

Состав

действующее вещество: anastrozole;

1 таблетка содержит 1,0 мг анастрозола;

вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, натрия крахмала (тип А), магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, гидроксипропилметилцеллюлоза, Opadry II White (лактоза, гипромеллоза, титана диоксид (Е 171), полиэтиленгликоль).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: белые круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, без разделительной насечки, с тиснением А1 с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Ингибиторы ферментов. Код АТХ L02B G03.

Фармакодинамика

Анастрозол является мощным и высокоизбирательно нестероидным ингибитором ароматазы. У женщин в постменопаузе эстрадиол в основном продуцируется путем преобразования в периферических тканях андростендиона в эстрон с помощью фермента - ароматазы. Эстрон дальше превращается в эстрадиол. Снижение уровня эстрадиола оказывает терапевтический эффект у женщин, больных раком молочной железы. У женщин в постменопаузе прием анастрозола в суточной дозе 1 мг приводит к снижению уровня эстрадиола на 80%. Анастрозол не имеет прогестагенной и андрогенной активности.

Анастрозол в суточных дозах до 10 мг не действует на секрецию кортизола и альдостерона, измеренное до и после стандартного теста на стимуляцию АКТГ (АКТГ). Итак, заместительное введение кортикостероидов не нужно.

Фармакокинетика

Всасывания анастрозола быстрое, максимальная концентрация в плазме крови достигается в течение 2 часов (натощак). Анастрозол выводится медленно. Период полувыведения составляет 40-50 часов. Еда несколько замедляет

скорость всасывания, но не его степень. Незначительные изменения скорости всасывания не приводят к клинически значимого влияния на постоянную концентрацию препарата в плазме крови при ежедневном приеме анастрозола 1 раз в сутки.

Примерно 90-95% от постоянной концентрации достигается после 7 дней приема препарата. Нет сведений о зависимости фармакокинетических параметров анастрозола от времени или дозы.

Фармакокинетика анастрозола не зависит от возраста постменопаузальных женщин.

Фармакокинетика анастрозола у детей не изучалась.

Только 40% анастрозола связывается с белками плазмы.

Анастрозол экстенсивно метаболизируется в постменопаузальных женщин, менее 10% дозы выводится с мочой в неизмененном виде в течение 72 часов после введения дозы препарата. Метаболизм анастрозола осуществляется путем п-деалкилирования, гидроксирования и глюкуронизации. Метаболиты выводятся преимущественно с мочой. Триазол - основной метаболит в плазме крови - не ингибируется ароматазы.

Клиренс анастрозола у добровольцев, больных циррозом печени в стабильном состоянии или с нарушениями функции почек, не отличался от клиренса у здоровых добровольцев.

Показания

Лечение распространенного рака молочной железы с положительными показателями рецепторов гормонов у женщин в постменопаузе.

Присадка лечения инвазивного рака молочной железы на ранних стадиях с положительными показателями рецепторов гормонов у пациенток в постменопаузе.

Присадка лечения инвазивного рака молочной железы с положительными показателями рецепторов гормонов на ранних стадиях у пациенток в постменопаузе, которым была проведена адъювантная терапия тамоксифеном в течение 2-3 лет.

Противопоказания

Анастрозол Сандоз ® противопоказан пациенткам:

- в период беременности и кормления грудью;
- с известной гиперчувствительностью к анастрозолу или другим компонентам препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Анастрозол ингибирует цитохром P450 1A2, 2C8/9 и 3A4 *in vitro*. Клинические исследования по антипирином и варфарином показали, что анастрозол в дозе 1 мг существенно не подавлял метаболизм антипирина и R- и S-варфарин, а это указывает на то, что одновременное применение анастрозола с другими лекарственными средствами вряд ли приведет к клинически значимых взаимодействий лекарственных средств, опосредованных ферментами CYP.

Ферменты, опосредующие метаболизм анастрозола, не определены. Циметидин, слабый неспецифический ингибитор CYP-ферментов, не влиял на плазменные концентрации анастрозола. Эффект мощных CYP ингибиторов неизвестен. Клиническое значение этих данных остается неизвестным. До получения дополнительных данных следует проявлять осторожность при комбинации с лекарственными средствами, которые метаболизируются этими ферментами. Особенно это касается препаратов с узким терапевтическим диапазоном.

Изучение базы данных по безопасности препарата, накопленной в процессе клинических исследований, не выявило сведений о клинически значимом лекарственном взаимодействии у пациенток, принимавших одновременно анастрозол и другие препараты, часто назначаются.

