



核准日期：2019年11月28日
修改日期：2020年07月17日

修改日期：2021年11月25日
修改日期：2023年03月08日

护佑 扬子江 俊达

非那雄胺片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

0.8% 出现射精量减少，安慰剂对照组 0.4%。中止本品治疗后这些不良反应消失，也有许多患者在继续用药过程中这些不良反应自行消失。在另一项研究中检测了本品对射精量的影响，发现与安慰剂无差异。

在使用本品 5 年的病人中，观察到的上述不良反应的发生率减少至 <0.3%。

乳腺癌

非那雄胺也在患有前列腺疾病的男性中进行了研究，但其所用剂量是治疗男性型脱发推荐剂量的 5 倍。在入选了 3047 名男性、为期 4—6 年、与安慰剂和对照药进行对照的前列腺症状药物治疗 (MTOPS) 研究中，接受 5mg 非那雄胺治疗的男性中有 4 例乳腺癌病例，未接受 5mg 非那雄胺治疗的男性中没有乳腺癌的病例。在入选了 3040 名男性、为期 4 年、安慰剂对照的 PLESS 研究中，接受安慰剂治疗的男性中有 2 例乳腺癌病例，但接受 5mg 非那雄胺治疗的男性中没有乳腺癌病例。在入选了 18882 名男性、为期 7 年、安慰剂对照的前列腺癌预防试验 (PCPT) 中，接受 5mg 非那雄胺治疗的男性中有 1 例乳腺癌病例，接受安慰剂治疗的男性中有 1 例乳腺癌病例。已有关于使用非那雄胺 1mg 和 5mg 的男性中发生乳腺癌的上市后报告。非那雄胺的长期使用与男性乳腺癌形成之间的关系尚未知。

产品上市后经验

以下是产品上市后报道的其他不良反应。由于这些不良反应是规模不确定的人群自发报告的，因而有时不可能对其发生率进行可靠的评估，或者确定其与药物暴露之间的因果关系。

免疫系统疾病：过敏反应，例如皮疹、瘙痒、风疹及血管性水肿(包括唇部、舌头、咽喉及面部肿胀)。

精神疾病：抑郁、停止治疗后继续存在的性欲降低。

生殖系统和乳腺疾病：在停止治疗后继续存在的性功能障碍(勃起功能障碍及射精异常)、乳房触痛和增大、睾丸疼痛、男性不育和/或精液质量差。已有报告称停止非那雄胺用药后精液质量恢复正常或出现改善。

【禁忌】

本品禁用于：
孕妇或可能怀孕的妇女(参见[孕妇及哺乳期妇女用药])
对本品任何成份过敏者
本品不适用于妇女和儿童。

【注意事项】

在对 18 至 41 岁男性进行的临床研究中，应用本品 12 个月后备血清前列腺特异性抗原(PSA) 从 0.7ng/ml 的基础水平降至 0.5ng/ml。本品在用于治疗患有良性前列腺增生(BPH) 的老年男性秃发病人时必须考虑到前列腺特异性抗原水平会降低约 50%。

没有数据显示保法止® 对于驾驶和使用机器的能力有影响。

使用本品期间，如出现任何不良事件和/或不良反应，请咨询医生。

扬子江药业集团

四川海蓉药业有限公司



核准日期：2019年11月28日
修改日期：2020年07月17日

修改日期：2021年11月25日
修改日期：2023年03月08日

护佑 扬子江 俊达

非那雄胺片说明书

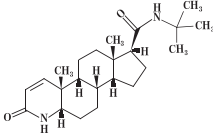
【药品名称】

通用名称：非那雄胺片
英文名称：Finasteride Tablets
汉语拼音：Feinaxiong'an Pian

【成份】

本品主要成份为：非那雄胺，其化学名称为：N-叔丁基-3-氧代-4-氮杂-5α-雄甾-11-烯-17β-甲酰胺。

化学结构式：



分子式：C₂₃H₃₆N₂O₂
分子量：372.55

【性状】

本品为薄膜衣片，除去包衣后显白色或类白色。

【适应症】

本品适用于治疗男性秃发(雄激素性秃发)，能促进头发生长并防止继续脱发。

本品不适用于妇女(参见孕妇和临床研究部分) 和儿童。

【规格】

1mg

【用法用量】

推荐剂量为每天一次，一次一片(1mg)，可与或不与食物同服。一般在连续用药三个月或更长时间才能观察到头发生长增加、头发数目增加和/或防止继续脱发的效果。建议持续用药以取得最大疗效，停止用药后疗效可在 12 个月内发生逆转。

