Инструкция по применению
Фемара Таблетки покрытые пленочной оболочкой 2,5 мг 30 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Швейцария
Производитель: Новартис Фарма
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Летрозол
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 2.5 мг

Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой темно-желтого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые, со скошенными краями, на одной стороне напечатано "FV", на другой - "CG".

Действующее вещество

Летрозол

Состав

1 таблетка содержит: Действующие вещества: летрозол 2,5 мг. Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный, карбоксиметилкрахмал натрия, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, гипромеллоза, тальк, макрогол 8000, краситель железа оксид желтый (17268), титана диоксид. В блистере 10 таблеток. В картонной упаковке 3 блистера.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание Летрозол быстро и полностью абсорбируется из ЖКТ (средняя величина биодоступности составляет 99,9%). Прием пищи незначительно снижает скорость абсорбции. Среднее значение Tmax летрозола в крови составляет 1 ч при приеме Фемары натощак и 2 ч - при приеме с пищей; среднее значение Cmax составляет 129±20,3 нмоль/л при приеме натощак и 98,7±18,6 нмоль /л - при приеме с пищей, однако степень абсорбции летрозола (при оценке по AUC) не изменяется. Небольшие изменения в скорости абсорбции расцениваются как не имеющие клинического значения, поэтому летрозол можно принимать независимо от приема пищи. Распределение Связывание летрозола с белками плазмы крови составляет приблизительно 60% (преимущественно с альбумином - 55%). Концентрация летрозола в эритроцитах составляет около 80% от его уровня в плазме крови. Кажущийся Vd в период равновесного состояния составляет около 1,87 ±0,47 л/кг. Css достигается в течение 2-6 недель ежедневного приема суточной дозы 2,5 мг. Фармакокинетика нелинейна. Кумуляции при длительном применении не отмечено. Метаболизм Летрозол в значительной степени подвергается метаболизму под действием изоферментов CYP3A4 и CYP2A6 с образованием фармакологически неактивного карбинолового соединения. Выведение Выводится преимущественно почками в виде метаболитов, в меньшей степени - через кишечник. Конечный T1/2 составляет 48 ч. Фармакокинетика в особых клинических случаях Фармакокинетические параметры летрозола не зависят от возраста пациента. При почечной недостаточности фармакокинетические параметры не изменяются. При умеренно выраженном нарушении функции печени (класс В по шкале Чайлд-Пью) средние величины AUC хотя и выше на 37%, но остаются в пределах того диапазона значений, которые отмечаются у лиц без нарушений функции печени. У больных с циррозом печени и тяжелыми нарушениями ее функции (класс С по шкале Чайлд-Пью) AUC увеличивается на 95% и T1/2 на 187%. Однако, учитывая хорошую переносимость высоких доз препарата (5-10 мг/сут) в этих случаях необходимости изменять дозу летрозола нет.

Показания

Ранние стадии рака молочной железы, клетки которого имеют рецепторы к гормонам, у женщин в постменопаузе, в качестве адъювантной терапии. Ранние стадии рака молочной железы у женщин в постменопаузе после завершения стандартной адъювантной терапии тамоксифеном в качестве продленной адъювантной терапии. Распространенные гормонозависимые формы рака молочной железы у женщин в постменопаузе (терапия первой линии). Распространенные формы рака молочной железы у женщин в постменопаузе (естественной или вызванной искусственно), получавших предшествующую терапию антиэстрогенами.

Способ применения и дозы

Для взрослых рекомендуемая доза препарата Фемара® составляет 2,5 мг 1 раз /сутки, ежедневно длительно. В качестве продленной адъювантной терапии лечение должно продолжаться в течение 5 лет (не дольше 5 лет). При появлении признаков прогрессирования заболевания прием Фемары следует прекратить. У пациенток пожилого возраста коррекции дозы Фемары не требуется. У пациенток с нарушениями функции печени и/или почек (КК ≥ 10 мл/мин) коррекции дозы препарата не требуется. Тем не менее, при тяжелых нарушениях функции печени (класс С по шкале Чайлд-Пью) пациентки должны находиться под постоянным наблюдением. Таблетки принимают внутрь, независимо от приема пищи.

Противопоказания

Эндокринный статус, характерный для репродуктивного периода; беременность; период лактации (грудного вскармливания); детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к летрозолу или любому другому компоненту препарата. нет данных о применении препарата Фемара® у пациенток с клиренсом креатинина менее 10 мл/мин. Перед назначением Фемары таким пациенткам следует тщательно взвесить соотношение между потенциальным риском и ожидаемым эффектом лечения.