Тамоксифен или средства, содержащие эстрогены, не следует назначать вместе с препаратом Анастрозол Сандоз ®, поскольку это может ослабить фармакологическое действие последнего.

О клинически значимые взаимодействия с бисфосфонатами не сообщалось.

Особенности применения

Общие

Анастрозол Сандоз ® не следует применять женщинам в пременопаузе.

Менопауза должна быть подтверждена результатами биохимических исследований (уровни лютеинизирующего гормона (ЛГ), фолликулостимулирующего гормона (ФСГ) и/или эстрадиола). Нет данных относительно применения анастрозола с аналогами рилизинг-фактора

лютеинизирующего гормона (РФ ЛГ). Следует избегать одновременного применения анастрозола и тамоксифена или средств, содержащих эстрогены, поскольку это может уменьшить их фармакологическое действие. Необходимо учитывать риски и преимущества лечения анастрозолом пациенток с имеющейся ишемической болезнью сердца (см. Раздел «Побочные реакции»).

Нарушение функции печени

Нет данных о безопасности применения препарата Анастрозол Сандоз ® для лечения пациенток с умеренными и тяжелыми нарушениями функции печени. У пациенток с нарушениями функции печени экспозиция анастрозола может быть увеличена; применение анастрозола Сандоз ® пациенткам с умеренными и тяжелыми нарушениями функции печени требует осторожности. Лечение должно базироваться на оценке соотношения пользы и риска для каждой отдельной пациентки.

Нарушение функции почек

Нет данных о безопасности применения препарата Анастрозол Сандоз ® для лечения с тяжелыми нарушениями функции почек (скорость клубочковой фильтрации ниже 30 мл/мин). Применение препарата пациенткам с тяжелыми нарушениями функции почек требует осторожности.

Влияние на минеральную плотность костей

Поскольку Анастрозол Сандоз ® снижает уровень циркулирующего эстрогена, это может привести к снижению минеральной плотности костей с возможным увеличением риска перелома. У женщин с остеопорозом или с риском остеопороза следует оценить минеральную плотность костей, которая определяется путем костной денситометрии, например с помощью DEXA-сканирования, в начале лечения и регулярно после лечения. При необходимости следует назначать лечение или профилактику остеопороза и наблюдать за состоянием пациентки. Применение специфических средств, например бисфосфонатов может прекратить дальнейшую потерю минеральной плотности костей, вызванной анастрозолом у женщин в постменопаузе, и следует оценить целесообразность такого применения.

Препарат содержит лактозу. Пациенткам с редкой наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью Лаппа или нарушением всасывания глюкозы-галактозы не следует принимать этот препарат.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Анастрозол Сандоз ® не влияет или оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с другими механизмами. Однако из-за сообщения о астении и сонливости, связанными с приемом препарата, рекомендуется взвешенно подходить к вопросу управления автомобилем и работы с механизмами

Применение в период беременности или кормления грудью

Исследования на животных репродуктивной токсичности.

Данные о применении анастрозола беременным женщинам и женщинам в период лактации отсутствуют.

Анастрозол Сандоз ® противопоказан при беременности или в период кормления грудью. Влияние на фертильность человека не изучен

Способ применения и дозы

Анастрозол Сандоз ® принимают перорально.

Взрослые женщины, включая женщин пожилого возраста - по 1 таблетке (1 мг) внутрь 1 раз в сутки.

При инвазивном раке молочной железы с положительными показателями рецепторов гормонов на ранних стадиях у женщин в постменопаузе рекомендуемая продолжительность адъювантной эндокринного лечения составляет 5 лет.

Нарушение функции почек: пациенткам с легкими или умеренными нарушениями функции почек коррекции дозы не требуется. Применение препарата Анастрозол Сандоз ® пациенткам с тяжелыми нарушениями функции почек требует осторожности.

Нарушение функции печени: пациенткам с заболеваниями печени легкой степени тяжести коррекции дозы не требуется. Пациенткам с умеренными и тяжелыми нарушениями функции печени препарат следует применять с осторожностью.

Дети

Анастрозол Сандоз ® не рекомендуется назначать детям.

