

Состав

действующее вещество: финастерид;

1 таблетка содержит финастерида 5 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, 30, натрия крахмала (тип А), натрия докузат, магния стеарат, гипромеллоза 2910/5, макрогол 6000, тальк, титана диоксид (Е 171), симетикона эмульсия SE4, железа оксид желтый (Е 172).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые оболочкой.

Основные физико-химические свойства: желтого цвета круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой, диаметром 7,1 мм.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые при доброкачественной гипертрофии предстательной железы. Код АТХ G04C B01.

Фармакодинамика

Финастерид - это специфический ингибитор 5-альфа-редуктазы типа II, внутриклеточного фермента, который превращает тестостерон в более активный андроген дигидротестостерон (ДГТ). При доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ) ее увеличение зависит от превращения тестостерона в ДГТ в тканях простаты. Финастерид высокоэффективно снижает как циркулирующий, так и внутришньюпростатичный ДГТ. Финастерид не имеет родства с рецепторами андрогенов.

В клинических исследованиях с участием пациентов, имевших умеренные и тяжелые проявления доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ), увеличенную предстательную железу при пальцевом ректальном обследовании и низкий остаточный объем мочи, финастерид уменьшил частоту острой задержки мочи с 7/100 до 3/100 за четыре года и необходимость хирургического вмешательства (трансуретрорезекции предстательной железы и простатэктомии) с 10/100 до 5/100. Это уменьшение сопровождалось улучшением на 2 пункта по шкале оценки симптомов QUASI-AUA (диапазон 0-34), в значительной регрессией объема простаты примерно на 20%, и

значительным увеличением скорости потока мочи.

Исследование MTOPS (Медицинское лечение простатических симптомов) было 4-6-летним исследованием с участием 3047 мужчин с симптоматической ДГПЖ, которые были рандомизированы для приема финастерида в дозе 5 мг/день, доксазосину - 4 или 8 мг/день, комбинации финастерида - 5 мг/день и доксазосину - 4 или 8 мг/день или плацебо. Первичной конечной точкой наблюдения было время до клинического прогрессирования ДГПЖ (которое определялось как увеличение с начала на 4 и более пунктов по шкале оценки симптомов, эпизод острой задержки мочи, связанная с ДГПЖ почечная недостаточность, рецидив инфекции мочевыводящих путей или уросепсис, недержание мочи). По сравнению с плацебо лечение финастеридом, доксазосином или комбинацией значительно снизило риск клинического прогрессирования ДГПЖ соответственно на 34% ($p = 0,002$), 39% ($p < 0,001$) и 67% ($p < 0,001$). Большинство случаев (274 из 351) прогрессирования ДГПЖ были подтверждены увеличением на ≥ 4 пунктов по шкале оценки симптомов под влиянием лечения риск прогрессирования симптомов был снижен на 30% (95% интервал доверия 6-48%), 46% (95% интервал доверия 25-60%) и 64% (95% интервал доверия 48-75%) соответственно в группах приема финастерида, доксазосину и комбинации по сравнению с плацебо. Острая задержка мочеиспускания наблюдалась в 41 из 351 случае прогрессирования ДГПЖ; под влиянием лечения риск развития острой задержки мочеиспускания был снижен на 67% ($p = 0,011$), 31% ($p = 0,296$) и 79% ($p = 0,001$) соответственно в группах приема финастерида, доксазосину и комбинации по сравнению с плацебо. Только группы приема финастерида и комбинированной терапии имели существенную разницу с группой приема плацебо.

Фармакокинетика

У мужчин после однократного приема дозы финастерида, меченого изотопами углерода ^{14}C , 39% принятой дозы выделялось с мочой в форме метаболитов (предположительно, с мочой выделялась также незначительное количество неизмененного финастерида). 57% принятой дозы выводилось с калом. Установлено, что двум метаболитам финастерида свойственно менее выражена угнетающее действие по отношению к 5-альфа-редуктазы. Биодоступность финастерида при пероральном приеме составляет примерно 80%. Прием пищи не влияет на биодоступность препарата. Максимальная концентрация финастерида в плазме крови достигается через 2 часа после перорального приема. Абсорбция препарата из желудочно-кишечного тракта заканчивается через 6-8 часов после приема. Период полувыведения финастерида в плазме крови в среднем составляет 6 часов. Связывание с белками плазмы крови - 93%.

Системный клиренс составляет примерно 165 мл/мин, объем распределения - 76,1 литра.

В пожилом возрасте скорость выведения финастерида несколько снижается. У мужчин в возрасте от 70 лет период полувыведения финастерида составляет примерно 8 часов, тогда как у лиц в возрасте от 18 до 60 лет - 6 часов. Но это не является показанием для отмены препарата у лиц старшего возраста.

