

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ЕГІСТРОЗОЛ®
(Egistrozol)

Склад.

Діюча речовина: анастрозол;

1 таблетка містить 1 мг анастрозолу;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, натрію крохмальгліколят (типу А), повідон, магнію стеарат, макрогол 400, гіпромелоза, титану діоксид (Е 171).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Антинеопластичні та імуномодулюючі засоби. Інгібітори ферментів.
Код АТС L02B G03.

Клінічні характеристики.**Показання.**

Лікування розповсюдженого раку молочної залози у жінок в постменопаузі, за винятком пацієнток з естрогеннегативним раком, окрім випадків попередньо доведеної клінічної ефективності застосування тамоксифену.

Ад'ювантна терапія ранньої стадії інвазивного естрогенпозитивного раку молочної залози у жінок в період постменопаузи.

Ад'ювантна терапія початкової стадії естрогенпозитивного раку молочної залози у жінок в період постменопаузи, які протягом 2-3 років отримували тамоксифен як допоміжний засіб.

Протипоказання.

Егістрозол протипоказаний:

- жінкам у пременопаузі;
- в період вагітності і годування груддю;
- пацієнткам з тяжкими порушеннями функції нирок (кліренс креатиніну нижче 20 мл/хв);
- пацієнткам при печінковій недостатності;
- при відомій підвищеній чутливості до анастрозолу або будь-яких інших інгредієнтів, що входить до складу препарату.

Спосіб застосування та дози.

Препарат приймають внутрішньо.

Рекомендована доза для дорослих, включаючи осіб літнього віку, 1 таблетка (1 мг)

1 раз на добу щоденно. Тривалість курсу лікування залежить від форми та тяжкості захворювання.

Рекомендована тривалість лікування початкової стадії захворювання повинна становити 5 років.

Побічні реакції.

Препарат загалом добре переноситься. Побічні явища були переважно легкими або помірними.

Побічні реакції класифікувалися за частотою виникнення: дуже часто (> 1/10), часто (> 1/100 < 1/10), нечасто (> 1/1.000 < 1/100), рідко (> 1/10.000 < 1/1.000), дуже рідко (< 1/10.000).

З боку нервової системи: часто - головний біль, синдром каналу зап'ястя; нечасто - сонливість.

Шлунково-кишкові розлади: часто – нудота і діарея; нечасто – блювання.

З боку шкіри та підшкірних тканин: часто – стоншення волосся, висип; дуже рідко – мультиформна

еритема, синдром Стівенса-Джонсона, алергічні реакції, включаючи набряк Квінке, кропив'янку, анафілаксію.

З боку скелетно-м'язової системи та сполучної тканини: часто – біль у суглобах/туго- рухливість суглобів.

Оскільки анастрозол знижує рівні естрогенів у крові, це може призвести до зменшення щільності кісток у деяких пацієнтів з високим ризиком переломів.

Метаболічні порушення: нечасто – анорексія, гіперхолестеринемія.

Судинні порушення: дуже часто – припливи крові до обличчя.

Загальні порушення: часто - астенія.

З боку гепатобіліарної системи: часто – підвищення лужної фосфатази, аланін- амінотрансферази, аспартатамінотрансферази; нечасто – підвищення рівня гаммаглутамілтранспептидази (гамма-ГТ) та білірубину, гепатити. Причинний зв'язок цих реакцій не був встановлений.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз: часто – сухість піхви; нечасто – вагінальна кровотеча.

Про вагінальні кровотечі повідомлялося не часто, головним чином у пацієнтів з розповсюдженим раком молочної залози протягом перших декількох тижнів після переходу з гормональної терапії на терапію анастрозолом.

Передозування.

Випадки передозування у людей не описані. Разова доза анастрозолу, яка б призводила до симптомів, загрозливих для життя, не була встановлена.

Лікування. Не існує специфічного антидоту при передозуванні анастрозолу, лікування повинно бути симптоматичним. При лікуванні передозування слід з'ясувати, чи приймав хворий інший препарат або декілька препаратів. Всмоктування препарату можна усунути промиванням шлунка та призначенням активованого вугілля. Діаліз також може бути корисним, оскільки препарат слабо зв'язується з білками плазми. При передозуванні також рекомендується проведення загальної підтримуючої терапії, пильне спостереження за хворим і контроль функції життєво важливих органів та систем.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування анастрозолу протипоказано у період вагітності або годування груддю.

Діти.

Егістрозол не рекомендується призначати дітям.

Особливості застосування.

У будь-якої пацієнтки, де є сумніви щодо гормонального статусу, менопауза повинна бути підтверджена біохімічним методом.