Передозировка

Клинический опыт случайной передозировки ограничен. В процессе исследований на животных анастрозол продемонстрировал низкую острую токсичность. Во время клинических исследований применяли различные дозировки анастрозола: до 60 мг однократно - здоровым мужчинам-добровольцам и до 10 мг в сутки - женщинам в постменопаузе с распространенным раком молочной железы; эти дозы хорошо переносились. Разовую дозу анастрозола, что приводит к симптомам, которые угрожают жизни, не установлено. Специфического антидота нет, лечение - симптоматическое.

При лечении передозировки следует учитывать возможность приема нескольких веществ. Если пациентка в обморок не упала, можно вызвать рвоту. Может быть полезным диализ, поскольку анастрозол не связывается сильно с протеинами. Рекомендуются общая поддерживающая терапия, включая частый мониторинг жизненных функций и тщательное наблюдение за пациенткой.

Побочные реакции

Во время приема препарата Анастрозол Сандоз®, как и во время приема любых лекарственных средств, могут возникнуть нежелательные явления.

В таблице представлены побочные реакции, которые наблюдались в процессе клинических и послерегистрационных исследований или были получены в виде спонтанных сообщений.

Приведенные ниже побочные реакции распределены по частоте и системно-органными классами. Распределение по частоте проводилось по следующим критериям: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечастые ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редкие ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$) и редкие ($< 1/10000$). Чаще всего сообщалось о таких побочных реакциях: головная боль, приливы, тошнота, сыпь, артралгия, нарушение подвижности в суставах, артрит и астения.

Частота	Системы органов	Побочные реакции
очень часто	Со стороны сосудов	приливы
	Общие	астения
	Со стороны костно-мышечной, костной систем и соединительной ткани	артралгия/нарушение подвижности в суставах, артрит, остеопороз
	Со стороны кожи и подкожной клетчатки	высыпания

Со стороны пищеварительной системы	тошнота	
Со стороны нервной системы	головная боль	
часто	Со стороны костно-мышечной, костной систем и соединительной ткани	боль в костях, миалгия
	Со стороны половой системы и молочных желез	сухость влагалища, вагинальное кровотечение*
	Со стороны кожи и подкожной клетчатки	истончение волос (алопеция), аллергические реакции
	Со стороны пищеварительной системы	диарея, рвота
	Со стороны нервной системы	сонливость, запястный туннельный синдром **; расстройства чувствительности (включая парестезии, потеря вкуса и изменения вкусовых ощущений)
	Со стороны пищеварительной системы	повышение уровня щелочной фосфатазы, АЛТ, АСТ
	Со стороны обмена веществ	анорексия, гиперхолестеринемия
нечасто	Со стороны костно-мышечной, костной систем и соединительной ткани	синдром тикающего пальца
	Со стороны обмена веществ	гиперкальциемия с повышением или без повышения уровня паратиреоидного гормона
	Со стороны пищеварительной системы	повышение уровня гамма- глутамилтрансферазы и билирубина, гепатит

Со стороны кожи и подкожной клетчатки	крапивница	
единичные	Со стороны кожи и подкожной клетчатки	полиморфная эритема, анафилактоидные реакции, кожный васкулит (в частности болезнь Шенлейна-Геноха)
редкие	Со стороны кожи и подкожной клетчатки	синдром Стивенса-Джонсона, ангионевротический отек

* Часто сообщалось о вагинальные кровотечения, возникающие преимущественно у больных прогрессирующим раком молочной железы во время первых нескольких недель после замены гормональной терапии для лечения анастрозолом. Если кровотечения продолжаются, пациентку следует обследовать дополнительно.

****** Случаи запястного туннельного синдрома наблюдались значительно чаще у пациенток, в процессе клинических исследований получали лечение анастрозолом, чем у тех, которые получали лечение тамоксифеном.

В ходе исследования, проведенного с участием женщин в постменопаузе с операбельным раком молочной железы, получавших лечение в течение 5 лет, ишемические явления со стороны сердечно-сосудистой системы наблюдались чаще у пациенток, принимавших анастрозол по сравнению с теми, кто получал лечение тамоксифеном, хотя различие не было статистически значимым. Наблюдаемая разница была по преимуществу сообщениями о стенокардией и ассоциировалась с подгруппой пациенток, которые и раньше страдали ишемической болезнью сердца.

Анастрозол Сандоз ® уменьшает уровень циркулирующих эстрогенов, может привести к уменьшению минеральной плотности костей, в связи с чем у некоторых больных риск переломов.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 ° C. Хранить в оригинальной упаковке для защиты от действия света. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 14 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Салютас Фарма ГмбХ.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Отто-она-Гюрике-алле 1, 39179, Барлебен, Германия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).