МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Профлосин®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Профлосин®

Международное непатентованное наименование: тамсулозин

Лекарственная форма: капсулы кишечнорастворимые пролонгированного действия

Состав на 1 капсулу:

Содержимое капсулы (пеллеты, покрытые кишечнорастворимой оболочкой)

Ядро:

Действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид – 0,4 мг;

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (1:1), дисперсия 30 %, триэтилцитрат, тальк, вода очищенная.

Оболочка: метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (1:1), дисперсия 30 %, тальк, триэтилцитрат.

Капсула

Корпус капсулы: краситель железа оксид красный, Е 172, титана диоксид, Е 171, краситель железа оксид желтый, Е 172, желатин.

Крышечка капсулы: индигокармин, Е 132, краситель железа оксид черный, Е 172, титана диоксид, Е 171, краситель железа оксид желтый, Е 172, желатин.

Описание

Непрозрачные желатиновые капсулы № 2 с корпусом светло-оранжевого цвета и крышечкой серо-зеленого цвета. На корпусе и крышечке капсулы нанесено по одной черной линии. На крышечке капсулы нанесено «TSL0.4».

Содержимое капсул: пеллеты от белого до почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: α_1 - адреноблокатор

Код АТХ: G04CA02

99147

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тамсулозин избирательно и конкурентно блокирует постсинаптические α_1-адренорецепторы, находящиеся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры, преимущественно подтипы α_{1A} и α_{1D}. Это приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря, простатической части уретры и улучшению оттока мочи.

Тамсулозин увеличивает максимальную скорость мочеиспускания, уменьшает обструкцию за счет расслабления гладкомышечных клеток простаты и уретры, таким образом, улучшая симптомы опорожнения и симптомы наполнения мочевого пузыря, в развитии которых значительную роль играет гиперактивность мочевого пузыря. Данное влияние тамсулозина на симптомы наполнения и опорожнения сохраняется при долгосрочной терапии. Также существенно снижается необходимость в хирургическом вмешательстве или катетеризации.

Блокаторы α_1-адренорецепторов могут снижать артериальное давление (АД) за счет уменьшения периферического сосудистого сопротивления. Однако в клинических исследованиях тамсулозина у пациентов с нормальным уровнем АД клинически значимого снижения АД не отмечалось.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь тамсулозин быстро и практически полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Всасывание тамсулозина несколько замедляется после приема пищи. Одинаковый уровень всасывания достигается при ежедневном приеме тамсулозина после еды в одно и то же время. Тамсулозин характеризуется линейной кинетикой.

После однократного приема тамсулозина после еды максимальная концентрация (C_{max}) тамсулозина в плазме крови достигается приблизительно через 6 ч. В равновесном состоянии, которое достигается к 5-му дню приёма, C_{max} тамсулозина устанавливается на уровне примерно на 2/3 выше, чем после однократного приема. Несмотря на то, что данные показатели были выявлены у пожилых пациентов, можно ожидать аналогичных показателей и у пациентов более молодого возраста. Существуют значительные индивидуальные различия среди пациентов по концентрации тамсулозина в плазме крови после приема однократной дозы и многократного приема.

Распределение

Связь с белками плазмы крови – около 99%, объем распределения небольшой – 0,2 л/кг.

99147

Метаболизм

Тамсулозин не подвергается эффекту «первого прохождения» и медленно метаболизируется в печени с образованием менее активных метаболитов. Большая часть тамсулозина присутствует в крови в неизмененной форме. В эксперименте выявлена способность тамсулозина незначительно индуцировать активность микросомальных ферментов печени.

Выведение

Тамсулозин и его метаболиты выводятся главным образом с мочой, 9% препарата выводится в неизменном виде. Период полувыведения (T½) тамсулозина составляет приблизительно 10 ч (при однократном приеме после еды), при многократном приеме - 13 ч.

Показания к применению

Лечение дизурических расстройств при доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ).

Противопоказания

- повышенная чувствительность к тамсулозину, включая лекарственно-индуцированный ангионевротический отек, или к другим компонентам препарата;
- ортостатическая гипотензия (в т.ч., в анамнезе);
- тяжелая печеночная недостаточность;
- возраст до 18 лет (данные по эффективности и безопасности отсутствуют).

С осторожностью

- тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин);
- артериальная гипотензия.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат Профлосин® предназначен для применения только у мужчин.

