Проскар



Код АТХ:

- G04CB01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Финастерид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой голубого цвета, пленочной; в форме яблока, с гравировкой "MSD 72" на одной стороне и "PROSCAR" - на другой.

	1 таб.
финастерид	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал преджелатинизированный (кукурузный), натриевая соль карбоксиметилового эфира крахмала, железа оксид желтый, натрия докузат, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: метилгидроксипропилцеллюлоза, гидроксипропилцеллюлоза, титана диоксид, тальк, индигокармин алюминиевый лак.

14 шт. - блистеры (1) - коробки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - коробки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Гормоны и их антагонисты
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Препарат для лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ). Конкурентный и специфический ингибитор 5-альфа-редуктазы II типа - внутриклеточного фермента, который превращает тестостерон в более активный андроген - дигидротестостерон (ДГТ). Представляет собой синтетическое 4-азастероидное соединение. Эффективно снижает уровень ДГТ как в крови, так и в ткани железы.

Подавление образования ДГТ сопровождается уменьшением размеров предстательной железы, увеличением максимальной скорости тока мочи и снижением выраженности симптомов, связанных с гиперплазией предстательной железы.

Финастерид не обладает сродством к рецепторам андрогенов. Препарат не оказывает влияния на липидный профиль, а также на содержание в плазме крови кортизола, эстрадиола, пролактина, тиреотропного гормона и тироксина.

Однократный прием финастерида в дозе 5 мг приводит к быстрому снижению концентрации ДГТ в сыворотке крови с достижением максимального эффекта через 8 ч. Несмотря на то, что уровень финастерида в плазме крови подвергается колебаниям на протяжении 24 ч, уровень ДГТ остается постоянным. Это означает, что концентрация финастерида в плазме крови напрямую не связана с концентрацией ДГТ в плазме крови. У пациентов с ДГПЖ, которым Проскар в дозе 5 мг/сут назначался в течение 4 лет, наблюдалось снижение концентрации ДГТ в крови примерно на 70% и уменьшение объема предстательной железы приблизительно на 20%. Кроме этого, приблизительно на 50% снижался уровень простат-специфического антигена (ПСА) по сравнению с его исходным уровнем, что предполагает уменьшение роста эпителиальных клеток предстательной железы. Уровень тестостерона в крови увеличивался приблизительно на 10-20%.

При применении Проскара в течение 7-10 дней у пациентов, которым была показана простатэктомия, произошло снижение уровня ДГТ в ткани простаты приблизительно на 80% и увеличение уровня тестостерона в ткани простаты в 10 раз по сравнению с их уровнями до начала лечения.

Установлено, что длительное (более 4 лет) применение Проскара у пациентов с ДГПЖ (при умеренно или значительно выраженных симптомах заболевания) снижало риск развития урологических осложнений и хирургических вмешательств (трансуретральная резекция простаты или простатэктомия; острая задержка мочи, требующая катетеризации) на 51% и сопровождалось выраженным и стойким уменьшением объема предстательной железы, а также стойким увеличением максимальной скорости тока мочи и улучшением симптоматики (Исследование PLESS).

У пациентов, принимавших Проскар в течение 3 мес и добившихся снижения объема простаты приблизительно на 20%, при прекращении лечения объем простаты возвращался к прежним размерам через 3 месяца.

Таким образом, Проскар вызывает уменьшение размеров увеличенной предстательной железы, улучшает ток мочи и уменьшает симптомы, связанные с ДГП.

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция препарата из ЖКТ заканчивается через 6-8 ч после приема. При приеме внутрь биодоступность составляет около 80%. Прием пищи не нарушает биодоступности препарата. C_{max} финастерида в плазме крови достигается приблизительно через 2 ч после приема внутрь.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 93%.

V_d составляет 76 л.

При исследовании многократного приема финастерида в терапевтических дозах в течение длительного времени показана возможность накопления препарата в организме в малых количествах.

При ежедневном приеме внутрь финастерида в дозе 5 мг/сут его концентрация в плазме достигает 8-10 нг/мл и сохраняется на этом уровне в течение длительного времени.

У пациентов, которые получали Проскар в течение 7-10 дней, финастерид проникает через ГЭБ, однако содержание препарата в спинномозговой жидкости не достигает значимых концентраций.

При приеме Проскара в дозе 5 мг/сут также было отмечено его проникновение в семенную жидкость. При этом концентрация финастерида в семенной жидкости взрослых мужчин оказывалась в 50-100 раз ниже его концентрации в плазме крови.

Метаболизм и выведение

$T_{1/2}$ финастерида из крови в среднем составляет 6 ч.

Системный клиренс составляет около 165 мл/мин.

У мужчин после приема внутрь однократной дозы финастерида 39% принятой дозы выводилось с мочой в форме метаболитов (предположительно м неизмененный финастерид с мочой не выводится); 57% принятой дозы выводилось с калом.