【不良反应】

本品一般耐受性良好，不良反应通常轻微，一般不必中止治疗。文献报道：

在 3200 多例男性患者参加的一系列临床研究中对非那雄胺治疗秃发的安全性进行了评价。在 3 项为期 12 个月、由多个研究中心参加、安慰剂对照的双盲研究中，本品治疗的安全性和安慰剂相似。接受本品治疗的 945 例男性患者有 1.7% 因不良反应中止治疗，用安慰剂的 934 例男性患者则有 2.1% 因不良反应中止治疗。

在这些研究中，接受本品治疗的男性患者有 ≥1% 的人出现下列与用药有关的不良反应：性欲减退(本品 1.8%，安慰剂 1.3%) 及勃起功能障碍(本品 1.3%，安慰剂 0.7%)。此外，接受本品治疗的男性患者有



核准日期：2019年11月28日
修改日期：2020年07月17日

修改日期：2021年11月25日
修改日期：2023年03月08日

护佑 扬子江 俊达

毛囊内含有 II 型 5α-还原酶，在男性秃发患者的秃发区头皮内毛囊变小，并且双氢睾酮增加。给予非那雄胺可使这些患者头皮及血清中的双氢睾酮浓度下降。先天性缺乏 II 型 5α-还原酶的男子不会患男性秃发。这些资料以及临床研究的结果证实非那雄胺能抑制头皮毛囊变小、逆转脱发的过程。

毒理研究

致癌性/致突变性/生育能力的损害

为期 24 个月对大鼠的致癌性的研究显示雄性大鼠接受每天 160mg/kg 的非那雄胺(统计学显著趋势检验) 患甲状腺滤泡腺瘤的发生率增加。大鼠的这个口服剂量是人类推荐剂量(以 0—24 小时的药时曲线下面积为根据) 的 800 多倍。非那雄胺对大鼠甲状腺的作用是由于甲状腺素清除率的增加引起的，并不是药物的直接作用。认为对大鼠的这些观察结果与人类无关。

在 19 个月的小鼠致癌性研究中，每日口服 250mg/kg 的非那雄胺(估计为人类推荐剂量的 1700 多倍) 的小鼠的睾丸间质细胞腺瘤的发生率显著增加有统计学意义；当以每天 2.5 或 25mg/kg 为口服剂量时，没有发现腺瘤。

小鼠每天以 25mg/kg 为口服剂量(约为人类推荐剂量的 90 倍) 和大鼠每天 >40mg/kg 为口服剂量(约为人类推荐剂量的 300 倍) 时，发现间质细胞增生的发生率增加。

在这两种大剂量使用非那雄胺的啮齿类动物中，已被证实间质细胞增生的改变和血清黄体生成素(LH) 水平的增加(超过对照 2—3 倍) 之间有相关性。这表明了间质细胞的改变是随血清黄体生成素(LH) 水平的提高而变化的，而不是由于非那雄胺的直接作用。

当大鼠和狗分别每天以 20mg/kg(约为人类推荐剂量的 220 多倍) 和 45mg/kg(约为人类推荐剂量的 2600 多倍) 剂量口服非那雄胺一年，及小鼠每天以 2.5mg/kg(约为人类推荐剂量的 9 倍) 口服 19 个月，都未发现与药物相关的间质细胞变化。

在体外细菌诱变实验、哺乳动物细胞诱变实验、和体外碱性洗脱实验中没有发现致突变性的证据。体外染色体畸变实验中，中国大鼠卵巢细胞经高浓度(450—550 μmol) 的非那雄胺处理后，染色体畸变有轻微的增加。这个浓度超过了人类以 1mg 为总剂量时的血浆浓度峰值，是生物系统不能达到的。在小鼠体内染色体畸变实验中，给予最大耐受剂量的非那雄胺没有发现与治疗相关的染色体畸变增加。