У пациентов с хронической почечной недостаточностью (клиренс креатинина от 9 до 55 мл/мин) не выявлено разницы скорости выведения однократной дозы финастерида, меченого изотопами углерода ^{14}C , по сравнению со здоровыми добровольцами. Связывание с белками плазмы крови у этих групп пациентов также не отличалась. Это объясняется тем, что у пациентов с почечной недостаточностью доля метаболитов финастерида, которая в нормальных условиях выделяется с мочой, выводится с калом. Это подтверждается увеличением у этих пациентов количества метаболитов финастерида в кале при одновременном снижении их концентрации в моче. В связи с вышеизложенным для пациентов с почечной недостаточностью, которым не показан гемодиализ, коррекция дозы финастерида не нужна.

Данные о фармакокинетике препарата у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют.

Финастерид проникает через гематоэнцефалический барьер. Небольшое количество финастерида проявляли в семенной жидкости.

Показания

Лечение и контроль доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ) у пациентов с увеличенной предстательной железой с целью:

- уменьшение размеров (регрессии) увеличенной железы, улучшения оттока мочи и уменьшения симптомов, связанных с ДГПЖ;
- снижение риска возникновения острой задержки мочи и необходимости хирургического вмешательства, в том числе трансуретрорезекции предстательной железы и простатэктомии.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к финастерида или другим компонентам препарата.

Финастерид противопоказан женщинам и детям.

Беременность: применением женщинам, когда они являются или могут потенциально быть беременными (см. Раздел «Применение в период беременности или кормления грудью»).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Не выявлено клинически значимого взаимодействия с другими препаратами. Финастерид не оказывает заметного влияния на ферментную систему, которая метаболизирует препараты, связанные с цитохромом P450. Хотя риск того, что финастерид влияет на фармакокинетику других лекарственных средств, оценивается как небольшой, существует вероятность того, что ингибиторы и индукторы цитохрома P450 3A4 влияют на концентрацию финастерида в плазме крови. Однако, учитывая установленные показатели безопасности, любое повышение концентрации финастерида в связи с одновременным применением ингибиторов цитохрома P450 3A4 вряд ли будет иметь клиническое значение. Проверены на добровольцах соединения включают пропранолол, дигоксин, глибурид, варфарин, теофиллин и антипирин; при этом не было найдено клинически значимых взаимодействий.

Другая сопутствующая терапия. Хотя специальных исследований взаимодействия не проводили, в клинических исследованиях финастерид применяли совместно с ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента альфа-блокаторами, бета-блокаторами, блокаторами кальциевых каналов, нитратами, диуретиками, антагонистами H₂-рецепторов, ингибиторами ГМГ-КоА-редуктазы, нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), в том числе аспирином и парацетамолом, хинолонами и бензодиазепинами. При этом не выявлено клинически значимых нежелательных взаимодействий.

Особенности применения

Общие мероприятия.

Необходимо тщательно контролировать состояние пациентов с большим остаточным объемом мочи и/или резко сниженным течением мочи в связи с возможным развитием обструктивной уropатии. Следует рассмотреть возможность проведения хирургического вмешательства как альтернативный вариант.

Влияние на простатоспецифический антиген (ПСА) и диагностику рака предстательной железы.

До сих пор не показано благоприятного клинического влияния лечения финастеридом у пациентов, больных раком предстательной железы. Пациенты с аденомой предстательной железы и повышенным уровнем ПСА наблюдались в контролируемых клинических исследованиях, во время которых несколько раз определялись уровни ПСА и проводилась биопсия предстательной железы. В этих исследованиях лечение финастеридом не влияло на частоту выявления рака предстательной железы. Общая частота возникновения рака предстательной железы существенно не отличалась в группах пациентов, получавших финастерид или плацебо.

Перед началом лечения и периодически во время лечения финастеридом рекомендуется проверять пациентов путем ректального исследования, а также другими методами на предмет наличия рака предстательной железы. Определение сывороточного ПСА также используется для выявления рака простаты. В общем, при базисном уровне ПСА более 10 нг/мл следует проводить тщательное обследование пациента, включая, при необходимости, проведения биопсии. При уровне ПСА в пределах 4-10 нг/мл рекомендуется дальнейшее обследование пациента. Существует значительное совпадение в уровнях ПСА у мужчин, страдающих раком предстательной железы и которые не имеют этого заболевания. Итак, у мужчин, больных аденомой предстательной железы, нормальные значения ПСА не позволяют исключить рак предстательной железы, независимо от лечения финастеридом. Базовый уровень ПСА ниже 4 нг/мл не исключает наличия рака простаты.