Применение при беременности и кормлении грудью

Препарат Фемара® противопоказан к применению при беременности и в период лактации. Во время терапии Фемарой, учитывая потенциальную возможность наступления беременности, женщинам в перименопаузном и раннем постменопаузном периоде следует использовать надежные способы контрацепции до установления стабильного постменопаузного гормонального уровня.

Побочные действия

Частота возникновения побочных эффектов оценивается следующим образом: возникающие очень часто (≥10%); часто (≥1, < 10%); иногда (≥0,1%, < 1%); редко (≥0,01, < 0,1%); очень редко (< 0,01%, включая отдельные сообщения). Как правило, побочные реакции были слабо или умеренно выраженные и в основном связаны с подавлением синтеза эстрогенов. Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота, диспепсия, запор, диарея; иногда - боли в животе, стоматит, сухость во рту, повышение активности печеночных ферментов. Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - головная боль, головокружение, депрессия; иногда - тревога, нервозность, раздражительность, сонливость, бессонница, ухудшение памяти, дизестезия, парестезия, гипестезия, нарушения вкусового восприятия, эпизоды нарушения мозгового кровообращения. Со стороны системы кроветворения: иногда - лейкопения. Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда – ощущение сердцебиения, тахикардия, тромбофлебит поверхностных и глубоких вен, повышение АД, ИБС (стенокардия, инфаркт миокарда, сердечная недостаточность), тромбоэмболия; редко - эмболия легочной артерии, тромбоз артерий, инсульт. Со стороны дыхательной системы: иногда - одышка, кашель. Дерматологические реакции: часто - алопеция, повышенная потливость, кожная сыпь (включая эритематозную, макулопапулезную, везикулярную сыпь, псориазоподобные высыпания); иногда - кожный зуд, сухость кожи, крапивница; очень редко - ангионевротический отек, анафилактические реакции. Со стороны костно-мышечной системы: очень часто - артралгия; часто - миалгия, боли в костях, остеопороз, переломы костей; иногда - артрит. Со стороны органов чувств: иногда - катаракта, раздражение глаз, затуманивание зрения, нарушение вкусовых ощущений. Со стороны мочевыводящей системы: иногда - учащенное мочеиспускание, инфекции мочевыводящих путей. Со стороны репродуктивной системы: иногда - вагинальные кровотечения, выделения из влагалища, сухость влагалища, боли в молочных железах. Прочие: очень часто - приступообразные ощущения жара (приливы); часто - повышенная утомляемость, астения, недомогание, периферические отеки, увеличение массы тела, гиперхолестеринемия, анорексия, повышение аппетита; иногда - снижение массы тела, жажда, гипертермия (пирексия), сухость слизистых оболочек, генерализованные отеки, боли в опухолевых очагах.

Передозировка

Имеются отдельные сообщения о случаях передозировки препарата Фемара®. Лечение: какие-либо специфические методы лечения передозировки неизвестны. Показана симптоматическая и поддерживающая терапия. Летрозол выводится из плазмы при гемодиализе.

Взаимодействие с другими препаратами

При одновременном назначении летрозола с циметидином и варфарином клинически значимого взаимодействия не наблюдается. Клинического опыта по применению летрозола в комбинации с другими противоопухолевыми средствами в настоящее время не имеется. Согласно результатам исследований in vitro летрозол подавляет активность изоферментов цитохрома P450 - 2A6 и 2C19 (последнего – умеренно). При решении вопроса о значении этих данных для клиники необходимо учитывать, что изофермент CYP2A6 не играет существенной роли в метаболизме лекарственных препаратов. В экспериментах in vitro было показано, что летрозол, применяемый в концентрациях, в 100 раз превышающих равновесные значения в плазме, не обладает способностью существенно подавлять метаболизм диазепама (субстрата для CYP2C19). Таким образом, клинически значимые взаимодействия с изоферментом CYP2C19 маловероятны. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при совместном применении летрозола и препаратов, метаболизирующихся преимущественно при участии вышеназванных изоферментов и имеющих узкий терапевтический индекс.

Особые указания

Пациентки с тяжелыми нарушениями функции печени должны находиться под постоянным наблюдением. Влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами, требующими повышенной концентрации внимания Некоторые побочные эффекты препарата, такие как общая слабость и головокружение, могут влиять на способность выполнения потенциально опасных видов деятельности, требующих концентрации внимания и быстрых реакций. В этой связи следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами.

Условия хранения

В сухом темном месте. Беречь от детей