігати за пацієнтами з серцевими або нирковими дисфункціями. Також слід контролювати пацієнтів з термінальною нефропатією, оскільки може очікуватися збільшення рівня естрадіолу в крові.

У жінок зі спадковою гіпертригліцеридемією, які приймають естрогени, були описані поодинокі випадки суттєвого підвищення рівня тригліцеридів в плазмі, що призводить до панкреатиту та інших ускладнень.

- Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

Під час лікування необхідно дотримуватися обережності при керуванні автотранспортом і при інших потенційно небезпечних видах діяльності, що потребують підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші форми взаємодій.

Естрадіол стимулює синтез тироксину і кортикостероїдв'язуючого глобуліну.

Індуктори печінкових ферментів (барбітурати, карбамазепін, мепробамат, фенілбутазон, ампіцилін і рифампіцин) знижують рівень естрадіолу і його ефект при пероральному застосуванні. Наявність подібної взаємодії при трансдермальному застосуванні естрадіолу не встановлена.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Трансдермальна система, яка містить естрадіол (17-бета-естра-1,3,5(10)-тривен-3,17-діол) – активний естроген. Естрадіол утворюється в організмі у зрілих фолікулах яєчників, жовтому тілі і плаценті. Зв'язуючись з естрогеновими рецепторами в органах-мішенях, естрадіол регулює метаболічні процеси і спричиняє характерну для естрогенів фізіологічну дію: сприяє проліферації ендометрія, стимулює утворення і відторгнення слизової оболонки шийки матки, підвищує продукцію і знижує в'язкість цервікального слизу, стимулює формування молочних залоз. Естрогени підвищують проліферацію клітин епідермісу, синтез колагену і гіалуронової кислоти, що сприяє підтриманню еластичності шкіри і сполучної тканини, сприяє позаклітинному затриманню натрію і води, нормалізує обмін ліпідів за рахунок підвищення вмісту ліпопротеїдів високої щільності (ЛПВЩ), що сприяє профілактиці розвитку атеросклерозу.

Фармакокінетика. Застосування у вигляді трансдермальної системи забезпечує тривале і рівномірне надходження естрадіолу в організм. При застосуванні трансдермального пластиру концентрацію естрадіолу в крові можна контролювати, запобігаючи передозуванню.

У печінці метаболізується з утворенням естрону і його кон'югатів. Співвідношення концентрацій естрадіол/естрон у плазмі крові при застосуванні пластиру коливається у межах 0,2 - 0,5 : 1, що

відповідає фізіологічному відношенню. На відміну від лікарських форм для перорального прийому трансдермальне застосування естрадіолу дозволяє запобігти його інтенсивному метаболізму при первинному проходженні через печінку. Естрадіол виводиться з сечею у вигляді глюкуронідів або сульфатів. Екскреція регулярно збільшується під час аплікації і зменшується до вихідних величин протягом 2 - 3 днів після видалення пластиру.

Після аплікації трансдермального пластиру у шкіру вивільняється в середньому 50 мкг естрадіолу на день; він потрапляє у кровотік в незміненому вигляді шляхом трансдермального проникнення. Ці низькі дози активної речовини достатні – завдяки специфічному методу застосування – для досягнення фізіологічних концентрацій естрадіолу в плазмі крові вже через 4 - 6 год.

Максимальні концентрації естрадіолу 48 пг/мл досягаються після багаторазового застосування. Середня концентрація естрадіолу, яка домінує протягом 51 год, становить 34 пг/мл.

Ці величини відповідають відомим концентраціям у сироватці, які досягаються при застосуванні трансдермальної системи. Таким чином, концентрації естрадіолу підвищуються до величин, подібних до таких на ранній або середній стадії дозрівання фолікулів у жінок репродуктивного віку.

Якщо трансдермальний пластир змінюється через рівні інтервали, концентрації у сироватці залишаються у названому діапазоні, не зважаючи на короткий період напіввиведення естрадіолу (приблизно 1 год). Після видалення трансдермального пластиру вони знов зменшуються до вихідних величин вже у межах 24 год.

Фармацевтичні характеристики:

основні фізико-хімічні властивості: еліпсоподібний, матовий, безбарвний пластир на безбарвній захисній підкладці.

Несумісність. Не застосовується.

Термін придатності. Термін придатності становить 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 С.

Упаковка. По 1 трансдермальному пластиру в саше (пакетику); по 6 саше (пакетиків) у картонній упаковці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. “ТЕКСАЛ АГ”, Німеччина, компанія в складі “Сандоз”.

Місцезнаходження.

Індустріштрассе, 25

D-83607, Хольцкирхен, Німеччина.