Способ применения и дозы

Внутрь, по 1 капсуле 1 раз в сутки после завтрака или первого приема пищи. Капсулу следует проглатывать целиком, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды. Капсулу нельзя делить на части или разламывать, так как это может повлиять на скорость высвобождения действующего вещества.

99147

Учитывая прогрессирующий характер заболевания, симптоматическая терапия может проводиться длительно. Длительность лечения определяет врач.

Пациенты с почечной и/или печеночной недостаточностью

У пациентов с почечной недостаточностью, а также у пациентов с печеночной недостаточностью легкой или средней степени тяжести коррекции дозы не требуется.

Дети

Безопасность и эффективность тамсулозина в популяции младше 18 лет не изучена.

Побочное действие

Возможные побочные эффекты при применении препарата приведены ниже по нисходящей частоте возникновения: *часто* (<1/10, ≥1/100), *нечасто* (<1/100, ≥1/1000), *редко* (<1/1000, ≥1/10000), *очень редко* (<1/10000), *частота неизвестна* (по имеющимся данным установить частоту не представляется возможным), *включая отдельные сообщения*.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головокружение; *нечасто* – головная боль; *редко* – обморочные состояния.

Нарушения со стороны органа зрения: частота неизвестна: – нечеткость зрения, нарушения зрения.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ощущение сердцебиения, ортостатическая гипотензия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, грудной клетки и органов средостения: нечасто – ринит; *частота неизвестна* – эпистаксис (носовое кровотечение).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто – запор, диарея, тошнота, рвота; *частота неизвестна* – сухость во рту.

Нарушения со стороны репродуктивной системы: часто – нарушения эякуляции, ретроградная эякуляция, анэякуляция; *очень редко* – приапизм.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – сыпь, кожный зуд, крапивница; *редко* - ангионевротический отек; *очень редко* – синдром Стивенса-Джонсона; *частота неизвестна* – многоформная эритема, эксфолиативный дерматит.

Общие нарушения: нечасто – астения.

В ходе пострегистрационных наблюдений были зарегистрированы случаи развития синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка) при операции по поводу катаракты или глаукомы у пациентов, принимавших тамсулозин.

99147

Опыт постмаркетингового применения: в дополнение к перечисленным выше побочным эффектам на фоне применения тамсулозина были зарегистрированы отдельные случаи фибрилляции предсердий, нарушения ритма сердца, тахикардии и диспноэ. Поскольку данные спонтанные сообщения поступали после выхода препарата на рынок по всему миру, не представляется возможным с достаточной степенью надежности оценить частоту развития данных явлений и их связь с применением тамсулозина.

Передозировка

Сообщений о случаях острой передозировки при приеме препарата до настоящего времени не наблюдалось. Передозировка тамсулозина может потенциально привести к тяжелой гипотензии (наблюдалась при разной выраженности передозировки).

Теоретически имеется вероятность резкого снижения артериального давления и тахикардии, что может потребовать проведения соответствующих мероприятий. Для восстановления АД (в том числе, при ортостатической гипотензии) и частоты сердечных сокращений до нормальных значений, пациента необходимо уложить в горизонтальное положение. Если этой меры окажется недостаточно, следует провести мероприятия для восстановления объема циркулирующей жидкости и, при необходимости, применить сосудосуживающие средства. Необходим контроль функции почек, а также проведение общей поддерживающей терапии.

Для предотвращения дальнейшей абсорбции тамсулозина целесообразно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного (например, натрия сульфата).

Проведение гемодиализа нецелесообразно, поскольку тамсулозин обладает высоким сродством к белкам плазмы крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Тамсулозин не взаимодействует с атенололом, эналаприлом и теофиллином. При одновременном применении с циметидином отмечено некоторое повышение концентрации тамсулозина в плазме крови; с фуросемидом - снижение концентрации тамсулозина в плазме крови, однако это не требует коррекции дозы препарата Профлосин®, поскольку концентрация тамсулозина остается в пределах нормального диапазона. Диклофенак и варфарин могут увеличивать скорость выведения тамсулозина.

In vitro диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадинон, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин, варфарин не влияли на свободную фракцию

99147

тамсулозина в плазме крови человека. В свою очередь тамсулозин не изменял свободные фракции диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона.

