

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату:

**ПРОСКАР—
(PROSCAR®)****Загальна характеристика:**

міжнародна та хімічна назви: фінастерид; N-(1,1-диметилетил)-3-оксо-4-аза-5 α -ост-1-ене-17 - карбоксамід;

основні фізико-хімічні властивості: таблетки у формі яблука, голубого кольору, покриті плівкою, з написами "MSD 72" на одному боці і написом "PROSCAR" - на іншому;

склад: 1 таблетка містить 5 мг фінастериду;

допоміжні речовини – лактоза (одноводна), крохмаль дожелатинізований, натрію крохмалт гліколят, заліза оксид, натрію докузат, целюлоза мікросталічна, магнію стеарат, метилгідроксипропілцелюлоза, гідроксипропілцелюлоза з 0,3 % кремнію діоксидом, титану діоксид, тальк, індигокармін алюмінієвий лак.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Засоби, які застосовують при доброякісній гіпертрофії передміхурової залози. Код АТС G04C B01.

Фармакологічні властивості. Фінастерид - синтетична 4-азастероїдна сполука. Це специфічний інгібітор 5-альфа-редуктази типу II, внутрішньоклітинного ферменту, який перетворює тестостерон у більш активний андроген дигідротестостерон (ДГТ). При аденомі передміхурової залози її збільшення залежить від перетворення тестостерону у ДГТ у тканинах простати. Фінастерид високоефективно знижує як циркулюючий, так і внутрішньопростатичний ДГТ. Фінастериду не властива схильність до рецепторів андрогенів.

Фармакокінетика.

У чоловіків після одноразового перорального прийому дози фінастериду, міченого ізотопами вуглецю ¹⁴C, 39 % прийнятої дози виділялося з сечею у формі метаболітів (імовірно, з сечею виділялась також незначна кількість незміненого фінастериду). 57 % прийнятої дози виводилось із калом.

Дослідженнями також встановлено, що двом метаболітам фінастериду властива менш виражена пригнічуюча дія по відносу до 5-альфа-редуктази.

Біодоступність фінастериду при пероральному прийомі становить приблизно 80 %. Прийом їжі не порушує біодоступність препарату. Максимальна концентрація фінастериду у плазмі крові досягається приблизно через 2 години після перорального прийому. Абсорбція препарату з шлунково-кишкового тракту закінчується через 6–8 годин після його прийому. Період півжиття фінастериду в плазмі крові в середньому становить шість годин. Зв'язування з білками плазми крові – 93 %. Системний кліренс становить приблизно 165 мл/хв, об'єм розподілу – 76 літрів.

Дослідження прийому багаторазових доз фінастериду протягом тривалого часу показало можливість накопичення препарату у малих кількостях. При щоденному пероральному прийомі фінастериду в дозі 5 мг/добу концентрація його в плазмі досягає 8–10 нг/мл і зберігається на цьому рівні протягом тривалого часу.

У літньому віці швидкість виведення фінастериду дещо знижується. У чоловіків віком понад 70 років період напіввиведення фінастериду становить приблизно 8 годин, тоді як в осіб віком від 18 до 60 років – 6 годин. Але це не є показанням для зменшення дози препарату в осіб старшого віку.

У пацієнтів з хронічною нирковою недостатністю (кліренс креатиніну від 9 до 55 мл/хв.) не виявлено різниці швидкості виведення одноразової дози фінастериду, міченого ізотопами вуглецю ¹⁴C, порівняно із здоровими волонтерами. Зв'язування з білками плазми крові у цих груп пацієнтів також не відрізнялось. Це пояснюється тим, що у пацієнтів з нирковою недостатністю частка метаболітів фінастериду, яка за нормальних умов виділяється з сечею, виводиться з калом. Це підтверджується

збільшенням у цих пацієнтів кількості метаболітів фінастериду в калі при одночасному зниженні їх концентрації в сечі. У зв'язку з наведеним у пацієнтів з нирковою недостатністю, яким не показаний гемодіаліз, корекція дози Проскар—у не потрібна.

Фінастерид проникає через гематоенцефалічний бар'єр у пацієнтів, які отримували терапію фінастеридом протягом 7–10 днів, але його вміст у спинномозковій рідині не досягає вагомих концентрацій. При прийомі Проскар—у у дозі 5 мг на добу також відзначили його проникнення у сім'яну рідину. При цьому концентрація фінастериду у сім'яній рідині дорослих чоловіків була в 50–100 разів нижчою за його концентрацію в плазмі крові.

