

Қазақстан Республикасы
Денсаулық сақтау министрлігі
Фармация комитеті Төрағасының
2018 жылғы “15” 11
№N017994 бұйрығымен
БЕКІТІЛГЕН

**Дәрілік затты медициналық қолдану
жөніндегі нұсқаулық**

ПЕНЕСТЕР

Саудалық атауы

Пенестер

Халықаралық патенттелмеген атауы

Финастерид

Дәрілік түрі

Үлбірлі қабықпен қапталған таблеткалар, 5 мг

Құрамы

Бір таблетканың құрамында

белсенді зат - 5 мг финастерид

қосымша заттар: 77.450 мг лактоза моногидраты, жүгері крахмалы, повидон 30, натрий крахмалы гликолаты (А типі), натрий докүзаты – 0.400 мг, магний стеараты – 1.300 мг

үлбірлі қабықтың құрамы: гипромеллоза 2910/5 – 3.150 мг, макрогол 6000 – 0.300 мг, тальк – 0.300 мг, титанның қостотығы Е171 – 0.200 мг, симетикон эмульсиясы SE4 – 0.030 мг, темірдің (III) сары тотығы Е172 – 0.020 мг.

Сипаттамасы

Дөңгелек пішінді, екі жағы дөңес, сары түсті үлбірлі қабықпен қапталған, диаметрі 7.1 мм таблеткалар.

Фармакотерапиялық тобы

Урогенитальді ағзалар және жыныс гормондары ауруларын емдеуге арналған препараттар. Урологиялық ауруларды емдеуге арналған препараттар. Простатаның қатерсіз гипертрофиясын емдеуге арналған препараттар. Тестостерон 5-альфа-редуктаза тежегіштері. Финастерид
АТХ коды G04CB01

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

Ерлерде 14С таңбалы финастеридті ішу арқылы қолданғаннан кейін 39% доза метаболиттер түрінде несеппен шығарылды (мүлде өзгермеген финастерид несеппен шығарылған) және жалпы дозаның 57%-ы нәжіспен шығарылды. Финастеридтің 5- α -редуктазаға тежегіш әсер етуінде аз ғана рөл атқаратын финастеридтің екі метаболиті сәйкестендірілген.

Финастерид биожетімділігі ішу арқылы қолданған кезде 80%-ға жуықты құрайды. Ас ішу препараттың биожетімділігіне ықпалын тигізбейді. Қан плазмасында финастерид ең жоғары концентрацияларына қолданғаннан кейін шамамен 2 сағаттан соң жетіп, сіңірілуі 6-8 сағаттан соң аяқталады. Препарат ақуыздармен шамамен 93% байланысады. Қан плазмасының клиренсі мен финастеридтің таралу көлемі, тиісінше, шамамен 165 мл/мин және 76 литр құрайды.

Көп рет қолданғанда финастеридтің аздаған мөлшерінің біртіндеп баяу жиналуы байқалды. Тәулігіне 5 мг дозада күн сайын қолданғанда қан плазмасындағы финастерид концентрациясы тепе-тең күйде 8-10 нг/мл құрап, осы деңгейде сақталады.

Егде жастағы адамдарда финастеридтің шығарылу жылдамдығы біраз төмендеген. Жасы ұлғайған пациенттерде жартылай шығарылу кезеңі, орташа көрсеткішпен салыстырғанда, 18-60 жастағы ерлерде шамамен 6 сағатқа және 70 жастан асқан ерлерде 8 сағатқа ұзарады. Мұндай деректердің клиникалық мәні жоқ, сондықтан дозаны түзету қажет емес.

Бүйрек функциясының созылмалы бұзылулары бар және креатинин клиренсі 9-55 мл/мин аралығындағы пациенттерде 14С таңбалы финастеридтің бір реттік дозасын қолданғаннан кейін препараттың таралуы дені сау еріктілердегі таралу көрсеткіштерінен ерекшеленбеген. Ақуыздармен байланысу көрсеткіші де бүйрек функциясы бұзылған пациенттерде ерекшеленген жоқ. Әдетте несеппен бөлінетін метаболиттердің бір бөлігі нәжіспен шығарылды. Метаболиттердің нәжіспен шығарылуы несеппен бөлінуінің төмендеуіне сәйкес артады. Гемодиализ жасалмайтын бүйрек функциясы бұзылған пациенттерге дозаны түзету қажет емес.