Установлено, что два метаболита финастерида обладают менее выраженным ингибирующим действием на 5-альфа-редуктазу.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов пожилого возраста скорость выведения финастерида несколько снижается. У мужчин старше 70 лет $T_{1/2}$ финастерида составляет около 8 ч, по сравнению с лицами в возрасте от 18 до 60 лет, у которых $T_{1/2}$ финастерида - 6 ч. Однако это не является показанием для уменьшения дозы препарата у лиц старшего возраста.

Для пациентов с почечной недостаточностью различной степени тяжести (КК от 9 до 55мл/мин) не выявлено различий в скорости выведения однократной дозы финастерида по сравнению со здоровыми добровольцами. Связывание с белками плазмы у пациентов этих групп также не различалось. Это объясняется тем, что у пациентов с почечной недостаточностью доля метаболитов финастерида, в нормальных условиях экскретируемая 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 изложенным, у пациентов с почечной недостаточностью, которым не показан гемодиализ, коррекции дозы Проскара не требуется.

Показания к применению:

Лечение доброкачественной гиперплазии предстательной железы с целью:

— предупреждения урологических осложнений (снижение риска острой задержки мочи) и снижения необходимости проведения хирургических операций (в т.ч. трансуретральной резекции предстательной железы и простатэктомии);

— уменьшения размеров увеличенной предстательной железы, улучшения тока мочи и уменьшения выраженности симптомов, связанных с доброкачественной гиперплазией предстательной железы.

Терапия Проскаром показана пациентам с увеличенной предстательной железой.

Относится к болезням:

- Гиперплазия предстательной железы
- Простатит

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Проскар не показан к применению у женщин и детей.

С *осторожностью* назначают препарат пациентам с большим объемом остаточной мочи и/или существенно сниженным током мочи (необходимо тщательное наблюдение на предмет обструктивной уропатии).

Способ применения и дозы:

Рекомендуемая доза составляет 5 мг (1 таб.) 1 раз/сут независимо от приема пищи.

Проскар можно применять в качестве монотерапии или в комбинации с доксазозином.

Для **пациентов с почечной недостаточностью различной степени тяжести (при снижении КК до 9 мл/мин)** не требуется индивидуального подбора дозы, поскольку фармакокинетические исследования не выявили каких-либо изменений в распределении финастерида у данной категории больных.

Для **пациентов пожилого возраста** также нет необходимости в подборе дозы, хотя фармакокинетические исследования указывают на то, что выведение финастерида у пациентов старше 70 лет несколько снижается.

Побочное действие:

В исследовании PLESS оценка безопасности была проведена у 1524 пациентов, получавших Проскар в дозе 5 мг/сут, и у 1516 пациентов, получавших плацебо в течение 4 лет. У 4.9% (74) пациентов лечение было отменено из-за побочных явлений, приписываемых Проскару, по сравнению с 3.3% (50) пациентов, получавших плацебо. При этом у 3.7% (57) пациентов, принимавших Проскар, и 2.1% (32) пациентов, принимавших плацебо, лечение было отменено из-за нарушения половой функции, которое явилось наиболее часто наблюдаемым побочным явлением.

В первый год лечения импотенция, снижение либидо и нарушение эякуляции встречались чаще у пациентов, принимающих Проскар в сравнении с плацебо. При применении Проскара на 2-4 году исследования частота возникновения вышеперечисленных побочных эффектов у пациентов, принимающих Проскар, не отличалась от таковой у пациентов, принимающих плацебо.

Со стороны половой системы: болезненность яичек, импотенция, снижение либидо, нарушения эякуляции, уменьшение объема эякулята.

Со стороны эндокринной системы: увеличение и болезненность грудных желез.

Аллергические реакции: сыпь, кожный зуд, крапивница, ангионевротический отек губ и лица.

При длительном применении Проскара не наблюдается увеличения частоты и силы побочных эффектов, а число случаев нарушения сексуальной функции, связанных с приемом лекарственного препарата, при продолжительной терапии снижается.

Профиль безопасности и переносимости терапии при комбинированном лечении финастеридом в дозе 5 мг/сут и доксазозином 4 или 8 мг/сут сравним с безопасностью и переносимостью каждого из указанных препаратов в отдельности.

В 7-летнем плацебо-контролируемом исследовании (в которое было включено 18882 здоровых мужчин) по результатам проведенной биопсии (у 9060 мужчин) рак предстательной железы был выявлен у 18.4% пациентов, получавших Проскар и 24.4% пациентов, получавших плацебо. У 280 мужчин (6.4%) в группе Проскара и 237 мужчин (5.1%) в группе плацебо на основании результатов биопсии был выявлен рак предстательной железы, оцененный в 7-10 баллов по шкале Глисона. Приблизительно в 98% всех случаев рака опухоль была интракапсулярной (стадия T1 или T2).

Со стороны лабораторных показателей: снижение уровня простат-специфического антигена.

Передозировка:

Пациенты получали Проскар в однократной дозе до 400 мг и в многократных дозах до 80 мг/сут в течение 3 месяцев, при этом каких-либо нежелательных эффектов не обнаружено.

