ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ПРОСТЕРИД®
(PROSTERID®)

Регистрационный номер: .....

Торговое название: ПРОСТЕРИД
Международное непатентованное название (МНН): финастерид
Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

СОСТАВ
Действующее вещество: финастерид 5 мг
Вспомогательные вещества в ядре таблетки: магния стеарат, тальк, натрия карбоксиметилкрахмал (типа А), крахмал прежелатинизированный, целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат.
Состав пленочной оболочки: титана диоксид, лактозы моногидрат, макрогол 6000, гидроксипропилцеллюлоза, гипромеллоза.

Описание
Белые или почти белые, слегка двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой, формы закругленного треугольника, почти без запаха. На одной стороне таблеток - гравировка «RG».

Фармакотерапевтическая группа: 5-α-редуктазы ингибитор.
Код АТХ: G04C B01

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА
Фармакодинамика Финастерид является синтетическим 4-азастероидным соединением, конкурентным и специфическим ингибитором изоэнзима II типа стероидной 5-α-редуктазы, преобразующей тестостерон в активный андроген 5-α-дигидротестостерон (ДГТ). Финастерид препятствует стимулирующему действию тестостерона на развитие опухоли; подавление образования дигидрогеназы сопровождается уменьшением объёма предстательной железы, увеличением максимальной скорости оттока мочи и уменьшением симптомов непроходимости мочевыводящих путей. При постоянном приёме статистически значимый эффект регистрируется через 3 месяцев (уменьшение объёма железы) и 7 месяцев. (уменьшение выраженности симптомов, связанных с гиперплазией предстательной железы).
В организме человека встречаются 2 вида 5-α-редуктазы: I и II. Их распределение в тканях не одинаково: в простате, яичках и их придатках, головке полового члена, мошонке, семенных везикулах, печени и в грудной клетке встречается изоэнзим II типа; I тип встречается, главным образом, в коже головы, спины и груди, сальных железах, в печени, надпочечниках и почках. Финастерид угнетает в первую очередь изоэнзим II типа, ответственный за большую часть ДГТ в крови. Одноразовая доза финастерида быстро и существенно изменяет уровень ДГТ в плазме. Однократная 5 мг доза финастерида снижает уровень ДГТ в плазме на 75%, который на 24 часу достигает своего минимума, затем, в течение 7 дней возвращается к исходному уровню.

При многократном приёме финастерид сохраняет эффективность. Финастерид снижает уровень ДГТ в самой простате на ≤15% и обеспечивает соответствующее увеличение уровня тестостерона в простате. По сравнению с хирургическим или химическим кастрированием, лечение финастеридом сопровождается значительно большим снижением уровня ДГТ в простате.

Простатоспецифический антиген (ПСА) – чувствительный и специфический андрогенозависимый маркер карциномы простаты. В большинстве случаев, после нескольких месяцев лечения финастеридом наблюдается быстрое снижение уровня ПСА, и затем установление на новых исходных отметках.

После 1 года приёма 5 мг доз финастерида средняя концентрация ПСА снижается на 50%.

Финастерид не проявляет сродства к андрогенным рецепторам и не оказывает иного гормонального действия. Вслед за открытием 5-α-редуктазы и описанием синдрома недостаточности 5-α-редуктазы II типа (гермафродитизм мужского типа) роль андрогенов в доброкачественной гиперплазии простаты была вновь пересмотрена.

Развитие простаты зависит от ДГТ, сильного андрогена. При недостаточности 5-α-редуктазы на фоне нормального или высокого уровня тестостерона во взрослом возрасте наблюдается атрофия простаты.

ДГТ активирует андрогенные рецепторы, образовав после присоединения к ним димеры, которые, вступая в связь с ДНК, прямо или косвенно способствуют пролиферации клеток за счёт изменения экспрессии генов, отвечающих за пролиферацию и апоптоз. В интактной простате процессы апоптоза и пролиферации находятся в равновесии. Несмотря на то, что факторы, провоцирующие гиперплазию простаты на молекулярном уровне не известны, роль ДГТ в этом весьма вероятна. Специфические ингибиторы 5-α-редуктазы II типа способны снижать уровень ДГТ в простате и способствовать обратному развитию гиперплазированной простаты.

Отмечалась значительная летальность у мышей и крыс обоих полов при скармливании первым однократной дозы финастерида, равной 1500 мг/м^2 (500 мг/кг), а вторым - 2360 мг/м^2 (400 мг/кг - самкам) и 5900 мг/м^2 (1000 мг/кг - самцам). Малые дозы препарата, скармливаемые беременным крысам, вызывали пороки развития гениталий у самцов-потомков.

Фармакокинетика Всасывание: быстро всасывается из желудочнокишечного тракта, через 2 ч достигает максимальной концентрации в плазме, равной 37 нг/мл. При многократном дозировании или после него существенной разницы в периоде полувыведения и во времени наступления максимальной концентрации нет. В ходе 7-дневного приёма кумулирования не наблюдается, стадия насыщения наступает после 4 дня. Приём пищи не влияет на всасывание и концентрацию в плазме. Биодоступность: 80%.

Распределение: снижение почечной функции не влияет на связь с плазменными белками, которая составляет 90%. Финастерид хорошо проникает в ткани и биологические жидкости, т.ч. в мозговую, и в сперму. При инфундировании 5 мг финастерида в течение 1 ч, объём распределения составляет 76±14 л.

Метаболизм: подвергается интенсивному метаболизму (окислению) в печени. Среди 5 метаболитов 2 – активные, их ингибирующая активность составляет 20% от таковой финастерида.

