

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

АРИМИДЕКС® (ARIMIDEX®)

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер: П N013285/01

Торговое название препарата: Аримидекс®

Международное непатентованное название: анастрозол (anastrozole)

Лекарственная форма: таблетки, покрытые плёночной оболочкой

Состав

1 таблетка, покрытая плёночной оболочкой, содержит:

активное вещество: анастрозол 1,0 мг

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 93,0 мг, повидон 2,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия 3,0 мг, магния стеарат 1,0 мг

состав плёночной оболочки: гипромеллоза 1,50 мг, макрогол 300 0,30 мг, титана диоксид 0,45 мг

Описание

Круглые, двояковыпуклые таблетки белого цвета, покрытые плёночной оболочкой; с гравировкой А – на одной стороне и Adx _I на другой.

Фармакотерапевтическая группа: противоопухолевое средство, эстрогенов синтеза ингибитор.

Код АТХ: L02BG03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Аримидекс® 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 Аримидекс® в суточной дозе 1 мг вызывает снижение уровня эстрадиола на 80%.

Аримидекс® не обладает прогестогенной, андрогенной и эстрогенной активностью.

Аримидекс® в суточных дозах до 10 мг не оказывает эффекта на секрецию кортизола и альдостерона, следовательно, при применении препарата Аримидекс® не требуется заместительного введения кортикостероидов.

Влияние на минеральную плотность костной ткани

Показано, что у пациенток с гормоночувствительным ранним раком молочной железы в постменопаузе, которые принимают Аримидекс®, изменения костной системы могут быть предупреждены в соответствии со стандартами, установленными для лечения пациенток с определенным риском переломов. Так, преимущество препарата Аримидекс® в комбинации с бисфосфонатами (по сравнению с терапией только препаратом Аримидекс®) у пациентов со средним и высоким риском возникновения переломов было продемонстрировано уже через 12 месяцев по показателям минеральной костной плотности, структурного изменения костной ткани и маркерам костной резорбции. Более того, в группе низкого риска не было отмечено изменения показателя минеральной костной плотности на фоне терапии одним препаратом Аримидекс® и поддерживающего лечения витамином D и кальцием.

Липиды

При терапии препаратом Аримидекс®, в том числе, при приеме в комбинации с бисфосфонатами, не выявлено изменений уровня липидов в плазме.

Фармакокинетика

Всасывание анастрозола быстрое, максимальная концентрация в плазме 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 при однократном приеме суточной дозы препарата Аримидекс®. 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.

Связь с белками плазмы крови – 40%.

Анастрозол выводится медленно, период полувыведения из плазмы составляет 40-50 часов. Экстенсивно метаболизируется у женщин в постменопаузе. Менее 10% дозы выделяется с мочой в неизмененном виде в течение 72 часов после приема препарата. Метаболизм анастрозола осуществляется N-деалкилированием, гидроксильрованием и глюкуронизацией. Метаболиты выводятся преимущественно с мочой. Триазол, основной метаболит, определяемый в плазме, не ингибирует ароматазу.

Клиренс анастрозола после перорального приема при циррозе печени или нарушении функции почек не изменяется.

Показания

- 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
- Выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 20 мл/мин)
- Умеренная или выраженная печеночная недостаточность (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, нарушение функции печени, недостаточность лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Способ применения и дозы

Внутрь. Проглотить таблетку целиком, запивая водой. Рекомендуется принимать препарат в одно и тоже 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: корректировка дозы у пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции почек не требуется.

Нарушения функции печени: корректировка дозы у пациентов с легкой степенью нарушения функции печени не требуется.

Побочное действие

Частота встречаемости была рассчитана из числа нежелательных явлений, наблюдаемых в рамках III фазы исследования у 9366 женщин с операбельным раком молочной железы в постменопаузе, получавших лечение в течение 5 лет, при этом частота нежелательных явлений в группах сравнения и мнение исследователя относительно зависимости нежелательного явления от исследуемого препарата не учтены.

Определение частоты побочных реакций: очень часто (более или равно 10%); часто (от 1 до менее 10%); нечасто (от 0,1 до менее 1%); редко (от 0,01 до менее 0,1%); очень редко (менее 0,01%).

Со стороны сосудов:

очень часто – «приливы».

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 Аримидекс®).

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 – повышение 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 вызывать 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 лёгкой или умеренной степени выраженности.

Нежелательные явления, отмеченные в ходе клинических исследований, не связанные с приемом препарата Аримидекс®: 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 препарата Аримидекс[®], 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 и другие виды лекарственного взаимодействия

Исследования по лекарственному взаимодействию с феназоном (антипирином) и циметидином указывают на то, что совместное применение препарата Аримидекс[®] с другими препаратами вряд ли приведет к клинически значимому лекарственному взаимодействию, опосредованному цитохромом P450.