Рекомендации по специфическому лечению передозировки Проскара отсутствуют.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Женщины детородного возраста и **беременные** должны избегать контакта с измельченными или утратившими целостность таблетками препарата Проскар из-за возможности проникновения финастерида в организм беременной женщины и последующего риска для развития плода мужского пола.

В связи со способностью ингибиторов 5-альфа-редуктазы типа II подавлять превращение тестостерона в дигидротестостерон эти препараты, включая финастерид, могут вызывать патологию внутриутробного формирования наружных половых органов у плода мужского пола.

Таблетки Проскара покрыты оболочкой, и это предотвращает контакт с финастеридом при условии, что таблетки не измельчены и не утратили целостности.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не обнаружено клинически значимого взаимодействия Проскара с другими препаратами.

По-видимому, Проскар не оказывает заметного действия на активность изоферментов системы цитохрома P_{450} и на фармакокинетику лекарственных средств, в метаболизме которых данные изоферменты принимают участие. При комбинированном применении Проскара с пропранололом, дигоксином, глибуридом, варфарином, теофиллином, с ингибиторами АПФ, ацетаминофеном, ацетилсалициловой кислотой, альфа-адреноблокаторами, бета-адреноблокаторами, блокаторами кальциевых каналов, нитратами, диуретиками, блокаторами гистаминовых

H_2-рецепторов, ингибиторами ГМГ-КоА-редуктазы, НПВС, хинолонами и бензодиазепинами не обнаружено клинически значимых проявлений лекарственного взаимодействия.

Особые указания и меры предосторожности:

Влияние на уровень простат-специфического антигена и диагностику рака предстательной железы

До настоящего времени не показано положительного клинического эффекта Проскара у больных раком предстательной железы. У пациентов с ДГПЖ и повышенным уровнем ПСА в контролируемых клинических испытаниях (с несколькими определениями ПСА и проведением биопсии предстательной железы) терапия Проскаром не влияла на частоту выявления рака предстательной железы. Общая частота возникновения рака предстательной железы существенно не различалась в группах пациентов, получавших Проскар или плацебо.

Перед началом лечения Проскаром и периодически в процессе лечения следует проводить ректальное исследование, а также исследование другими методами на предмет наличия рака предстательной железы. Определение сывороточного ПСА также используется для выявления рака предстательной железы. В целом, при исходном уровне ПСА выше 10 нг/мл требуется проведение более широкого обследования пациента, включая, при необходимости, назначение биопсии. При уровне ПСА в пределах 4-10 нг/мл рекомендуется дальнейшее обследование пациента. Наблюдается значительное совпадение уровней ПСА у больных раком предстательной железы и пациентов, не имеющих этого заболевания. Следовательно, у мужчин с ДГПЖ нормальные значения ПСА не позволяют исключить рак предстательной железы, независимо от лечения Проскаром. Исходный уровень ПСА ниже 4 нг/мл не исключает возможности наличия рака предстательной железы.

Проскар вызывает уменьшение сывороточного ПСА приблизительно на 50% у пациентов с ДГПЖ даже при наличии рака предстательной железы. В связи с этим следует иметь в виду, что снижение уровня ПСА у пациентов с ДГПЖ, получающих лечение Проскаром, не исключает сопутствующего рака предстательной железы.

Показано, что у пациентов, получающих Проскар в течение 6 мес и более, значения ПСА должны быть удвоены для их сопоставления с нормальными значениями данного показателя у пациентов, не получающих лечения. Эта корректировка сохраняет чувствительность и специфичность анализа ПСА и возможность выявления рака предстательной железы.

Любое продолжительное увеличение уровня ПСА у пациентов, получающих лечение финастеридом, требует тщательного обследования для выяснения причины, которая может заключаться в несоблюдении режима применения Проскара.

Проскар существенно не уменьшает процент свободного ПСА (соотношение свободного ПСА к общему). Данный показатель остается постоянным даже под влиянием Проскара. Если для диагностики рака предстательной железы используется процент свободного ПСА, корректировка значений данного показателя необязательна.

Влияние на лабораторные показатели

Концентрация ПСА в сыворотке крови коррелирует с возрастом пациента и объемом предстательной железы, а объем простаты, в свою очередь, зависит от возраста пациента. При определении уровня ПСА следует учитывать, что данный показатель снижается у пациентов, принимающих Проскар. У большинства пациентов быстрое снижение уровня ПСА наблюдается в первые месяцы терапии, после чего происходит его стабилизация на новом уровне, который обычно составляет половину значения, измеренного до начала терапии. В связи с этим, у пациентов, принимающих Проскар в течение 6 и более мес, следует удваивать значение уровня ПСА для сопоставления его с нормальными показателями у мужчин, не принимающих Проскар.

При нарушениях функции почек

Для **пациентов с почечной недостаточностью различной степени тяжести (при снижении КК до 9 мл/мин)** не требуется индивидуального подбора дозы, поскольку фармакокинетические исследования не выявили каких-либо изменений в распределении финастерида у данной категории пациентов.

С *осторожностью* назначают препарат пациентам с большим объемом остаточной мочи и/или существенно сниженным током мочи.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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