Выведение: период полувыведения не зависит от дозы и составляет 4,7-7,1 ч. Биологическое действие однократной дозы сохраняется примерно в течение 4 дней. Плазменный клиренс: 164±55 мл/мин. Около 39% (32%-46%) выводится с мочой в виде метаболитов, ≈ 57% (51%-64%) - с каловыми массами. 0,04% ±0,02% дозы выводится с мочой в неизменённой форме и 0,01% - с каловыми.

массами. Концентрация финастерида в сперме колеблется от неопределяемой (< 1 нг/мл) до 21 нг/мл.
Длительный, 3-7-месячный приём в дозе 5 м/день снижает концентрацию 5α-ДГТ в сыворотке крови на 70%.
Пожилой возраст: в возрасте 46-60 лет и старше 70 лет кинетика финастерида носит нелинейный характер. В старшей группе отмечается умеренное, но не существенное в клиническом отношении увеличение плазменной концентрации.
Болезни почек: после однократной 10 мг дозы разницы в главных кинетических показателях - период полувыведения, AUC и максимальная концентрация - при клиренсах ≥90, 30-50 и <30 мл/мин не наблюдается.

Показания к применению
Доброкачественная гиперплазия предстательной железы (для уменьшения размеров предстательной железы, увеличения максимальной скорости оттока мочи и уменьшения симптомов, связанных с гиперплазией, снижения риска возникновения острой задержки мочи и связанной с этим вероятности хирургического вмешательства).

Противопоказания
Повышенная чувствительность к составным компонентам препарата, рак предстательной железы, обструкция мочевыводящих путей, детский возраст.
С осторожностью: печёночная недостаточность.
Беременность и период лактации: препарат не должен назначаться женщинам.

Способ применения и дозы
Предназначен исключительно для мужчин.
Обычная суточная доза: 1 таблетка (5 мг), в течение не менее 6 мес.
Пожилой возраст: изменение дозы не требуется, несмотря на замедленное выведения из организма (около 8 ч).
Почечная недостаточность: снижение дозы не требуется, т.к. выведение осуществляется преимущественно с каловыми массами; основные кинетические параметры (период полувыведения, максимальная концентрация, AUC) сходны с таковыми здоровых людей.

Побочное действие
Лечение обычно хорошо переносится, описанные побочные реакции не слишком часты и чаще всего носят лёгкую форму и временный характер.
Наиболее частые побочные реакции: импотенция, снижение либидо, уменьшение количества эякулята.
Возможны гинекомастия, болезненность грудных желез , иногда - реакции повышенной чувстви-тельности (отёк губ, кожная сыпь), повышение концентрации лютеинизирующего и фолликулостимулирующего гормонов в крови (примерно, на 10%, при этом они остаются в пределах нормы).

Передозировка
Максимальная однократная доза финастерида в 400 мг, а также ежедневный приём 80 мг дозы на протяжении 3 месяцев не вызвали развития побочных реакций.
При передозировке нет необходимости в проведении специфического лечения.

Взаимодействие с лекарственными препаратами
Клинически значимого взаимодействия с другими препаратами не обнаружено.

Особые указания
Прежде, чем приступить к лечению финастеридом, следует исключить наличие заболеваний, симулирующих доброкачественную гиперплазию предстательной железы: рак простаты, стриктуру уретры, гипотонию мочевого пузыря, нарушение его иннервации, инфекционный простатит. Улучшение наступает не сразу, поэтому при больших остаточных объёмах мочи или тяжёлых формах затруднения мочеиспускания целесообразно установить наблюдение за больным во избежание развития обструктивной уропатии.
Финастерид вызывает снижение ПСА на 48% через 12 мес. после приёма (даже при одновременном наличии карциномы простаты), затрудняя распознавание карциномы простаты, поэтому рекомендуется проводить предварительное ректальное дигитальное обследование органа, затем периодически повторять его в ходе лечения для исключения наличия карциномы.
Малые дозы финастерида могут вызывать нарушения развития наружных гениталий у плода мужского пола при попадании препарата каким-либо путём в организм беременной женщины. Количества финастерида, всасывающиеся при прикосновении с разломанной таблеткой или со спермой мужчины, принимавшего финастерид, неизвестны. Во избежание поражения плода мужского пола беременные женщины и женщины с подозрением на беременность не должны прикасаться к разломанным таблеткам финастерида и к сперме мужчин, находящихся на лечении этим препаратом. В связи с тем, что остаётся неизвестным как долго после окончания лечения финастерид продолжает выделяться со спермой, мужчинам рекомендуется продолжать соблюдать меры предосторожности и в последующие после завершения курса лечения 2 месяца.
Рекомендуется проводить лабораторные анализы функции печени и почек, осадка мочи перед лечением и каждые 6 месяцев в ходе его.

Влияние на способность управления автомобилем и рабочими механизмами
Не наблюдалось.

Форма выпуска
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг.14 таблеток в блистере из AL/ПВХ. 1 или 2 блистера с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения
Хранить при температуре 15-30°С, в защищенном от света и недоступном для детей месте.

Срок годности
3 года. Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
По рецепту.

Производитель
«Гедеон Рихтер» А.О.
1103 Будапешт, ул. Дъемреи, 19-21,Венгрия.

Претензии потребителей направлять по адресу:
Московское Представительство «Гедеон Рихтер» А.О.:

Директор ИДКЭЛС, профессор В.В. Чельцов

Менеджер по регистрации
Московского
Представительства
«Гедеон Рихтер» А.О. Кирюхина О.Ю.