Финастеридпен 7-10 күн бойы емделген пациенттерде финастерид жұлынми сұйықтығынан (ЖМС) табылды, бірақ препарат негізінен ЖМС шоғырланбаған. Финастерид, сондай-ақ препаратты тәулігіне 5 мг дозада алған пациенттерде ұрық сұйықтығынан табылды. Ұрық сұйықтығындағы финастерид мөлшері ересек ерлердің қан айналымындағы дигидротестостерон (ДГТ) деңгейлеріне ықпал етпейтін 5 мкг финастерид дозасынан 50-100 есе аз болды.

Фармакодинамикасы

Пенестер – адамдағы II типті 5 альфа-редуктазаның (тестостеронды күштірек андрогендигидротестостеронға (ДГТ) метаболиздейтін жасушаішілік фермент) бәсекелес тежегіші. Қуық асты безінің қатерсіз гиперплазиясы (ҚБҚГ) кезінде қуық асты безінің үлкеюі қуық асты безі ішінде тестостеронның ДГТ-ге айналуына байланысты. Пенестер қан

айналымында және простата ішінде болатын ДГТ деңгейлерін төмендетуде тиімді. Финастеридтің андроген рецепторларымен ұқсастығы жоқ.

Клиникалық зерттеулерде төменгі несеп жолдарының орташа және ауыр симптомдары бар, тік ішекті тексеру кезінде простатасы ұлғайған және қалдық несеп көлемі төмен пациенттерде, финастерид несептің жедел іркілісінің туындау жиілігін төрт жылдың ішінде 7/100-ден 3/100-ге дейін және операция жасау қажеттілігін (ТУР немесе простатэктомия) 10/100-ден 5/100-ге дейін азайтады.

Бұл төмендеу QUASI-AUA (0-34 шкала) симптомдар кестесі бойынша простата көлемінің шамамен 20% тұрақты азаюы және несеп ағуы деңгейінің тұрақты ұлғаюы арқылы 2-балдық жақсаруымен астасады.

Қолданылуы

Қуық асты безінің қатерсіз гиперплазиясын (ҚБҚГ) емдеу және бақылау - қуық асты безінің өлшемдерін азайту үшін; несеп ағуының жылдамдығын жақсарту және гиперплазияға байланысты симптомдарды азайту үшін; - несептің жедел іркілісінің пайда болу қаупі мен осыған байланысты хирургиялық араласу ықтималдығын төмендету үшін.

Пенестер тек қуық асты безі гипертрофиясы бар пациенттерге тағайындалуы тиіс.

Қолдану тәсілі және дозалары

Ұсынылатын доза: 5 мг Пенестер – тәулігіне 1 таблетка (тамақ ішуге байланысты емес).

Пенестерді альфа-блокатор доксазозиннен бөлек немесе біріктіріп қолдануға болады.

Симптомдардың ерте жеңілдеуі байқалуы мүмкін болса да, емдеудің тиімділігіне қол жеткізілгенін бағалау үшін емдеуді кем дегенде 6 ай бойы жалғастыру қажет болуы ықтимал. Әрі қарай, емдеу ұзақ уақыт жалғастырылуы мүмкін.

Бүйрек функциясының бұзылуы кезінде дозалау.

Әртүрлі ауырлық дәрежедегі бүйрек функциясының бұзылулары бар пациенттерде (креатинин клиренсінің 9 мл/минутқа дейін төмендеуі) Пенестер дозасын реттеу қажет емес, өйткені фармакокинетикасын зерттеулерде препарат таралуының қандайда бір өзгерістері анықталмаған.

Егде жастағы пациенттер үшін дозалау.

Препарат дозасын түзету қажет емес.

Жағымсыз әсерлері

Жиілігі былайша анықталды: өте жиі ($\geq 1/10$); жиі ($\geq 1/100$, $< 1/10$); жиі емес ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); сирек ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), өте сирек ($< 1/10,000$), белгісіз (деректер маркетингтен кейінгі кезеңде өздігінен келіп түскен хабарламаларға негізделгендіктен, жиілігін анықтау мүмкін емес)

Жиі

- белсіздік немесе либидоның төмендеуі
- эякулят көлемінің азаюы
- Пенестермен емдеу кезінде ПСА деңгейінің төмендеуі

Жиі емес

- бөртпе
- препаратты тоқтатқаннан кейін жалғасатын жыныстық бұзылыстар (эрекцияның және эякуляцияның бұзылуы), кеуде бездерінің ауыруы және ұлғаюы

Белгісіз

- емді тоқтатқаннан кейін сақталатын депрессия
- аса жоғары сезімталдық реакциялары – қышыну, есекжем, Квинке ісінуі (ерін, тіл, жұтқыншақ және бет ісінулерін қоса)
- жүрек қағуы
- бауыр ферменттері деңгейінің жоғарылауы
- қышыну, есекжем
- аталық бездің ауыруы

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- осы препарат компоненттерінің кез келгеніне жоғары сезімталдық.
- Көрсетілімдерге сәйкес препарат тек қана еркектерге қолдануға арналған.