雄性兔每天口服非那雄胺达 80mg/kg(约为人类推荐剂量的 4000 多倍) 时没有损害生育能力。雄性大鼠每天口服非那雄胺 80mg/kg(约为人类推荐剂量的 440 倍) 治疗 24 至 30 周出现明显的生育能力下降。并伴有生殖小泡和前列腺的重量显著减少。中断治疗 6 周内这些作用可以逆转。

大鼠生育能力的下降是从属于非那雄胺对附属性器官的作用的，导致不能形成精液性，这对于大鼠生育是必要的，但与人类无关。

发育研究

怀孕的大鼠每天给予非那雄胺剂量从 100 μg/kg 至 100mg/kg(>5 倍人类推荐剂量) 口服时，发现所生育出的雄性后代的原尿道下裂的发生率为 3.6 至 100%。此外，当怀孕大鼠被给予每天 30 μg/kg(>1.5 倍人类推荐剂量) 非那雄胺口服时，生育出的雄性后代伴有前列腺和生殖小泡重量下降、包皮分离延长、和暂时性的乳头发育，当给予每天 3 μg/kg(约为人类推荐剂量的五分之一) 非那雄胺口服时，出现肛门生殖器的间隔减小。产生这些作用的重要阶段已被限定在妊娠雄鼠的 16 至 17 天。

以上所述的变化被认为是 II 型 5α-还原酶抑制剂的药理作用。雄大鼠在子宫中暴露于非那雄胺出现的一些改变，如尿道下裂，与先天性 II 型 5α-还原酶缺乏的雄大鼠的报告相似。而对于在子宫中暴露于任何剂量非那雄胺的雌性大鼠没有作用。

妊娠晚期和哺乳期服用非那雄胺的大鼠会造成第一代雄性后代的生育能力轻微下降(每天 3mg/kg)。在服用非那雄胺的雄性大鼠(每天 80mg/kg) 与未服药的雌鼠交配所生育的第一代雄性和雌性后代中没有发现发育异常。

从妊娠 6 至 18 天开始免的胎儿在子宫中暴露于每天 100mg/kg 的非那雄胺没有发现畸形的证据。

对于恒河猴胚胎和胎儿发育期(妊娠 20 至 100 天) 在子宫中暴露于非那雄胺的影响的评估，说明了这个物种比大鼠和兔子更具有向人类发展的倾向。给妊娠猴静脉注射剂量为每天 800ng 的非那雄胺(以体重为基础，至少为怀孕妇女可能接触的精液中的非那雄胺最大估计量的 750 倍) 发现雄性胎儿没有异常。为证实恒河猴模型与人类胎儿发育的关系，给妊娠猴口服高剂量的非那雄胺(每天 2mg/kg，100 倍人类推荐剂量或以体重为基础，大约为妊娠妇女可能接触的精液中的非那雄胺最大估计量的 1200 万倍) 导致雄性胎儿外生殖器的异常。没有发现雄性胎儿的其他异常，也未观察到任何剂量下雌性胎儿有非那雄胺相关的异常。

【药代动力学】

吸收

与静脉给药相比，非那雄胺口服给药的生物利用度约为 80%。口服生物利用度不受食物影响。口服给药后约 2 个小时非那雄胺在血浆中的浓度达到峰值，给药后 6—8 小时完全吸收。

分布

血浆蛋白结合率约为 93%。非那雄胺的分布容积约为 76 升。按每天 1mg 剂量连续用药达稳态后，血浆中非那雄胺峰值浓度平均为 9.2ng/ml，在给药后 1 到 2 小时达此峰值，0—24 小时的药时曲线下面积为 53ng·hr/ml。

