

## Состав и форма выпуска

Беловатые, овальные, двояковыпуклые таблетки с линией разрыва, выгравированные на одной грани «160».

Разрывная линия предназначена только для облегчения разрыва для облегчения глотания, а не для деления на равные дозы.

Каждая таблетка содержит ацетат мегестрола 160 мг.

*Наполнитель с известным эффектом:* каждая таблетка содержит 224,5 мг моногидрата лактозы, коллоидный безводный кремнезем, стеарат магния, микрокристаллическая целлюлоза, повидон, натрий крахмал гликолят.

## Фармакологические свойства

Мегейс (ацетат мегестрола) обладает фармакологическими свойствами, аналогичными свойствам природного прогестерона. Его прогестатационная активность несколько выше, чем у ацетата медроксипрогестерона, норэтиндрона, ацетата норэтиндрона и норетинодрела; немного меньше, чем у хлормадинона ацетата; и существенно меньше, чем у норгестрела.

Мегестрол ацетат является мощным прогестагеном, который оказывает значительное антиэстрогенное действие. Не имеет андрогенных или эстрогенных свойств. Обладает антигонадотропным, антиутеротропным и антиандрогенным / антимиотропным действием. Обладает небольшим, но значительным глюкокортикоидным эффектом и очень слабым минералокортикоидным эффектом.

## Фармакокинетика

Пиковые уровни тритированного мегестрола ацетата и метаболитов в плазме происходят через один-три часа после перорального приема. Когда от 4 до 91 мг с-меченого ацетата мегестрола перорально вводили женщинам, основной путь элиминации препарата был в моче. Восстановление общей радиоактивности с мочой и калом в течение 10 дней варьировалось от 56,6% до 78,4% (в среднем 66,4%) и от 7,7% до 30,3% (в среднем 19,8%) соответственно. Общая восстановленная радиоактивность варьировала от 83,1% до 94,7% (в среднем 86,2%).

Метаболиты ацетата мегестрола, которые были идентифицированы в моче как глюкуронидные конъюгаты, представляли собой 17-альфа-ацетокси-2-альфа-гидрокси-6-метилпрегна-4,6-диен-3,2-дион; 17-альфа-ацетокси-6-гидроксиметилпрегна-4,6-диен-3,2-

дион; и 17-альфа-ацетокси-2-альфа-гидрокси-6-гидрометилпрегна-4,6-диен-3,2-дион; эти идентифицированные метаболиты составляли только 5-8% от введенной дозы.

Концентрации в сыворотке измеряли после введения однократных и многократных пероральных доз ацетата мегестрола. В исследовании участвовали взрослые мужчины и женщины в постменопаузе, не старше 65 лет.

Ацетат мегестрола легко всасывается после перорального введения доз 20, 40, 80 и 200 мг. Концентрации мегестрола в сыворотке увеличиваются с увеличением дозы, а арифметически пропорциональная взаимосвязь между увеличением дозы и увеличением уровня сыворотки. Средние пиковые концентрации в сыворотке для четырех протестированных доз составили 89, 190, 209 и 465 нг / мл.

Средние пиковые концентрации в сыворотке обнаруживаются через три часа после введения однократной дозы для всех изученных уровней дозировки. Кривая концентрации в сыворотке выглядит двухфазной, а период полураспада в бета-фазе составляет от 15 до 20 часов.

После нескольких приемов в течение трехдневного периода уровни сыворотки увеличиваются каждый день и, по оценкам, достигают прогнозируемых уровней устойчивого состояния от 80% до 90% на третий день.

## **Показания к применению**

Мегейс - прогестагенный агент, показан для лечения определенных гормонозависимых новообразований, таких как рак молочной железы.

## **Дозировка и способ применения**

Рак молочной железы: 160 мг / день принимается один раз в день.

Не менее двух месяцев непрерывного лечения считается адекватным периодом для определения эффективности Мегейс.

Дети:

Безопасность и эффективность в педиатрических больных не были исследованы. Мегейс не рекомендуется для детей.

Пожилые люди:

Как правило, использование у пожилых пациентов должно быть осторожным, отражая большую частоту снижения функции печени, почек или сердца, а также сопутствующих заболеваний или другой лекарственной терапии.

## **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к действующему веществу или любому из вспомогательных веществ.

## **Особые предупреждения и меры предосторожности при использовании**

Мегасе следует использовать с осторожностью у пациентов с историей тромбоза и у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени.