Дәрілермен өзара әрекеттесуі

Препараттармен клиникалық тұрғыдан қандайда бір елеулі өзара әрекеттесуі анықталған жоқ.

Айрықша нұсқаулар

Қалдық несеп мөлшері айтарлықтай және/немесе несеп ағуы елеулі төмендеген пациенттер обструкциялық асқынулар ықтималдығына байланысты мұқият бақылануы тиіс. Хирургиялық араласу мүмкіндігі қарастырылуы тиіс.

ПСА-ға әсері және қуық асты безі обырын анықтау

Қуық асты безі обырына шалдыққан пациенттерде Пенестермен емдеу аясында әлі күнге дейін клиникалық жақсаруы тіркелмеген. ҚБҚГ және простат-спецификалық антигенінің (ПСА) деңгейі жоғары пациенттер бақыланатын клиникалық зерттеулерде бақылауда болған, онда қуық асты безі биоптаттарына зерттеу жүргізу арқылы ПСА деңгейлері қайтадан анықталған. Пенестермен ем алған пациенттерде ПСА деңгейлері төмендейтінін ескеру керек.

Дәрігерлер қуық асты безі обырын жоққа шығару үшін Пенестермен емдеу алдында және кейіннен мезгіл-мезгіл басқа да зерттеулермен бірге *per rectum* зерттеуін жүргізуді ұсынады.

Қуық асты безі обырын анықтау үшін сондай-ақ сарысулық ПСА пайдаланылады. Жалпы алғанда, ПСА концентрациясы > 10 нг/мл (Hybritech) қосымша тексеру мен биопсия жүргізу жөніндегі мәселені шешуді талап етеді; ПСА 4 - 10 нг/мл концентрациясы жағдайында

қосымша тексеру ұсынылады. Еркектерде қуық асты безі обырының бар-жоғына қарамастан ПСА концентрациясы елеулі түрленуі байқалуы мүмкін. Осыған байланысты, ПСА концентрациясы Пенестермен емдеуге байланыссыз қалыпты шекте болатын ҚБҚГ бар еркектерде қуық асты безі обырының болуын жоққа шығаруға болмайды. ПСА < 4 нг/мл концентрациясы қуық асты безі обырының бар екенін жоққа шығармайды. Финастерид ҚБҚГ шалдыққан пациенттерде қуық асты безі обыры болған жағдайда да ПСА концентрациясының шамамен 50%-ға төмендеуіне алып келеді. Финастеридпен емдеу аясында ҚБҚГ шалдыққан пациенттерде сарысулық ПСА концентрациясының мұндай төмендеуіне ПСА деректерін бағалау кезінде назар аударылуы тиіс; бұл қуық асты безі обырының қатар жүруін жоққа шығармайды. Мұндай төмендеуді олардың пациенттер арасында айрықшалануы мүмкін екеніне қарамастан, ПСА концентрациясының бүкіл аралығы шегінде күтуге болады.

Мұндай сұрыптау кезінде ПСА анықтаудың сезімталдығы мен ерекшелігі сақталады және қуық асты безі обырын анықтау мүмкіндігін сақтайды.

5 мг Пенестермен емделген пациенттерде сақталып қалған кез келген ПСА концентрациясының жоғарылауы пациенттің емдеу талаптарын сақтамау мүмкіндігін ескере отырып мұқият бағалануы тиіс.

Пенестер еркін ПСА концентрациясын (жалпыға еркін ПСА-ның қатынасы) сенімді түрде төмендетпейді. Жалпыға еркін ПСА қатынасы тіпті 5 мг Пенестердің әсері кезінде де тұрақты болып қалады. Егер еркін ПСА-ның мәні қуық асты безі обырын айқындауда мақсат ретінде қолданылса, оның мәнін түзету міндетті емес.