在脑脊液中可检测到非那雄胺，但是并非主要分布在脑脊液中。用药后在精液中也已检测到了微量的非那雄胺。

代谢

同时使用其他药物，请告知医生。

请放置于儿童不能够触及的地方。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

本品禁用于孕妇或可能怀孕的妇女。

因为 II 型 5α-还原酶抑制剂会抑制某些组织中睾酮向双氢睾酮的转化，所以这类抑制剂(包括非那雄胺) 如用于孕妇可引起男性胎儿外生殖器发育畸形。

孕妇或可能怀孕的妇女不应接触破碎的非那雄胺片剂，因为药物可能被吸收继而而对男性胎儿产生危害。完整的片剂有外层包膜，以防止在正常操作中接触到药品的活性成份。

哺乳妇女

本品不适用于妇女。

尚不清楚非那雄胺是否随人乳分泌。

【儿童用药】

本品不适用于儿童。

【老年用药】

尚未在老年男性患者中进行本品治疗男性秃发的临床研究。

【药物相互作用】

临床尚未发现重要的药物相互作用。非那雄胺不影响与细胞色素 P450 有关的药物代谢酶系。已在男性中研究过的药物包括安替比林、地高辛、优降糖、普萘洛尔、茶碱和华法林，未发现相互作用。

虽然尚未进行专门的相互作用研究，但在临床研究中，将 1mg 或大于 1mg 剂量的非那雄胺与血管紧张素转化酶抑制剂、对乙酰氨基酚、α 受体阻断剂、苯二氮卓类、β 受体阻断剂、钙通道阻滞剂、硝酸酯类、利尿剂、H₂ 受体拮抗剂、β-羟基-β-甲基戊二酸单酰辅酶 A 还原酶抑制剂、前列腺素合成酶抑制剂及喹诺酮类合用，均未见重要的不良相互作用。

【药物过量】

临床研究中非那雄胺单次剂量达 400mg 或多次服药，每天总量达 80mg，连续用药三个月，均未发生不良反应。

本品过量时无推荐的特效治疗措施。

【药理毒理】

药理学

作用机理

非那雄胺是一种合成的甾体类化合物，它是雄激素睾酮代谢成为双氢睾酮过程中的细胞内酶 II 型 5α 还原酶的特异性抑制剂。非那雄胺对雄激素受体没有亲和力，也没有雄激素样、抗雄激素样、雌激素样、抗雌激素样或促孕作用。对该酶的抑制能阻碍外周组织中睾酮向雄激素双氢睾酮的转化，使血清及组织中双氢睾酮浓度显著下降。与安慰剂相比，可使血循环中睾酮的水平升高约 10—15%，但仍在生理范围内。非那雄胺能使血清中双氢睾酮浓度迅速下降，在给药后 24 小时内使之显著减少。

非那雄胺主要在细胞色素 P450 3A4 酶的催化下代谢。男子一次服用 ¹⁴C 标记的非那雄胺后，可检测到两种非那雄胺的代谢物，其抑制 5α-还原酶的活性远低于非那雄胺。

消除

男子一次服用 ¹⁴C 标记的非那雄胺后，39% 的药物以代谢物形式经尿液排泄(实际上无原形药物经尿液排泄)，57% 的药物随粪便排泄。

血浆清除率约为 165ml/min。

非那雄胺的消除速率随年龄增加而有所下降。在 18 至 60 岁的男子中，非那雄胺的平均消除半衰期约为 5 至 6 小时，70 岁以上的男子，消除半衰期为 8 小时。这种差别并无临床意义，所以老年人不必减量用药。

病人特征

对于肌酐清除率为 9—55ml/min 的慢性肾功能损害的病人，单剂量 ¹⁴C-非那雄胺的分布与健康志愿者相似。蛋白结合在肾功能损害病人中也没有不同。部分正常情况下通过肾脏排泄的代谢产物会随粪便排泄。因而会出现与肾脏排泄减少相当的粪便排泄增加。对肾功能受损但不作透析的患者不必调整用药量。

【贮藏】

避光、密封，在 30℃ 以下保存。

【包装】

铝塑板包装，7 片/板，1 板/盒；7 片/板，4 板/盒。

【有效期】

24 个月

【执行标准】

国家药品监督管理局标准 YBH02632019 和《中国药典》2020 年版二部

【批准文号】

国药准字 H20193351

【上市许可持有人】

名 称：扬子江药业集团四川海蓉药业有限公司

注册地址：四川省成都市都江堰市彩虹大道南段 802 号

【生产企业】

企业名称：扬子江药业集团四川海蓉药业有限公司

生产地址：四川省成都市都江堰市彩虹大道南段 802 号

邮政编码：611830

质量咨询电话：400—988—1999

传真号码：028—87229666

网 址：www.schairong.com

扬子江药业集团

四川海蓉药业有限公司

尺寸：21×14.8cm