

МНН: Анастрозол

Лекарственная форма: таблетки покрытые оболочкой

Химическое название

альфа, альфа, альфа', альфа' - тетраметил - 5 - (1H - 1, 2, 4 - триазол - 1илметил) - м - бензолдиацетонитрил

[Описание](#)

[Фармакологическое действие](#)

[Фармакокинетика](#)

[Показания к применению](#)

[Противопоказания](#)

[Режим дозирования](#)

[Побочное действие](#)

[Передозировка](#)

[Взаимодействие](#)

[Особые указания](#)

Описание

Белый кристаллический порошок. Плохо растворим в воде. Растворим в метаноле, этаноле, ацетоне. Легко растворим в ацетонитриле.

Фармакологическое действие

Селективный нестероидный ингибитор ароматазы. Обладает противоопухолевой активностью в отношении эстрогензависимых опухолей молочной железы у женщин в постменопаузе. Снижает содержание циркулирующего эстрадиола. Не обладает гестагенной, андрогенной и эстрогенной активностью, не влияет на секрецию эндогенных ГКС и МКС.

Фармакокинетика

Абсорбция - высокая (после приема внутрь всасывается 83-85% принятой дозы), T_{Cmax} - 2 ч. Связь с белками плазмы - 40%. Около 90-95% от постоянной концентрации в плазме достигается после 7 сут приема препарата.

Хорошо метаболизируется у женщин в постменопаузе. Метаболизм осуществляется в процессе N-деалкилирования, гидроксирования и конъюгации с глюкуроновой кислотой. Основной метаболит - триазол, определяемый в плазме и моче, не ингибирует ароматазу. T_{1/2} - 50 ч. Метаболиты выводятся преимущественно почками, менее 10% дозы выводится с мочой в неизмененном виде в течение 72 ч.

Показания к применению

Ранний гормонположительный рак молочной железы у женщин в постменопаузе (адьювантная терапия).

Распространенный рак молочной железы у женщин в постменопаузе.

Ранний гормонположительный рак молочной железы у женщин в постменопаузе после терапии тамоксифеном в течение 2-3 лет (адьювантная терапия).

Противопоказания

Гиперчувствительность, эстрогензависимые опухоли молочной железы у женщин в пременопаузном периоде, выраженная ХПН (КК менее 20 мл/мин), умеренная и выраженная печеночная недостаточность, одновременный прием тамоксифена, беременность, период лактации, детский возраст.

Режим дозирования

Внутрь, по 1 мг 1 раз в сутки. Длительность лечения зависит от формы и тяжести заболевания (при адьювантной терапии реомендуемая продолжительность лечения - 5 лет). При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата следует прекратить.

Побочное действие

Очень часто (более 10%); часто (1-10%); редко - (0.1-1%); очень редко - (менее 0.1%).

Со стороны мочеполовой системы: часто - сухость влагалища; редко - влагалищные кровотечения (в основном в течение первых недель после отмены или смены предшествующей гормональной терапии).

Со стороны кожных покровов: часто - истончение волос, кожная сыпь; очень редко - синдром Стивенса-Джонсона.

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

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

Со стороны опорно-двигательного аппарата: часто - артралгия. Возможно снижение минеральной плотности костной ткани в связи со снижением концентрации циркулирующего эстрадиола, повышая риск развития остеопороза и переломов костей.

Со стороны обмена веществ: редко - гиперхолестеринемия.

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

Со стороны ССС: очень часто - "приливы" крови.

Передозировка

Лечение: индукция рвоты, диализ, поддерживающая терапия, контроль функции жизненно важных органов и систем. Специфического антидота нет.

Взаимодействие

Эстрогены и тамоксифен снижают фармакологическое действие.

Особые указания

В случае сомнений в гормональном статусе менопауза должна подтверждаться биохимически.

При сохранении метrorрагии на фоне лечения необходима консультация гинеколога.

При наличии сопутствующего остеопороза или риска его развития рекомендуется оценивать минеральную плотность костной ткани методом денситометрии в начале и в процессе лечения. При необходимости проводят профилактику остеопороза под наблюдением врача.

При умеренно выраженных нарушениях функции почек коррекции дозы не требуется.

Эффективность и безопасность при одновременном применении с тамоксифеном вне зависимости от статуса гормональных рецепторов сравнимы с таковыми при использовании одного тамоксифена.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии др. потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.