

ANASTROZOL MICROSULES

ANASTROZOL 1 mg

Comprimidos Recubiertos
Venta Bajo Receta Archivada
Industria Argentina

Composición:

Cada comprimido recubierto contiene:

Anastrozol.....	1 mg
Lactosa monohidrato	62 mg
Almidón de maíz	30 mg
Povidona.....	3 mg
Almidón glicolato de sodio	3 mg
Estearato de magnesio	1 mg
Hidroxipropilmetilcelulosa/triacetina/	
Dióxido de titanio/lactosa.....	6 mg

Acción terapéutica:

Inmunomodulador. Inhibidor selectivo de la aromatasa. Citostático (Código ATC: L02B6)

Indicaciones:

Tratamiento de cáncer avanzado de mama en mujeres post-menopáusicas.

No se ha demostrado su eficacia en pacientes que sean receptores negativos a los estrógenos a no ser que tuvieran previamente una respuesta clínica positiva a tamoxifeno.

Acción farmacológica:

Anastrozol es un inhibidor no esteroide potente y altamente selectivo de la aromatasa. En la mujer postmenopáusica, anastrozol inhibe la conversión de androstenediona a estrona en los tejidos periféricos mediante la inhibición de la aromatasa por lo cual se re-

ducen los niveles de estrógenos circulantes que se traduce en un efecto beneficioso para las pacientes con cáncer de mama.

En pruebas clínicas se demuestra que la administración de una dosis diaria de 1 mg de anastrozol reduce la formación de estradiol en aproximadamente un 90 % o más.

Anastrozol no desarrolla actividad progestágena, androgénica ni estrogénica. Asimismo no tiene efecto sobre la secreción de cortisol o aldosterona, por lo cual no es necesario agregar corticoides o mineralocorticoides ni induce aumento de la hormona estimulante tiroidea (TSH).

Farmacocinética:

La absorción de anastrozol en condiciones de ayuno es rápida, alcanzando concentraciones plasmáticas máximas, generalmente dentro de las 2 horas de la toma. La vida media de eliminación plasmática es prolongada; entre 40 y 50 horas. Los alimentos disminuyen ligeramente la absorción, pero estos cambios son clínicamente no significativos en condiciones de equilibrio de las concentraciones plasmáticas.

Las concentraciones plasmáticas de equilibrio se alcanzan a los 7 días de iniciada la administración diaria de la droga. Los parámetros farmacocinéticos del anastrozol no

son dosis ni tiempo-dependientes y no se modifican en relación con la edad de las mujeres postmenopáusicas. Anastrozol se une un 40-50 % a las proteínas plasmáticas y es ampliamente metabolizado por N-dialquilación, hidroxilación y glucuronización.

La droga se excreta principalmente por vía urinaria en forma de metabolitos, mientras que menos del 10 % de la dosis aparece inalterada en la orina dentro de las 72 horas de su administración. El metabolito plasmático más importante, la forma triazol, no desarrolla actividad inhibitoria de la aromatasas.

Poblaciones especiales:

La depuración plasmática de anastrozol disminuye en pacientes con cirrosis hepática estable relacionada con abuso de alcohol, sin embargo en los ensayos clínicos publicados no se informa de la necesidad de ajuste de dosis en estos pacientes ni en los que presentan insuficiencia renal leve o moderada.

Pacientes ancianos: No se describen modificaciones en la farmacocinética de anastrozol relacionadas con la edad en un rango < 50 a > 80 años.

La farmacocinética de la droga no ha sido evaluada en niñas.

Posología y modo de uso:

Adultos (incluidos pacientes ancianos):

1 comprimido por día, por vía oral, preferentemente en ayunas.

Insuficiencia hepática o renal:

Leves o moderadas: no se requiere ajuste de la posología.

Contraindicaciones:

Anastrozol está contraindicado en:

- Hipersensibilidad conocida a anastrozol o alguno de los componentes del producto.
- Mujeres premenopáusicas.
- Insuficiencia renal severa (depuración de creatinina plasmática < 20 ml/min).
- Insuficiencia hepática severa.
- Pacientes bajo tratamiento con modificación conteniendo estrógenos.
- Embarazo.
- Lactancia.

Advertencias:

Dado que anastrozol está indicado para mujeres postmenopáusicas, ante alguna duda sobre el estado hormonal de la paciente a tratar deberán realizarse estudios bioquímicos para confirmar la menopausia.

No se recomienda su uso en niños ya que no fue comprobada su eficacia y seguridad en este grupo etario.

Precauciones

Se recomienda precaución en las siguientes condiciones:

- Antecedentes de efectos adversos asociados con la administración de otros inhibidores de la aromatasas.
- Embarazo.
- Antecedentes de tromboembolismo cerebral (stroke), pulmonar u otros trastornos tromboembólicos.
- Pacientes con riesgo de edema o aumento de peso.