Этот продукт должен использоваться под наблюдением специалиста, а пациенты должны находиться под постоянным наблюдением. Препарат может оказывать адренкортикальное действие. Это следует учитывать при наблюдении пациентов.

Пациенты с редкими наследственными проблемами непереносимости галактозы, тотального дефицита лактазы или нарушения всасывания глюкозы и галактозы не должны принимать это лекарство.

Недостаточные данные клинических исследований ацетата мегестерола доступны для пациентов в возрасте 65 лет и старше, чтобы определить, реагируют ли они иначе, чем пациенты более молодого возраста. Другой зарегистрированный клинический опыт не выявил различий в ответах пожилых и молодых пациентов. Как правило, использование у пожилых пациентов должно быть осторожным, отражая большую частоту снижения функции печени, почек или сердца, а также сопутствующих заболеваний или другой лекарственной терапии. Известно, что ацетат мегестерола в значительной степени выводится почками, и риск токсических реакций на этот препарат может быть выше у пациентов с нарушениями функции почек. Поскольку пожилые пациенты с большей вероятностью имеют снижение почечной функции, следует проявлять осторожность во время лечения ацетатом мегестерола, и это может быть полезно для мониторинга почечной функции.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие формы взаимодействия**

Исследования взаимодействия не проводились.

## **Беременность и кормление грудью**

Мегасе не рекомендуется для женщин, которые беременны или кормят грудью.

В нескольких сообщениях предполагается связь между внутриутробным воздействием прогестагенных препаратов в первом триместре беременности и генитальными аномалиями у мужских и женских плодов. Риск гипоспадии, 5-8 на 1000 рождений мужчин в общей популяции, может примерно удвоиться при воздействии прогестагенных препаратов. Недостаточно данных для количественной оценки риска заражения плодов женского пола, однако некоторые из этих препаратов вызывают легкую вирилизацию наружных половых органов плодов женского пола.

Если пациентка подвергается воздействию Мегейс в течение первых четырех месяцев беременности или если она забеременела во время приема препарата, она должна быть проинформирована о потенциальных рисках для плода.

Женщинам с детородным потенциалом следует рекомендовать избегать беременности.

#### *Грудное вскармливание*

Из-за потенциальных побочных эффектов, лечение следует прекратить во время лечения с Мегасе.

## **Влияние на способность управлять автомобилем и использовать машины**

Не известно влияние мегестрола ацетата на способность управлять автомобилем или работать с ним.

## **Побочное действие**

*Увеличение массы тела* является частым эффектом при применении препарата Мегейс у больных раком молочной железы или эндометрия и является следствием повышенного аппетита.

*Тромбоэмболия:* сообщалось о случаях тромбоэмболии, включая тромбоз вен и эмболию легкого.

*Прочие побочные эффекты:* тошнота, рвота, отеки и кровяные выделения из полости матки, не связанные с менструациями, отмечаются приблизительно у 1-2% больных; сообщалось о наличии у больных одышки, болей, сердечной недостаточности, артериальной гипертензии, приливов, изменений настроения, кушингоидных признаков на лице, временной активизации развития опухоли (в отсутствие или при наличии гиперкальциемии), гипергликемии, алопеции, синдрома запястного канала, диареи, летаргии, кожных высыпаний.

Сообщалось о развитии патологических состояний, связанных с *нарушением функционирования гипофизарно - надпочечниковой системы:* непереносимость глюкозы, возникновение сахарного диабета и обострение имеющегося сахарного диабета со снижением толерантности к глюкозе и синдромом Кушинга. В редких случаях у больных вскоре после прекращения лечения препаратом Мегейс наблюдались клинические

признаки надпочечниковой недостаточности. Следует иметь в виду возможность подавления функции надпочечников у всех больных, принимающих препарат в течение длительного времени, а также после отмены препарата. В таких случаях могут быть показаны ударные дозы ГКС в качестве заместительной терапии.

## **Передозировка**

Никаких острых токсикологических эффектов не было получено в результате исследований, включающих Мегейс (ацетат мегестрола), вводимый в дозах до 1600 мг / день в течение шести месяцев и более.

Сообщения о передозировке были также получены в условиях постмаркетинга. Признаки и симптомы, о которых сообщалось в контексте передозировки, включали диарею, тошноту, боль в животе, одышку, кашель, неустойчивую походку, вялость и боль в груди. Не существует специфического противоядия от передозировки с Megace. В случае передозировки должны быть приняты соответствующие поддерживающие меры.

## **Условия хранения препарата Мегейс**

Хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

## **Срок годности**

3 года.

## **Условия реализации**

Препарат отпускается по рецепту.