Одновременное применение тамсулозина с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 может приводить к увеличению концентрации тамсулозина в плазме крови. Одновременное применение с кетоконазолом (сильный ингибитор изофермента CYP3A4) приводило к увеличению AUC и C_{max} тамсулозина в 2,8 и 2,2 раза, соответственно.

Тамсулозин не следует назначать одновременно с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 пациентам с нарушением метаболизма изофермента CYP2D6.

Тамсулозин следует применять с осторожностью одновременно с сильными и умеренными ингибиторами изофермента CYP3A4.

Одновременное применение тамсулозина с пароксетином, сильным ингибитором изофермента CYP2D6, приводило к увеличению C_{max} и AUC тамсулозина в 1,3 и 1,6 раз, соответственно, однако данные изменения не имели клинической значимости.

Одновременное применение тамсулозина с другими блокаторами α_1-адренорецепторов, ингибиторами холинэстеразы, алпростадилом, анестетиками, диуретиками, леводопой, миорелаксантами, нитратами, антидепрессантами, бета-адреноблокаторами, блокаторами «медленных» кальциевых каналов, этанолом может приводить к выраженному снижению артериального давления.

Особые указания

При первых признаках ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) пациента следует усадить или уложить.

Перед началом терапии препаратом Профлосин® следует исключить наличие у пациента заболеваний и состояний, способных обусловить симптоматику, сходную с таковой при доброкачественной гиперплазии простаты.

Перед началом лечения и регулярно во время терапии должно выполняться пальцевое ректальное обследование и, если потребуется, определение концентрации специфического простатического антигена (ПСА).

Применение тамсулозина у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) требует осторожности, так как исследований в этой популяции пациентов не проводилось.

При оперативных вмешательствах по поводу катаракты или глаукомы на фоне приема препарата или при его предшествующем применении у некоторых пациентов возможно развитие синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка), что необходимо учитывать при предоперационной подготовке

99147

пациента и при проведении операции. Рекомендовано отменить приём тамсулозина за 1-2 недели до оперативного вмешательства по поводу катаракты или глаукомы, однако польза отмены терапии тамсулозином до настоящего времени не доказана. Синдром узкого зрачка может также развиться у пациентов, принимавших тамсулозин за больший период времени до оперативного вмешательства.

Назначение тамсулозина пациентам, у которых планируется оперативное вмешательство по поводу катаракты или глаукомы, не рекомендовано.

В период предоперационной подготовки хирургу-офтальмологу следует уточнить факт применения пациентом тамсулозина в настоящее время или ранее, чтобы при необходимости принять соответствующие меры для предотвращения синдрома узкого зрачка.

В краткосрочных и длительных клинических исследованиях у пациентов, принимавших тамсулозин, наблюдались случаи развития расстройств эякуляции. В пострегистрационном периоде были отмечены случаи нарушения эякуляции, ретроградной эякуляции, анэякуляции.

Отмечались случаи развития длительной эрекции и приапизма на фоне применения α_1-адреноблокаторов. В случае сохранения эрекции в течение более 4 ч следует немедленно обратиться за медицинской помощью. Терапия приапизма должна проводиться незамедлительно во избежание повреждения тканей полового члена и необратимой утраты потенции.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и другими механизмами

Исследований по влиянию тамсулозина на способность к управлению транспортными средствами и механизмами не проводилось. Но, учитывая возможность возникновения головокружения, необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и другими механизмами, а также при занятиях другими потенциально опасными видами деятельности.

Форма выпуска

Капсулы кишечнорастворимые пролонгированного действия, 0,4 мг.

По 10 капсул в блистер из ПВХ/ПЭ/ПВДХ/фольги алюминиевой.

По 1, 3 или 10 блистеров вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную пачку.

99147

Условия хранения

При температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

3 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

Роттендорф Фарма ГмбХ

Остенфельдер штрассе 51-61

59320, Эннигерло, Германия

Выпускающий контроль

Менарини – Фон Хейден ГмбХ

Лейпцигер штрассе 7-13

01097, Дрезден

Германия

Адрес для предъявления претензий

123112, г. Москва, Пресненская набережная, д. 10, БЦ «Башня на Набережной», Блок Б

тел. (495) 785-01-00, факс (495) 785-01-01.

Медицинский директор Аксенова О.Г.

МЗ РФ
ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ
ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ
ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА
0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 4
ФГБУ НЦЭСМП

99147