Қосымша заттар

Препарат құрамында лактоза бар. Галактозаны көтере алмаушылық, туа біткен лактаза жеткіліксіздігі немесе глюкоза-галактозальық мальабсорбция түріндегі сирек кездесетін тұқым қуалаған проблемалары бар пациенттер бұл препаратты қолдануына болмайды.

Еркектердегі кеуде безі обыры

Клиникалық сынақтарда және маркетингтен кейінгі зерттеулерде 5 мг финастерид қабылдаған еркектердегі кеуде бездері обыры жағдайлары туралы деректер алынған. Пациенттер мынадай симптомдар: кеудедегі қатаю, ауыру, гинекомастия және емшек ұшынан бөлінулер байқалған кезде шұғыл дәрігерге қаралу керектігінен хабардар болуы тиіс.

Педиатрияда қолданылуы

Пенестерді балаларға қолдануға болмайды. Препараттың балалардағы қауіпсіздігі мен тиімділігі анықталмаған.

Жүктілік және лактация кезеңінде қолданылуы

Жүктілік

II типті 5- α -редуктаза тежегіштері тестостеронның дигидротестостеронға өзгеруін тежеуі мүмкін болғандықтан, мұндай препараттар, финастеридті қоса, жүкті әйел қолданған кезде ер жынысты шаранада сыртқы жыныс мүшелері патологиясының дамуына себеп болуы мүмкін.

Ер жынысты шарана үшін қауіп

Финастеридтің организмге өту және одан әрі ер жынысты шаранада қауіпті болу мүмкіндігіне байланысты, әйелдер Пенестер препаратының үгітілген немесе бүтіндігі бұзылған таблеткаларымен жанасудан аулақ болуы тиіс. Пенестер таблеткалары қабықпен қапталған және таблетка қабығы зақымданбаған немесе үгітілмеген жағдайда, таблеткаларды әдеттегі тұтыну кезінде белсенді затпен жанасуға жол бермейді.

Лактация

Пенестерді әйелдерге қолдануға болмайды. Финастеридтің емшек сүтіне өтетін-өтпейтіндігі белгісіз.

Дәрілік заттың көлік құралын немесе қауіптілігі зор механизмдерді басқару қабілетіне ықпал ету ерекшеліктері

Бақыланған жоқ.

Артық дозалануы

Артық дозаланған кезде спецификалық ем ұсынылмайды.

Шығарылу түрі және қаптамасы

10, 15 таблеткадан поливинилхлоридті/ поливинилдихлоридті үлбірден және алюминий фольгадан жасалған пішінді ұяшықты қаптамаға салынған. 3 (10 таблеткадан), 2 (15 таблеткадан) пішінді ұяшықты қаптамадан медициналық қолдану жөніндегі мемлекеттік және орыс тілдеріндегі нұсқаулықпен бірге картон қорапшаға салынған.

Сақтау шарттары

25°С-ден аспайтын температурада сақтау керек.

Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек!

Сақтау мерзімі

3 жыл

Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін қолдануға болмайды

Дәріханалардан босатылу шарттары

Рецепт арқылы

Өндіруші

Зентива к.с., Прага, Чех Республикасы

Тіркеу куәлігі иесінің атауы және елі

Санофи-авентис Қазақстан" ЖШС, Алматы қ., Қазақстан Республикасы

Қазақстан Республикасы аумағында тұтынушылардан дәрілік заттың сапасына қатысты шағымдарды қабылдайтын ұйымның атауы, мекенжайы және байланыс деректері (телефон, факс, электронды пошта)

«Санофи-авентис Қазақстан» ЖШС

Қазақстан Республикасы, 050013, Алматы қ., Н. Назарбаев д-лы 187 Б
телефон: 8 (727) 244-50-96
факс: 8 (727) 258-25-96
е-mail: quality.info@sanofi.com

Қазақстан Республикасы аумағында дәрілік заттың тіркеуден кейінгі қауіпсіздігін қадағалауға жауапты ұйымның атауы, мекенжайы және байланыс деректері (телефон, факс, электронды пошта)

«Санофи-авентис Қазақстан» ЖШС

Қазақстан Республикасы, 050013, Алматы қ., Н. Назарбаев д-лы 187 Б
телефон: 8 (727) 244-50-96
факс: 8 (727) 258-25-96
е-mail: Kazakhstan.Pharmacovigilance@sanofi.com