Эстрацит — Estracyt (Эстрамустин)

Владелец регистрационного удостоверения: PHARMACIA ITALIA, S.p.A. (Италия)

Код АТХ: L01XX11 (Estramustine)

Активное вещество: эстрамустин (estramustine) Rec.INN зарегистрированное ВОЗ

Форма выпуска, упаковка и состав препарата Эстрацит

Капсулы желатиновые, белые, непрозрачные; содержимое капсул — порошок белого цвета.

	1 капс.
эстрамустина фосфата динатриевая соль (эквивалентно эстрамустина фосфата)	140 мг

Вспомогательные вещества: натрия лаурилсульфат, тальк, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

40 шт. — флаконы темного стекла (1) — пачки картонные.
100 шт. — флаконы темного стекла (1) — пачки картонные.

Лиофилизат для приготовления раствора для в/в введения	**1 фл.**
эстрамустина фосфата динатриевая соль (эквивалентно эстрамустина фосфата)	300 мг

Вспомогательные вещества: меглумин, маннитол.

Растворитель: вода д/и — 8 мл.

Флаконы стеклянные (10) в комплекте с растворителем (амп. 10 шт.) — пачки картонные.

Клинико-фармакологическая группа: Противоопухолевый препарат

Фармако-терапевтическая группа: Противоопухолевое средство, алкилирующее соединение

Фармакологическое действие

Эстрацит (конъюгат эстрадиола и азотистого иприта) представляет собой противоопухолевый препарат с двойным механизмом действия. Установлено, что эстрон и эстрадиол (получающиеся в результате биотрансформации эстрамустина фосфата) обладают антигонадотропной активностью и вызывают снижение уровня тестостерона, сходное с таковым после хирургической кастрации.

В процессе дефосфорилирования эстрацита образуется эстрамустин, который далее биотрансформируется в эстромустин. Эти метаболиты обладают антимитотическим действием за счет ингибирования образования микротрубочек в метафазу и их разрушением в интерфазу митоза.

Фармакокинетика

Распределение и метаболизм

После в/в введения неизмененный эстрамустина фосфат обнаруживается в плазме крови, однако он быстро биотрансформируется с образованием эстрамустина и далее — эстромустина, который является основным метаболитом, присутствующим в плазме. Связывание эстрамустина и эстромустина с белками плазмы высокое. Эстрамустин и эстромустин подвергаются дальнейшей биотрансформации с образованием эстрогенов — эстрадиола и эстрона.

После введения препарата эстрамустин и эстромустин обнаруживаются в опухолевой ткани предстательной железы человека. Концентрации эстрамустина и эстромустина в опухолевой ткани выше, чем в плазме. Возможно, это объясняется тем, что эстрамустин и эстромустин поглощаются тканью предстательной железы за счет их связывания с особым белком, который был обнаружен в опухолевой ткани предстательной железы.

Выведение

Эстрамустин и эстромустин выделяются с желчью и калом и не

обнаруживаются в моче. Эстрадиол и эстрон подвергаются дальнейшему метаболизму и частично выделяются с мочой.

Показания препарата Эстрацит

- поздние стадии рака предстательной железы, особенно при рефрактерности к гормональной терапии;
- первичная терапия рака предстательной железы при наличии прогностических факторов, указывающих на возможную низкую эффективность гормональной терапии.