

## **ЭКСЕМЕСТАН**

1. Эксеместан.
  2. Аромазин.
  3. Противоопухолевые, иммунодепрессивные и сопутствующие средства (Цитостатические средства).
  4. Противоопухолевое средство.
  5. Уровень убедительности доказательств А. Эффективность препарата подтверждается данными морфологических исследований и опытом клинического применения препарата.
  6. Цена за 1 таблетку (25 мг) – 128,08 руб.[1];153,40 руб.[2].
  7. Блокирует образование эстрогенов путем ингибирования ароматазы; необратимо связывается с активным сайтом фермента, вызывая его инактивацию. Не обладает прогестогенной и эстрогенной активностью. Андрогенная активность обусловлена 17-гидропроизводным. Не оказывает влияния на синтез кортизола и альдостерона в надпочечниках. По принципу обратной связи, на уровне гипофиза увеличивает уровень лютеинизирующего гормона и фолликулостимулирующего гормона (снижение концентрации эстрогенов стимулирует секрецию гонадотропинов в гипофизе).  
Абсорбция - высокая (пища - улучшает всасывание), биодоступность - низкая.  $T_{Cmax}$  - 2 ч,  $C_{max}$  при однократном приеме 25 мг - 18 нг/мл. Имеет эффект "первого прохождения" через печень. Метаболизируется путем окисления метиленовой группы при участии изофермента CYP 3A4 или путем восстановления 17-кетогруппы при участии альдокеторедуктаз, с образованием фармакологически неактивных или малоактивных метаболитов.  $T_{1/2}$  - 24 ч. Хорошо распределяется в тканях (большой объем распределения). Связь с белками плазмы - 90%. Выводится почками и через кишечник.
  8. Распространенный рак молочной железы у женщин в естественной или индуцированной постменопаузе: прогрессирование заболевания на фоне антиэстрогенной терапии (в т.ч. нестероидными ингибиторами ароматазы), прогестинами (гормональная терапия третьего ряда).
  9. Гиперчувствительность, беременность, период лактации, детский возраст.  
С осторожностью - пременопаузальный эндокринный статус.
  10. Клинические: ранние - субъективная оценка больного о результатах лечения; поздние - лабораторные и инструментальные подтверждения ремиссии.
  11. Внутрь, 25 мг 1 раз в сутки после приема пищи. Лечение продолжают до вторичного прогрессирования опухоли.  
DDD=25 мг (перорально).
  12. Специфических симптомов нет. Лечение: симптоматическое (специфических антидотов нет), регулярный контроль жизненно важных функций и тщательное наблюдение.
  13. Постменопаузальный статус следует подтверждать определением уровня лютеинизирующего гормона, фолликулостимулирующего гормона и эстрадиола.
  14. У пациенток с печеночной или почечной недостаточностью корректировка дозы не требуется. Аромазин противопоказан к применению при беременности. Не рекомендуется применять у детей.
  15. Приливы крови к верхней части грудной клетки и лицу, потливость; повышенная утомляемость, головокружение, головная боль, бессонница, депрессия; кожная сыпь; лимфопения, тромбоцитопения, лейкопения; боли в животе, анорексия, тошнота, запор, диспепсия, повышение активности "печеночных" трансаминаз; алопеция, периферические отеки.
  16. Индукторы CYP 3A4 снижают концентрацию. Антагонизм - с эстрогенами.
  17. Не применяется.
  18. Во время лечения следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.
  19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.
  20. Таблетки покрытые оболочкой 25 мг; таблетки покрытые сахарной оболочкой 25 мг.
- Фирмы:** Pharmacia & Upjohn S.p.A., Италия; Pharmacia, США.
21. При температуре не выше 30° С.