Финастерид приводит к уменьшению содержания сывороточного ПСА приблизительно на 50% у пациентов с аденомой предстательной железы, даже при наличии рака простаты. Это необходимо принять во внимание при оценке уровня ПСА, поскольку это снижение не исключает сопутствующего рака простаты. Для корректной интерпретации у большинства пациентов, получающих финастерид в течение 6 месяцев и более, значения ПСА должны быть удвоены по сравнению с нормальными значениями у лиц, не принимающих лечение. Такая коррекция позволяет сохранить чувствительность и специфичность определения ПСА и поддерживает его способность выявлять рак предстательной железы.

При любом длительном повышении уровня ПСА у пациента, получающего лечение финастеридом 5 мг, необходимо тщательное обследование для выяснения причин, включая несоблюдение режима приема финастерида.

Влияние на лабораторные данные

Влияние на уровень ПСА

Уровень ПСА в сыворотке крови коррелирует с возрастом пациента и объемом простаты, при этом объем простаты коррелирует с возрастом пациента. При оценке лабораторных показателей ПСА необходимо учитывать тот факт, что уровень ПСА снижается в процессе лечения финастеридом. У большинства пациентов наблюдается быстрое снижение ПСА в течение первых месяцев лечения, после чего уровень ПСА стабилизируется на новом уровне, который составляет примерно половину от базовой величины. С этой точки зрения у типовых пациентов, получающих финастерид в течение 6 месяцев и более, значения ПСА должны быть удвоены по сравнению с нормальными значениями у лиц, не принимающих лечение.

Финастерид существенно не уменьшает процент свободного ПСА (отношение свободного ПСА к общему). Отношение свободного и общего ПСА остается постоянным даже под влиянием финастерида. При определении процента свободного ПСА, который применяется для диагностики рака простаты, корректировки его значений не является обязательным.

Рак молочной железы у мужчин

Во время клинических исследований и в постмаркетинговый период сообщалось о раке молочной железы у мужчин, принимавших финастерид, дозировкой 5 мг. Врачи должны проинструктировать своих пациентов о необходимости немедленного сообщения о любых изменениях в тканях молочной железы, а именно - о припухлости, боли, гинекомастии или выделениях из сосков.

Изменения настроения и депрессия

Сообщалось, о случаях изменения настроения, включая депрессивное настроение, депрессию и, реже, мысли о самоубийстве у пациентов, получавших финастерид в дозе 5 мг. Необходимо наблюдение за пациентами для возникновения психических симптомов, и в случае их возникновения пациенту нужно посоветовать обратиться за медицинской помощью.

Лактоза

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции не следует применять этот препарат.

Печеночная недостаточность

Влияние печеночной недостаточности на фармакокинетику финастерида не исследовалась.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Препарат не влияет на способность управлять автомобилем или работать с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Применение в период беременности.

Пенестер противопоказан.

Действие финастерида: риск для плода мужского пола.

Женщинам, которые могут забеременеть или беременные, необходимо избегать контакта с измельченными таблетками финастерида или утратившими целостность, из-за возможности проникновения в организм финастерида и последующий потенциальный риск для плода мужского пола (см. Раздел «Применение в период беременности» выше). Таблетки препарата покрытые оболочкой, и это предотвращает контакт с активным ингредиентом при условии, что таблетки не измельченные и не утратили целостности.

Имеющиеся данные о выделении небольшого количества финастерида из спермы пациента, принимал финастерид 5 мг/сут. Неизвестно, может ли на плод мужского пола негативно повлиять то, что на его мать влияла сперма пациента, который лечился финастеридом. Если половая партнерша пациента или может потенциально быть беременной, пациенту рекомендуется избегать воздействия спермы на партнершу.

Из-за способности ингибиторов 5-альфа-редуктазы типа II тормозить превращение тестостерона в дигидротестостерон, эти препараты, включая финастерид, могут вызвать нарушения в развитии наружных половых органов у плода мужского пола.

Таблетки препарата покрытые оболочкой и это предотвращает контакт с активным ингредиентом при условии, что таблетки не измельченные и не утратили целостности.

Применение в период кормления грудью.

Пенестер не показан женщинам. Неизвестно, проникает финастерид в грудное молоко.

Способ применения и дозы

Рекомендуемая доза - 1 таблетка по 5 мг 1 раз в сутки независимо от приема пищи.

Финастерид можно применять в качестве монотерапии или в комбинации с альфа-блокаторами доксазозином.

Срок лечения определяет врач индивидуально. Несмотря на то, что улучшение симптоматики может наблюдаться ранее, для оценки эффективности действия необходимо как минимум шестимесячный прием препарата, после чего необходимо продолжить лечение. Риск возникновения острой задержки мочи снижается в течение четырех месяцев после окончания лечения.