Дані стосовно безпеки застосування Егістрозолу у пацієнтів з помірними та тяжкими порушеннями функції печінки або пацієнтів з тяжкими порушеннями ниркової функції (кліренс креатиніну нижче 20 мл/хв) відсутні.

Жінкам з остеопорозом або ризиком розвитку остеопорозу слід визначати щільність мінералів кісток за допомогою денситометра (наприклад, DEXA) на початку лікування, а також регулярно після його завершення. Лікування і профілактику остеопорозу слід проводити під пильним контролем лікаря.

Егістрозол містить лактозу. Пацієнти зі спадковою непереносимістю галактози, дефіцитом лактази Лаппа або мальабсорбцією глюкозо-галактози не повинні застосовувати цей препарат.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами

При застосуванні анастрозолу у чутливих хворих можуть виникнути побічні реакції (астенія або сонливість), тому цим пацієнткам на час прийому препарату слід утриматися від керування

транспортними засобами та роботи зі складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Клінічні дослідження лікарської взаємодії анастрозолу з варфарином свідчать про те, що анастрозол в дозі 1 мг лише незначною мірою пригнічує метаболізм речовин, які метаболізуються за допомогою системи цитохрому P450.

Клінічно значущої взаємодії анастрозолу і біфосфонатів не спостерігалось.

При сумісному застосуванні анастрозолу з тамоксифеном фармакологічна дія анастрозолу може зменшуватися, тому слід уникати такої комбінації препаратів.

Тамоксифен не слід призначати разом з анастрозолом, оскільки він може послабити фармакологічну дію останнього.

Естрогени не повинні призначатися одночасно з анастрозолом, оскільки ці препарати мають протилежну фармакологічну дію.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Анастрозол є потужним і високоселективним нестероїдним інгібітором ароматази. У жінок у постменопаузі естрадіол утворюється переважно шляхом перетворення андростендіону в естрон за участі ферменту ароматази в периферичних тканинах. Потім естрон перетворюється в естрадіол. Зниження рівня циркулюючого естрадіолу під впливом анастрозолу сприятливо впливає на стан жінок з раком молочної залози.

Анастрозол у добовій дозі 1 мг знижує рівень естрадіолу на 80%, у добовій дозі до 10 мг не впливає на секрецію кортизону і альдостерону, тому непотрібно проводити замісну терапію кортикостероїдами. Препарат не має прогестагенної, андрогенної чи естрогенної активності.

Фармакокінетика.

Фармакокінетика анастрозолу у жінок у постменопаузі не залежить від віку.

Всмоктування. Після прийому внутрішньо препарат швидко всмоктується у шлунково-кишковому тракті. Максимальна концентрація в плазмі крові досягається протягом 2 годин (за умов застосування натщесерце). Одночасний прийом з їжею деякою мірою зменшує швидкість, але не ступінь всмоктування анастрозолу. Незначна зміна швидкості всмоктування препарату не призводила до клінічно значущого впливу на рівноважну концентрацію анастрозолу в плазмі при застосуванні препарату в дозі 1 мг один раз на добу. Майже 90 - 95 % рівноважної концентрації анастрозолу в плазмі досягається після 7-денного застосування анастрозолу. Ознаки залежності фармакокінетичних параметрів анастрозолу від часу або дози відсутні.

Розподіл. Зв'язування анастрозолу з білками плазми крові становить 40%.

Метаболізм. Менше 10 % дози препарату виводиться у незмінному стані з сечею протягом 72 годин.

Метаболізм анастрозолу здійснюється шляхом N-деалкілювання, гідроксилювання і глюкуронізації.

Його метаболіти виводяться головним чином із сечею. Триазол, головний метаболіт, що визначається у плазмі та сечі, не пригнічує ароматазу.

Виведення. Анастрозол виводиться повільно. Період напіввиведення становить 40–50 годин.

Уявний кліренс анастрозолу після перорального прийому у добровольців зі стійким цирозом печінки або порушенням функції нирок не відрізнявся від кліренсу, який визначався у здорових добровольців.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості:

круглі, двоопуклі таблетки, вкриті оболонкою, білого кольору, з маркуванням “ANA” та "1" на одному боці.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 30 °C у недоступному для дітей місці.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Упаковка. Таблетки № 28 (14x2), № 30(10x3), № 90 (10x9) у блістерах у картонній упаковці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ВАТ Фармацевтичний завод ЕГІС.

Місцезнаходження. EGIS Pharmaceuticals PLC.
1106 Budapest, Kereszturi ut 30-38,
HUNGARY.