Capacidad de conducir vehículos u operar maquinaria peligrosa

Es poco probable que anastrozol altere la capacidad de las pacientes para conducir ve-

hículos o maquinarias. Sin embargo se han informado casos de astenia y somnolencia durante su administración por lo cual se recomienda precaución para realizar tareas peligrosas.

Interacciones medicamentosas:

Asociaciones a tener en cuenta

Los estudios de interacción clínica con antipirina y cimetidina no evidenciaron interacciones clínicamente significativas mediadas por el complejo enzimático hepático del citocromo P450. No hay información clínica disponible sobre el uso de anastrozol en combinación con otros agentes anticancerígenos.

Asociaciones desaconsejadas

Es conveniente evitar la administración concomitante de anastrozol con terapia estrogénica por el riesgo de inversión de la acción farmacológica del primero.

Interacción e influencia sobre pruebas de laboratorio

Se ha informado acerca de aumentos leves en los niveles de colesterol total y lipoproteínas de baja densidad (LDL) en pacientes bajo tratamiento con anastrozol. Se desconoce la significancia de estos cambios.

Carcinogénesis, mutagénesis

No se describen estos efectos.

Embarazo y lactancia

Anastrozol está contraindicado durante el embarazo y lactancia.

Efectos adversos

Los efectos adversos de anastrozol habitualmente son leves a moderados y rara-

mente requieren la suspensión del tratamiento.

Efectos sobre el sistema nervioso central

- Astenia y cefalea son las reacciones adversas más frecuentes de anastrozol, ocurren en el 13-16% de las pacientes con cáncer mamario.
- Otros efectos adversos sobre el SNC incluyen dolor inespecífico (11%), mareos (6%), depresión (5%) y parestesias (5%).
- **Efectos hematológicos:** Anemia y leucopenia ocurre en menos del 5% de las pacientes tratadas con anastrozol 1 mg/día. La relación causal no ha sido establecida.
- **Efectos cardiovasculares:**
 - En estudios clínicos comparativos se describe complicaciones tromboembólicas en 3,4% de las pacientes con cáncer mamario tratadas con anastrozol 1 mg/día que es similar a la incidencia observada con megestrol acetato 160 mg/día (4,7%)
 - Dolor de pecho fue informado en estos estudios en el 5% de las pacientes tratadas con anastrozol.
 - **Edema:** fueron informados en el 7 y 11 % de la pacientes que recibían anastrozol 1 mg y 10 mg, respectivamente. Esta incidencia fue menor que con megestrol acetato (14%)
- **Efectos endócrinos:** Oleadas de calor (sofocos) fue un efecto adverso frecuente de anastrozol 1 mg (12%).
- **Aumento de peso:** ocurre en el 1,5% de las pacientes tratadas.
- **Manifestaciones digestivas:** anorexia, náuseas, vómitos, diarrea.

- **Otros efectos:** sequedad vaginal y debilitamiento del cabello.

En pacientes con cáncer de mama avanzado, algunas de las cuales presentaban metástasis de hígado y/o óseas, se informó elevación de las enzimas hepáticas (γ GT elevadas o, con menor frecuencia, fosfatasa alcalina).

Sobredosificación:

No se describe experiencia clínica de sobredosis accidental. En estudios con animales, anastrozol desarrolla una baja toxicidad.

“Ante la eventualidad de una sobredosificación concurrir al Hospital

más cercano o comunicarse con los

Centros de Toxicología:

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez:

(011) 4962-2247/6666

Hospital A. Posadas:

(011) 4654-6648/4658-7777”

El tratamiento de la sobredosificación con anastrozol es sintomático, debiéndose reevaluar el control de los signos vitales y del estado del paciente. Luego de la cuidadosa evaluación clínica del paciente, de la valoración del tiempo transcurrido desde la ingesta o administración de la cantidad de medicación ingerida y de la administración de otras

drogas decidirá la realización o no del tratamiento general de soporte: vómito provocado o lavado gástrico, carbón activado, purgante salino (40 a 60 min. luego del carbón activado) o hemodiálisis.

Presentación:

Envase con 28 comprimidos recubiertos.

Conservar en lugar seco, a temperatura entre 15° y 30 °C.

“Todo medicamento debe permanecer alejado del alcance los niños.”

“Este medicamento debe ser utilizado bajo prescripción y vigilancia médica y no debe repetirse sin una nueva receta médica.”

Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud. Certificado N° 51304

Dirección Técnica:

Gabriel Saez. Farmacéutico.

Elaboración: Av. Juan B. Justo 7669, Ciudad Autónoma de Buenos Aires.

Fecha de última revisión: 16/02/2004

MICROSULES ARGENTINA S.A. DE S.C.I.I.A.

Ruta Panamericana Km 36,5 (B1619IEA) Garín, Pdo. de Escobar, Pcia. de Buenos Aires. Tel: 03327-452629
www.microsules.com.ar