Показання для застосування.

Проскар— призначають з метою зменшення розмірів збільшеної залози, поліпшення відтоку сечі та зменшення симптомів, пов'язаних з аденомою.

Проскар застосовують для лікування доброякісної гіпертрофії передміхурової залози, для запобігання урологічним втручанням (завдяки його здатності знижувати ризик гострої затримки сечі) та хірургічним маніпуляціям, у тому числі трансуретрорезекції передміхурової залози і простатектомії.

Спосіб застосування та дози.

Рекомендована доза – 1 таблетка по 5 мг один раз на день під час прийому їжі або без неї.

Дозування при нирковій недостатності

Для пацієнтів з різними стадіями ниркової недостатності (при зниженні кліренсу креатиніну до 9 мл/хв.) не потрібно індивідуального добору дози, оскільки фармакокінетичні дослідження не виявили будь-яких змін у розподілі фінастериду.

Дозування для людей похилого віку

Немає необхідності у підборі дози, хоча фармакокінетичні дослідження вказують на те, що виведення фінастериду у пацієнтів віком понад 70 років дещо знижується.

Побічна дія.

Проскар— добре переноситься. До клінічних небажаних проявів протягом 4 років дослідження, які були оцінені як, імовірно, пов'язані з препаратом, більше, ніж при прийомі плацебо, відносились скарги з боку молочних залоз і висипи, а також розлади статевої функції

У процесі широкого клінічного застосування препарату були повідомлення про такі побічні ефекти:

- реакції підвищеної чутливості, включаючи свербіж, кропив'янку, набряк губ і обличчя;
- болючість яєчок, імпотенція, зниження лібідо і об'єму еякуляту, збільшення та болючість молочних залоз.

Протипоказання.

Проскар— протипоказаний:

- жінкам і дітям;
- при підвищеній чутливості до будь-якого компонента цього препарату;
- при вагітності (див. "Особливості застосування").

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Не виявлено клінічно вагомих взаємодій з іншими препаратами. Напевно, Проскар— не чинить помітного впливу на ферментну систему, яка метаболізує препарати, пов'язані з цитохромом P450. Перевірені на людях сполуки включають пропранолол, дигоксин, глібурид, варфарин, теofilін і антипірин; при цьому не було знайдено клінічно вагомих взаємодій.

Інша супутня терапія

Хоча спеціальних досліджень взаємодії не проводили, у клінічних дослідженнях Проскар— застосовували сумісно з інгібіторами ангіотензинперетворюючого ферменту, ацетамінофеном, ацетилсаліциловою кислотою, альфа-блокаторами, бета-блокаторами, антагоністами кальцію, нітратами, діуретиками, антагоністами H₂ рецепторів, інгібіторами HMG-CoA редуктази,

нестероїдними протизапальними препаратами, хінолонами і бензодіазепінами. При цьому не виявлено клінічно вагомих небажаних взаємодій при супутньому призначенні.

Передозування.

Пацієнти отримували одноразову дозу Проскар—у до 400 мг і багаторазові дози Проскар—у до 80 мг на день протягом 3 місяців без небажаних ефектів.

Не існує спеціальних рекомендацій щодо лікування передозування Проскар—ом.

Особливості застосування.

Загальні заходи

Необхідно здійснювати ретельний контроль за можливим розвитком обструктивної уропатії у пацієнтів з великим залишковим об'ємом сечі і/або різко зниженим плином сечі.

Вплив на простатоспецифічний антиген (ПСА) і діагностику раку передміхурової залози

До цього часу не показано сприятливого клінічного впливу лікування Проскар—ом у пацієнтів, хворих на рак передміхурової залози. Пацієнти з аденомою передміхурової залози і підвищеним рівнем ПСА спостерігалися у контрольованих клінічних дослідженнях з декількома визначеннями ПСА і взяттями біопсії передміхурової залози. У цих дослідженнях лікування Проскар—ом не впливало на частоту виявлення раку передміхурової залози. Загальна частота виникнення раку передміхурової залози істотно не відрізнялась у групах пацієнтів, які отримували Проскар— або плацебо.