Для пациентов с почечной недостаточностью различной степени тяжести (при снижении клиренса креатинина до 0,9 мл/мин) коррекции дозы не требуется, поскольку фармакокинетические исследования не выявили никаких изменений в распределении финастерида.

Нет данных относительно применения препарата пациентам с нарушениями функции печени.

Для пациентов пожилого возраста коррекция дозы не требуется.

Не применять детям.

Дети

Пенестер противопоказан детям.

Безопасность и эффективность для применения лекарственного средства детям не установлены.

Передозировка

У пациентов, получавших финастерид в дозе до 400 мг однократно и в дозе до 80 мг в сутки в течение 3 месяцев, любые нежелательные эффекты отсутствовали.

Не существует специальных рекомендаций по лечению передозировки финастерида.

Побочные реакции

Наиболее частыми побочными эффектами являются импотенция и снижение либидо. Эти побочные реакции возникают в начале курса терапии и проходят при дальнейшем лечении у большинства пациентов.

Побочные реакции, о которых сообщалось в ходе клинических исследований и/или во время постмаркетингового применения, указанные ниже в таблице.

Частота побочных реакций определена как: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ - $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ - $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$ - $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), неизвестно (нельзя подсчитать по имеющимся данным).

Системы органов	Частота проявлений
Со стороны иммунной системы	Неизвестно: реакции повышенной чувствительности, такие как ангионевротический отек (в том числе отек губ, языка, горла и лица)
Со стороны психики	Часто: снижение либидо. Неизвестно: снижение либидо, которое может продлиться после прекращения терапии, депрессия, тревожность.
Со стороны сердечно-сосудистой системы	Неизвестно: учащенное сердцебиение.
Со стороны печени и желчевыводящих путей	Неизвестно: повышенный уровень ферментов печени.
Со стороны кожи и подкожных тканей	Нечасто: сыпь. Неизвестно: зуд, крапивница.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез	Часто: импотенция. Нечасто: расстройство эякуляции, болезненность и увеличение молочных желез. Неизвестно: боль в яичках, гематоспермия, половые расстройства (эректильная дисфункция и расстройства эякуляции), которые могут продолжаться после прекращения лечения; мужское бесплодие и/или обратимые нарушения качества спермы (о нормализации или улучшения качества спермы сообщалось после прекращения приема финастерида).
По исследованиям	Часто: уменьшение эякулята.

Кроме того, во время клинических исследований и в постмаркетинговом применении сообщалось о раке молочной железы у мужчин, принимавших финастерид (см. Раздел «Особенности применения»).

Медикаментозное лечение симптомов со стороны простаты

В исследовании MTOPS сравнивали финастерид в дозе 5 мг/день (n = 768), доксазосин - 4 или 8 мг/день (n = 756), комбинированную терапию финастеридом - 5 мг/день и доксазосином - 4 или 8 мг/день (n = 786), и плацебо (n = 737). Профиль безопасности и переносимости комбинированной терапии отвечал профилям отдельных компонентов. Частота появления расстройств со стороны эякуляции у пациентов, принимавших комбинированную терапию, составила: финастерид - 8,3%, доксазосин - 5,3%, комбинированная терапия - 15%, плацебо - 3,9%.

Другие данные длительных исследований

В семилетнем плацебо-контролируемом исследовании, к которому было привлечено 18882 здоровых мужчины, из которых в 9060 были получены данные игольной биопсии предстательной железы, доступные для анализа, рак предстательной железы был обнаружен в 803 (18,4%) мужчин, принимавших финастерид, и в 1147 (24,4%) мужчин, принимавших плацебо. В группе приема

препарата финастерид 280 (6,4%) мужчин имели рак простаты с баллами Глисона 7-10, обнаруженного при игольной биопсии, по сравнению с 237 (5,1%) мужчинами в группе приема плацебо. Дополнительные анализы указывают на то, что увеличение преимущества рака предстательной железы высокой степени, что наблюдалось в группе приема финастерид, можно объяснить влиянием финастерид на объем простаты. Из общего количества случаев рака предстательной железы, диагностированного в этом исследовании, 98% случаев были классифицированы как Интракапсулярная (стадия T1 или T2) рак. Информация о связи между длительным применением финастерид и опухолями с баллами Глисона 7-10 отсутствует.

Данные лабораторных анализов

Уровень ПСА в сыворотке крови коррелирует с возрастом пациента и объемом простаты, при этом объем простаты коррелирует с возрастом пациента. При оценке лабораторных показателей ПСА необходимо учитывать тот факт, что уровень ПСА снижается в процессе лечения финастеридом (см. Раздел «Особенности применения»).

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Не требует специальных условий хранения. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 15 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ООО «Зентива».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

В кабеловны 130, 102 37 Прага 10, Долни Мехолупы, Чешская Республика.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).