Инструкция по применению
Лестродекс Таблетки 2,5 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Румыния
Производитель: ТЕВА
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Летрозол
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 2,5 мг



Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета.

Действующее вещество

Летрозол

Состав

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит: активное вещество: летрозол 2,5 мг, вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 61,5 мг, крахмал кукурузный 6,6 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) 4,0 мг, целлюлоза микрокристаллическая 25,0 мг, магния стеарат 1,0 мг, пленочное покрытие: Опадрай II 85F32410 желтый (поливиниловый спирт частично гидролизованный 40%, титана диоксид (Е 171) 23,50%, макрогол 3350 20,20%, тальк 14,80%, краситель железа оксид желтый (Е 172) 1,50%)-3,5 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Летрозол быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ), средняя биодоступность составляет 99,9%. Прием пищи незначительно снижает скорость абсорбции. Среднее значение времени достижения максимальной концентрации летрозола в крови (TCmax) составляет 1 час при приеме летрозола натощак и 2 часа - при приёме с пищей, среднее значение максимальной концентрации (Cmax) составляет 129+20,3 нмоль/л при приеме натощак и 98,7+18,6 нмоль/л - при приеме с пищей, однако степень всасывания летрозола (при оценке по площади под кривой "концентрация-время" (AUC)) не изменяется. Небольшие изменения в скорости всасывания расцениваются как не имеющие клинического значения, поэтому летрозол можно принимать независимо от приема пищи. Связь летрозола с белками плазмы крови составляет приблизительно 60% (преимущественно с альбумином - 55%). Концентрация летрозола в эритроцитах составляет около 80% от таковой в плазме крови. Кажущийся объем распределения в равновесном состоянии составляет около 1,87+0,47 л/кг. Равновесная концентрация достигается в течение 2-6 недель ежедневного приема суточной дозы 2,5 мг. Фармакокинетика нелинейна. Кумуляции при длительном применении не отмечено. Летрозол в значительной степени подвергается метаболизму под действием изоферментов CYP3A4 и CYP2A6 цитохрома P450 с образованием фармакологически неактивного карбинолового соединения. Выводится преимущественно почками в виде метаболитов, в меньшей степени - через кишечник. Конечный период полувыведения (T1/2) составляет 48 ч. 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

Внутрь, независимо от приема пищи. Рекомендуемая доза препарата Лестродекс - по 2,5 мг 1 раз в сутки. В качестве продленной адъювантной терапии лечение должно продолжаться в течение 5 лет или до появления признаков прогрессирования заболевания. У пациенток с распространенным или метастатическим раком лечение препаратом Лестродекс следует продолжать до явного прогрессирования опухоли. Не требуется коррекция дозы для пожилых пациенток. Пациентки с нарушением функции печени и/или почек: при нарушениях функции печени или почек (КК более 10 мл/мин) коррекции дозы препарата не требуется. Недостаточно данных при применении препарата у пациенток с КК менее 10 мл/мин или пациенток с тяжелыми нарушениями функции печени (класс С по шкале Чайлд-Пью) (смотри разделы Меры предосторожности при применении и Фармакокинетика). При терапии препаратом Лестродекс данной группой пациенток требуется постоянное наблюдение за их состоянием.

Противопоказания

Гиперчувствительность к активному веществу или к какому-либо вспомогательному веществу препарата, эндокринный статус, характерный для репродуктивного периода, беременность, период лактации, детский возраст до 18 лет (эффективность и безопасность для детей не установлены).

Применение при беременности и кормлении грудью

Препарат Лестродекс противопоказан к применению при беременности, и. в период лактации. Во время терапии препаратом Лестродекс, 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

Как правило, побочные реакции были слабо или умеренно выражены и, в основном, связаны с подавлением синтеза эстрогенов (например, "приливы" крови к лицу, алопеция и вагинальные кровотечения). Частота проявления побочных реакций распределяется следующим образом: Очень часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100, <1/10), иногда (≥ 1/1000, <1/100), редко (≥ 1/10000, <1/1000), очень редко (<1/10000), частота не известна. Инфекционные и паразитарные заболевания Иногда - инфекции мочевыводящих путей. Доброкачественные, злокачественные и неуточненные новообразования (включая кисты и полипы) Иногда - боли в опухолевых очагах (не применимо при адъювантном и длительном адъювантном лечении). Нарушения со стороны крови и лимфатической системы Иногда - лейкопения. Нарушения со стороны обмена веществ и питания Часто - анорексия, повышение аппетита, гиперхолестеринемия, иногда - генерализованные отеки. Нарушения психики Часто - депрессия, иногда - тревога, включая нервозность и раздражительность. Нарушения со стороны нервной системы Часто - головная боль, головокружение, иногда - сонливость, бессонница, ухудшение памяти, расстройство чувствительности (дизестезия), включая парестезию, гипестезия, нарушение вкусовых ощущений, эпизоды нарушения мозгового кровообращения. Нарушения со стороны органа зрения Иногда - катаракта, раздражение глаз, нечёткое зрение, Нарушения со стороны сердца Иногда - ощущение сердцебиения, тахикардия. Нарушения со стороны сосудов Иногда - тромбофлебит, включая тромбофлебит поверхностных и глубоких вен, артериальная гипертензия, ишемическая болезнь сердца, редко - легочная эмболия, артериальный тромбоз, инсульт. Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения Иногда - одышка, кашель. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта Часто - тошнота, рвота, диспепсия, запор, диарея, иногда - боль в животе, стоматит, сухость во рту. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей Иногда - повышение активности "печеночных" ферментов. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей Очень часто - повышенное потоотделение, часто - алопеция, сыпь, включая эритематозную, макулопапулезную, везикулярную сыпь, псориазоподобные высыпания, иногда - зуд, сухость кожи, крапивница, частота не известна - ангионевротический отек, анафилактические реакции. Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани Очень часто - артралгия, часто - миалгия, боль в костях, остеопороз, переломы костей, иногда - артрит. Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей Иногда - учащенное мочеиспускание. Нарушение со стороны половых органов и молочной железы Иногда - вагинальное кровотечение, выделения из влагалища, сухость влагалища, боль в молочных железах. Общие расстройства и нарушения в месте введения Очень часто -"приливы" крови, усталость,

включая астению, часто - недомогание, периферические отеки, иногда - гипертермия, сухость слизистой оболочки, жажда. Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований Часто - увеличение массы тела, иногда - снижение массы тела.

Передозировка

Имеются отдельные сообщения о случаях передозировки летрозола. Лечение: какие-либо специфические методы лечения передозировки не известны. Показана симптоматическая и поддерживающая терапия. Летрозол выводится из плазмы при гемодиализе.

Взаимодействие с другими препаратами

При одновременном назначении летрозола с циметидином и варфарином клинически значимых взаимодействий 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 CYP2A6 и в умеренной степени - CYP2C19. Следует соблюдать осторожность при совместном применении летрозола и препаратов, метаболизирующихся преимущественно при участии вышеназванных изоферментов и имеющих узкий терапевтический индекс.

Особые указания

Поскольку в период терапии препаратом Лестродекс возможно развитие усталости и головокружения, а также сонливости, следует с осторожностью выполнять работу, требующую повышенного внимания, быстроты двигательных и психических реакций (в т.ч. вождение автомобиля или управление механизмами).

Срок хранения после открытия

48 месяцев. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

При температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте!