Дутастерид Бактэр



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Капсулы мягкие желатиновые, светло-желтого цвета, овальной формы; содержимое капсул - маслянистая прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость; допускается незначительное расслоение жидкости.

	1 капс.
дутастерид	500 мкг

Вспомогательные вещества: глицерин монокаприлокапрат тип I 349.465 мг, бутилгидрокситолуол - 0.035 мг.

Состав оболочки капсулы: желатин - 118.81 мг, глицерол (глицерин) - 58.65 мг, метилпарагидроксибензоат - 0.85 мг, пропилпарагидроксибензоат - 0.12 мг, титана диоксид - 1.47 мг, краситель железа оксид желтый - 0.1 мг.

10 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (4) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
30 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
60 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
90 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Средство для лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Подавляет активность изоферментов 5α-редуктазы 1 и 2 типа, которые ответственны за превращение тестостерона в 5α-дигидротестостерон. Дигидротестостерон является основным андрогеном, ответственным за гиперплазию железистой ткани предстательной железы.

Максимальное влияние дутастерида на снижение концентраций дигидротестостерона является дозозависимым и наблюдается через 1-2 нед. после начала лечения. Через 1 и 2 нед. приема дутастерида в дозе 0.5 мг/сут среднее значение концентраций дигидротестостерона в сыворотке снижается на 85% и 90%.

Дутастерид способствует уменьшению размеров предстательной железы, улучшает мочеиспускание и снижает риск возникновения острой задержки мочи и потребности в хирургическом лечении.

Фармакокинетика

После однократного приема в дозе 500 мкг С

T_{max} дутастерида в сыворотке достигается в течение 1-3 ч. При 2-часовой в/в инфузии абсолютная биодоступность составляет около 60%. Биодоступность дутастерида не зависит от приема пищи.

Связывание с белками плазмы высокое - более 99.5 %. V_d - 300-500 л.

При ежедневном приеме концентрация дутастерида в сыворотке достигает 65% от C_{ss} через 1 мес и примерно 90% от этого уровня через 3 мес. C_{ss} дутастерида в сыворотке, составляющая примерно 40 нг/мл, достигается через 6 мес ежедневного приема препарата в дозе 500 мкг. В сперме, как и в сыворотке, C_{ss} дутастерида тоже достигаются через 6 мес. Через 52 нед. лечения концентрации дутастерида в сперме составляют в среднем 3.4 нг/мл (0.4-14 нг/мл). Из сыворотки в сперму поступает примерно 11.5% дутастерида.

In vitro дутастерид метаболизируется изоферментом CYP3A4 с образованием двух второстепенных моногидроксилированных метаболитов; вместе с тем на него не действуют изоферменты CYP2C9, CYP2C19 и CYP2D6. После достижения C_{ss} дутастерида, в сыворотке с помощью масс-спектрометрического метода обнаруживают неизмененный дутастерид, 3 главных метаболита (4'-гидроксидутастерид, 1,2-дигидродутастерид и 6-гидроксидутастерид) и 2 второстепенных метаболита.

Дутастерид подвергается интенсивному метаболизму. После приема препарата внутрь в дозе 500 мкг/сут до достижения равновесного состояния 1-15.4% (в среднем 5.4%) принятой дозы экскретируется с калом в неизмененном виде. Остальная часть дозы выводится в виде 4 основных метаболитов, составляющих 39%, 21%, 7% и 7% соответственно, и 6 малых метаболитов (на долю каждого из которых приходится менее 5%).

С мочой у человека выводятся следовые количества неизмененного дутастерида (менее 0.1% дозы).

При приеме дутастерида в терапевтических дозах его конечный $T_{1/2}$ составляет 3-5 нед.

Дутастерид обнаруживается в сыворотке (в концентрациях более 0.1 нг/мл) до 4-6 мес после прекращения его приема.

Фармакокинетика дутастерида может быть описана как процесс абсорбции первого порядка и два параллельных процесса элиминации, один насыщаемый (т.е. зависящий от концентрации) и один ненасыщаемый (т. е. не зависящий от концентрации).

При низких концентрациях в сыворотке (менее 3 нг/мл) дутастерид быстро выводится за счет обоих процессов элиминации. После однократного приема в дозах 5 мг и менее дутастерид быстро выводится из организма и имеет короткий $T_{1/2}$, составляющий 3-5 сут.

При концентрациях в сыворотке более 3 нг/мл клиренс дутастерида меньше – 0.35-0.58 л/ч, при этом выведение осуществляется преимущественно посредством линейного ненасыщаемого процесса с конечным $T_{1/2}$ 3-5 нед. При терапевтических концентрациях на фоне ежедневного приема препарата в дозе 500 мкг преобладает более медленный клиренс дутастерида; общий клиренс носит линейный и не зависящий от концентрации характер.

Показания к применению:

Лечение и профилактика прогрессирования доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Относится к болезням:

- Гиперплазия предстательной железы

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к дутастериду и другим ингибиторам 5α-редуктазы; противопоказано применение у женщин и детей.

Способ применения и дозы:

Для взрослых мужчин, включая пациентов пожилого возраста, рекомендуемая доза при приеме внутрь составляет 500 мкг 1 раз/сут. Лечение следует продолжать не менее 6 мес.

Побочное действие:

Со стороны половой системы: эректильная дисфункция, изменение (снижение) либидо, нарушение эякуляции,

гинекомастия (включает болезненность и увеличение грудных желез).

Аллергические реакции: сыпь, зуд, крапивница, локализованный отек, ангионевротический отек.

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки: алопеция (преимущественно потеря волос на теле) или гипертрихоз.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Диагнозы

- Аденома предстательной железы
- Баланит, баланопостит, фимоз
- Варикоцеле
- Гидронефроз

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Поскольку дутастерид метаболизируется изоферментом CYP3A4, в присутствии ингибиторов CYP3A4 концентрации дутастерида в крови могут возрастать.

При одновременном применении дутастерида с ингибиторами CYP3A4 верапамилом и дилтиаземом отмечается снижение клиренса. Вместе с тем, амлодипин, другой блокатор кальциевых каналов, не уменьшает клиренс дутастерида.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять у пациентов с нарушениями функции печени, т.к. дутастерид подвергается интенсивному метаболизму в печени, а его $T_{1/2}$ составляет 3-5 нед.

У пациентов с доброкачественной гиперплазией предстательной железы необходимо проводить пальцевое ректальное исследование и другие методы исследования предстательной железы до начала лечения дутастеридом и периодически повторять эти исследования в процессе лечения для исключения развития рака предстательной железы.

Определение концентраций ПСА в сыворотке является важным компонентом комплекса исследований, направленных на выявление рака предстательной железы. Исходный уровень ПСА менее 4 нг/мл у пациентов, получающих дутастерид, не исключает диагноза рака предстательной железы.

Дутастерид абсорбируется через кожу, поэтому женщины и дети должны избегать контакта с активным веществом. В случае такого контакта необходимо сразу промыть соответствующий участок кожи водой с мылом.

Источник: http://drugs.thead.ru/Dutasterid_Bakter