

Состав и форма выпуска

Таблетки, покрытые оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, на одной стороне с гравировкой "A", на другой стороне - "Adx" и "1" в виде дробы.

Активное вещество: Анастрозол 1 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, повидон, карбоксиметилкрахмал натрия, магния стеарат, вода очищенная.

Состав оболочки: макрогол 300, гипромеллоза, титана диоксид, вода очищенная.

Фармакологическое действие

Высокоселективный нестероидный ингибитор ароматазы. Ароматаза - фермент, при помощи которого у женщин в постменопаузе андростендион в периферических тканях превращается в эстрон и далее в эстрадиол. Снижение уровня циркулирующего эстрадиола оказывает терапевтический эффект у больных раком молочной железы. В постменопаузе препарат в суточной дозе 1 мг вызывает снижение уровня эстрадиола на 80%.

Аримидекс не обладает прогестагенной, андрогенной и эстрогенной активностью.

Аримидекс в суточной дозе до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и альдостерона (следовательно, при применении препарата не требуется заместительного введения кортикостероидов).

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь анастрозол быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается в течение 2 ч (натощак). Пища несколько уменьшает скорость, но не степень всасывания. Небольшие изменения скорости всасывания не приводят к клинически значимому влиянию на C_{ss} препарата в плазме при ежедневном приеме 1 таб. Аримидекса.

Распределение

Анастрозол связывается с белками плазмы на 40%. Приблизительно 90-95% от C_{ss} достигается после 7 дней приема препарата. Нет сведений о кумуляции препарата и зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени и дозы.

Метаболизм

Анастрозол метаболизируется путем N-деалкилирования, гидроксилирования и

глюкуронизации. Триазол, основной метаболит, определяемый в плазме, не ингибирует ароматазу.

Выведение

Анастрозол выводится медленно, $T_{1/2}$ - 40-50 ч.

Анастрозол и его метаболиты выводятся, в основном, с мочой (менее 10% выведенной дозы - в неизмененном виде), в течение 72 ч после приема препарата.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Определяемый клиренс анастрозола после перорального приема у добровольцев со стабилизированным циррозом печени или нарушением функции почек не отличается от клиренса, определяемого у здоровых добровольцев.

Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста у женщин в постменопаузе.

Показания препарата Аримидекс

- адъювантная терапия раннего гормоноположительного рака молочной железы у женщин 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.

Режим дозирования

Взрослым, включая пожилых пациентов, препарат назначают по 1 мг внутрь 1 раз/сут, длительно. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить. В качестве адъювантной терапии рекомендуемая продолжительность лечения - 5 лет.

Пациентам с легкими и умеренно выраженными нарушениями функции почек не требуется коррекции дозы.

Пациентам с легкими нарушениями функции печени не требуется коррекции дозы.

Таблетку следует проглотить целиком и запить водой. Рекомендуется принимать препарат в одно и то же время суток.

Побочное действие

Определение частоты побочных реакций: очень часто (>10%); часто (1-10%); редко (0.1-1%); очень редко (<0.1%).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - приливы.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - артралгия.

Со стороны репродуктивной системы: часто - сухость влагалища; редко - влагалищные

кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или смены предшествующей гормональной терапии на Аримидекс).

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, диарея; редко - анорексия, рвота, увеличение активности ГГТ и ЩФ.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль, синдром запястного канала (в основном наблюдался у пациенток с факторами риска к данному заболеванию); редко - сонливость.

Со стороны обмена веществ: редко - гиперхолестеринемия. Прием препарата может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани в связи со снижением уровня циркулирующего эстрадиола, тем самым, повышая риск возникновения остеопороза и переломов костей.

Дерматологические реакции: часто - истончение волос, кожная сыпь; очень редко - многоформная эритема (синдром Стивенса-Джонсона).

Аллергические реакции: очень редко - ангионевротический отек, крапивница, анафилактический шок.

Прочие: часто - астения.

Противопоказания к применению

- почечная недостаточность тяжелой степени (клиренс креатинина менее 20 мл/мин);
- печеночная недостаточность средней и тяжелой степени (безопасность и эффективность не установлены);
- сопутствующая терапия тамоксифеном;
- детский возраст (безопасность и эффективность не установлены);
- беременность;
- лактация (грудное вскармливание);
- повышенная чувствительность к анастрозолу и другим компонентам препарата.

Препарат не назначают женщинам в менопаузе.

Применение при беременности и кормлении грудью

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Применение при нарушениях функции печени

Пациентам с легкими нарушениями функции печени не требуется коррекции дозы.

Противопоказан при умеренной или выраженной печеночной недостаточности (безопасность и эффективность не установлены).

Применение при нарушениях функции почек

Пациентам с легкими и умеренно выраженными нарушениями функции почек не требуется коррекции дозы.

Противопоказан при почечной недостаточности тяжелой степени (клиренс креатинина менее 20 мл/мин).

Применение у детей

Препарат противопоказан к применению у детей (безопасность и эффективность не установлены).

Особые указания

У женщин с рецептор-отрицательной опухолью к эстрогенам эффективность Аримидекса 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 безопасности применения Аримидекса у пациентов с выраженными нарушениями функции печени или у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 20 мл/мин).

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

Препараты, содержащие эстрогены, не следует назначать одновременно с Аримидексом.

Снижая уровень циркулирующего эстрадиола, Аримидекс может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани.

У пациенток с остеопорозом или с риском 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 ГнРГ.

Неизвестно, улучшает ли анастрозол результаты лечения при совместном использовании с химиотерапией.

Данные по безопасности при длительном лечении анастрозолом пока не получены.

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

Эффективность и безопасность Аримидекса 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.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения препарата у детей не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Некоторые побочные эффекты Аримидекса, такие как астения и сонливость, могут отрицательно влиять на способность к выполнению работы, требующей повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В связи с этим рекомендуется при появлении этих симптомов соблюдать осторожность при управлении автомобилем или движущимися механизмами.

Передозировка

Описаны единичные клинические случаи передозировки препарата. Разовая доза Аримидекса, при которой развиваются угрожающие жизни симптомы, не установлена.

Лечение: специфического антидота не существует. При необходимости проводят симптоматическую терапию: индуцирование рвоты (если больной в сознании), общая поддерживающая терапия, наблюдение за больным и контроль за функцией жизненно важных органов и систем. Возможно проведение диализа.

Лекарственное взаимодействие

Клинические исследования по лекарственному взаимодействию с антипиринном и циметидином указывают на то, что совместное введение Аримидекса с другими препаратами вряд ли приведет к клинически значимому взаимодействию, обусловленному цитохромом P450.

Клинически значимое лекарственное взаимодействие при приеме Аримидекса одновременно с другими часто назначаемыми препаратами отсутствует.

На данный момент нет сведений о применении Аримидекса в комбинации с другими противоопухолевыми препаратами.

Препараты, содержащие эстрогены, не следует назначать одновременно с Аримидексом, т.к. они уменьшают фармакологическое действие последнего.

Не следует назначать тамоксифен одновременно с Аримидексом, поскольку он может ослабить фармакологическое действие последнего.

Условия хранения

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности

5 лет.

Условия реализации

Препарат отпускается по рецепту.