Перед початком лікування та періодично під час лікування Проскар—ом рекомендується перевіряти пацієнтів шляхом ректального дослідження, а також іншими методами на предмет наявності раку передміхурової залози. Визначення сироваткового ПСА також використовується для виявлення раку простати. Загалом, при вихідному рівні ПСА понад 10 нг/мл (Hybritech) слід проводити ширше обстеження пацієнта, включаючи, у разі необхідності, проведення біопсії. При рівні ПСА у межах 4–10 нг/мл рекомендується подальше обстеження пацієнта. Існує значний збіг у рівнях ПСА у чоловіків, які хворіють на рак передміхурової залози і які не мають цього захворювання. Отже, у чоловіків з аденомою передміхурової залози нормальні значення ПСА не дозволяють виключити рак передміхурової залози, незалежно від лікування Проскар—ом. Вихідний рівень ПСА нижче 4 нг/мл не виключає наявності раку простати.

Проскар— викликає зменшення вмісту сироваткового ПСА приблизно на 50% у пацієнтів з аденомою передміхурової залози, навіть за наявності раку простати. Це зниження рівня сироваткового ПСА у пацієнтів з аденомою передміхурової залози, які отримують лікування Проскар—ом, необхідно взяти до уваги при оцінці рівня ПСА, оскільки це зниження не виключає супутнього раку простати. Це зниження передбачуване у всьому діапазоні значень рівня ПСА, хоча це може коливатися в окремих пацієнтів. Аналіз даних по ПСА у більш ніж 3000 пацієнтів у тривалому 4-річному подвійному сліпому плацебо-контрольованому дослідженні ефективності і безпеки Проскар—у (дослідження PLESS) підтвердив, що у типових пацієнтів, які отримують Проскар— протягом 6 місяців і більше, значення ПСА повинні бути подвоєні порівняно з нормальними значеннями в осіб, які не приймають лікування. Така корекція дозволяє зберегти чутливість і специфічність визначення ПСА і підтримує його здатність виявляти рак передміхурової залози.

При будь-якому тривалому підвищенні рівня ПСА у пацієнта, який отримує лікування фінастеридом, необхідне ретельне обстеження для з'ясування причин, включаючи недотримання режиму прийому Проскар—у.

Проскар— істотно не зменшує відсоток вільного ПСА (відношення вільного ПСА до загального). Відношення вільного і загального ПСА залишається постійним навіть під впливом Проскар—у. При визначенні відсотка вільного ПСА, який застосовується для діагностики раку простати, коригування його значень не є обов'язковим.

Вплив препарату на лабораторні дані.

Вплив на рівень ПСА

Рівень ПСА у сироватці крові корелює з віком пацієнта і об'ємом простати, при цьому об'єм простати корелює з віком пацієнта. При оцінці лабораторних показників ПСА необхідно зважати на той факт,

що рівень ПСА знижується у процесі лікування Проскар—ом. У більшості пацієнтів спостерігається швидке зниження ПСА протягом перших місяців лікування, після чого рівень ПСА стабілізується на новому рівні, який становить приблизно половину від вихідної величини. З цього огляду у типових пацієнтів, які отримують Проскар— протягом 6 місяців і більше, значення ПСА повинні бути подвоєні порівняно з нормальними значеннями в осіб, які не приймають лікування.

Дія фінастериду - ризик для плоду чоловічої статі

Жінки, які потенційно можуть завагітніти або вагітні, повинні уникати контакту з подрібненими таблетками Проскар—у або тими, які втратили цілісність. Через здатність інгібіторів 5-альфа-редуктази типу II гальмувати перетворення тестостерону в дигідротестостерон, ці препарати, включаючи фінастерид, можуть викликати порушення у розвитку зовнішніх статевих органів у плоду чоловічої статі. Таблетки Проскар—у вкриті оболонкою і це запобігає контакту з активним інгредієнтом за умови, що таблетки не подрібнені і не втратили цілісності.

Застосування при лактації

Проскар— не показаний жінкам. Невідомо, чи проникає фінастерид у молоко матері.

Застосування у педіатрії

Проскар не показаний дітям. Його безпека і ефективність для дітей не встановлені.

Вплив на здатність до керування машиною та роботи з технікою

Проскар— не впливає на здатність до керування машиною та роботи з технікою.

Умови та термін зберігання.

Зберігати при температурі нижче 30 С, у захищеному від світла і недоступному для дітей місці.

Зберігати Проскар— в оригінальній щільно закритій упаковці.

Термін придатності – 3 роки.

Не можна використовувати препарат після закінчення терміну придатності.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 14, 28 таблеток в упаковці.

Виробник. Мерк Шарп і Доум Б. В.

Адреса. Waarderweg 39, P.O. Box 581, 2003 PC Haarlem, the Netherlands.