Клинически значимое лекарственное взаимодействие при приёме препарата Аримидекс[®] одновременно с другими часто назначаемыми препаратами отсутствует.

На данный момент нет сведений о применении препарата Аримидекс[®] в комбинации с другими противоопухолевыми препаратами.

Препараты, содержащие эстрогены, уменьшают фармакологическое действие препарата Аримидекс[®], в связи с чем, они не должны назначаться одновременно с препаратом Аримидекс[®].

Не следует назначать тамоксифен одновременно с препаратом Аримидекс[®], поскольку он может ослабить фармакологическое действие последнего.

Особые указания

Безопасность и эффективность у детей не установлена.

У женщин с рецептороотрицательной опухолью к эстрогенам эффективность препарата Аримидекс® 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 препарата Аримидекс® у пациентов с умеренной или выраженной печеночной недостаточностью и у пациентов с выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 20 мл/мин).

В случае сохраняющегося маточного кровотечения на фоне приема препарата Аримидекс® необходима консультация и наблюдение гинеколога.

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

Снижая уровень циркулирующего эстрадиола, Аримидекс® может вызывать снижение минеральной плотности костной ткани с последующим повышением риска перелома. Пациентки с таким высоким риском подлежат лечению соответственно руководству по терапии данных осложнений.

У пациенток, страдающих остеопорозом или имеющих риск развития остеопороза, минеральная плотность костной ткани должна оцениваться методом денситометрии, например, DEXA сканированием (Dual-Energy X-ray Absorptiometry – двухэнергетической рентгеновской абсорбциометрией), 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.

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

Данные по безопасности при длительном лечении анастрозолом пока не получены.

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

Эффективность и безопасность препарата Аримидекс® 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 автомобилем и другими механизмами

Некоторые побочные действия препарата Аримидекс®, 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 плёночной оболочкой, по 1 мг. 14 таблеток в блистере из Ал/ПВХ; по 2 блистера с инструкцией по применению в картонной пачке с контролем первого вскрытия.

Условия хранения

При температуре не выше 30 °С, в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Наименование и юридический адрес держателя (владельца) регистрационного удостоверения

АстраЗенека ЮК Лимитед, 1 Френсис Крик Авеню, Кембридж Биомедикал Кампус, Кембридж, Великобритания CB2 0AA

AstraZeneca UK Limited, 1 Francis Crick Avenue, Cambridge Biomedical Campus, Cambridge, United Kingdom CB2 0AA

Производитель

АстраЗенека Фармасьютикалс ЛП, 587 Олд Балтимор Пайк, Ньюарк, Делавэр, 19702, США

AstraZeneca Pharmaceuticals LP, 587 Old Baltimore Pike, Newark, Delaware, 19702, USA

Фасовщик (первичная упаковка)

АстраЗенека ЮК Лимитед, Силк Роуд Бизнес Парк, Макклсфилд, Чешир SK 10 2NA, Великобритания

AstraZeneca UK Limited, Silk Road Business Park, Macclesfield, Cheshire SK 10 2NA, United Kingdom

Упаковщик (вторичная (потребительская) упаковка)

1. АстраЗенека ЮК Лимитед, Силк Роуд Бизнес Парк, Макклсфилд, Чешир SK 10 2NA, Великобритания

AstraZeneca UK Limited, Silk Road Business Park, Macclesfield, Cheshire SK 10 2NA, United Kingdom

2. ЗАО «ЗиО-Здоровье», Россия, 142103, Московская обл., г. Подольск, ул. Железнодорожная, 2

Выпускающий контроль качества

1. АстраЗенека ЮК Лимитед, Силк Роуд Бизнес Парк, Макклсфилд, Чешир SK 10 2NA, Великобритания

AstraZeneca UK Limited, Silk Road Business Park, Macclesfield, Cheshire SK 10 2NA, United Kingdom

2. АстраЗенека Фармасьютикалс ЛП, 587 Олд Балтимор Пайк, Ньюарк, Делавэр, 19702, США

AstraZeneca Pharmaceuticals LP, 587 Old Baltimore Pike, Newark, Delaware, 19702, USA

3. ЗАО «ЗиО-Здоровье», Россия, 142103, Московская обл., г. Подольск, ул. Железнодорожная, 2

Наименование, адрес организации, уполномоченной держателем или владельцем регистрационного удостоверения лекарственного препарата для медицинского применения на принятие претензий от потребителя:

Представительство АстраЗенека ЮК Лимитед, Великобритания, в г. Москве
и ООО АстраЗенека Фармасьютикалз
125284 Москва, ул. Беговая д.3, стр. 1

тел. +7495 7995699

факс +7495 7995698

Аримидекс – товарный знак, собственность группы компаний АстраЗенека.

© AstraZeneca 2009 – 2017