

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Алфупрост® МР, 10 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: алфузозин

Каждая таблетка с пролонгированным высвобождением содержит алфузозина гидрохлорид (в составе гранул) 10,00 мг.

Препарат содержит лактозу безводную (см. п. 4.3. и 4.4.). Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки с пролонгированным высвобождением.

Круглые, двояковыпуклые таблетки без оболочки с гравировкой “RY 10” на одной из сторон от белого до почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1 Показания к применению

- Препарат Алфупрост МР показан к применению у взрослых мужчин старше 18 лет.
- Лечение функциональных симптомов доброкачественной гиперплазии предстательной железы.
- В качестве вспомогательного средства при использовании катетера при острой задержке мочи, связанной с доброкачественной гиперплазией предстательной железы.

4.2 Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Лечение функциональных симптомов доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Рекомендованная доза составляет: 1 таблетка (10 мг) ежедневно, после еды.

Применение в качестве вспомогательного средства при использовании катетера при острой задержке мочи, связанной с доброкачественной гиперплазией предстательной железы.

Рекомендованная доза – 1 таблетка (10 мг) в сутки, после еды, начиная с первого дня катетеризации.

Препарат применяют в течение 3 – 4 суток, то есть, 2 – 3 дня во время нахождения катетера

в уретре и 1 день после его удаления.

Дети

Алфузозин не показан к применению у детей и подростков до 18 лет.

Способ применения

Препарат предназначен для приема внутрь. Пациенты должны проглатывать таблетку целиком. Запрещается измельчать, раздавливать, разжевывать, размалывать таблетку в порошок. Эти действия могут привести к ненадлежащему высвобождению алфузозина из таблетки и его абсорбции, что повышает риск развития нежелательных реакций (см. раздел 4.4).

4.3 Противопоказания

- Гиперчувствительность к алфузозину и/или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.
- Ортостатическая гипотензия (в том числе, в анамнезе).
- Печёночная недостаточность.
- Почечная недостаточность тяжёлой степени (клиренс креатинина <30 мл/мин).
- Непереносимость лактозы, дефицит лактазы и синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции.
- Одновременный приём с другими альфа₁-адреноблокаторами.
- Одновременный приём с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 (такими как кетоконазол, итраконазол и ритонавир (см. раздел 4.5)).
- Возраст до 18 лет.

4.4 Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью:

- У пациентов, принимающих гипотензивные препараты или нитраты (возможно развитие ортостатической гипотензии, протекающей бессимптомно или сопровождающейся головокружением, слабостью, холодным потом).
- У пациентов пожилого возраста (старше 75 лет).
- У пациентов с выраженной гипотензивной реакцией на другие альфа₁-адреноблокаторы в анамнезе.
- У пациентов с ишемической болезнью сердца (ИБС) (возможно учащение и утяжеление приступов стенокардии).
- У пациентов с врожденным или приобретенным удлинением интервала QT или у пациентов, принимающих лекарственные препараты, увеличивающие продолжительность интервала QT.

- У пациентов с ишемией головного мозга с клинической симптоматикой или без клинической симптоматики (в связи с возможностью снижения артериального давления (АД) и усиления ишемии головного мозга).

В течение нескольких часов после приёма алфузозина (как и после приёма любых других альфа₁-адреноблокаторов) у некоторых пациентов, в особенности, у пациентов, принимающих гипотензивные препараты, может развиваться ортостатическая гипотензия с клинической симптоматикой (головокружение, резкая слабость, холодный пот) или без неё. При появлении этих симптомов пациент должен до их полного исчезновения находиться в горизонтальном положении. Ортостатическая гипотензия обычно бывает преходящей и наблюдается, как правило, в начале приёма препарата и обычно не требует отмены лечения. В пострегистрационном периоде применения алфузозина у пациентов с факторами риска снижения АД (такими, как заболевания сердца или сопутствующая терапия гипотензивными препаратами) сообщалось о выраженном снижении АД. Риск чрезмерного снижения АД и связанных с ним нежелательных реакций может быть выше у пациентов пожилого возраста.

Перед началом лечения пациент должен быть предупрежден о возможности возникновения описанных выше реакций.

Следует соблюдать осторожность при применении алфузозина у пациентов с ортостатической гипотензией или у пациентов, принимающих гипотензивные препараты или нитраты: необходим более тщательный контроль за АД, в том числе, при переходе из горизонтального положения в вертикальное, особенно в начале лечения.

Следует соблюдать осторожность при применении алфузозина у пациентов с выраженной гипотензивной реакцией в ответ на приём других блокаторов альфа₁-адренорецепторов в анамнезе.

Пациентам с коронарной недостаточностью при приёме алфузозина необходимо продолжать антиангинальную терапию. При возобновлении или утяжелении стенокардии лечение алфузозином следует прекратить.

Следует соблюдать осторожность при применении алфузозина у пациентов с врожденным или приобретенным удлинением интервала QT или у пациентов, принимающих лекарственные препараты, способные удлинять интервал QT.

Во время проведения офтальмологических операций по поводу катаракты у некоторых пациентов, принимающих или принимавших ранее некоторые альфа₁-адреноблокаторы, наблюдалось развитие интраоперационного синдрома атоничной радужки (вариант синдрома «узкого зрачка»). Хотя риск развития такого осложнения при приёме препарата Алфупрост МР представляется очень низким, перед проведением операции по поводу

катаракты хирург-офтальмолог должен быть проинформирован о том, что пациент принимает альфа₁-адреноблокаторы или принимал их ранее, так как развитие интраоперационного синдрома атоничной радужки может увеличивать количество осложнений при этом оперативном вмешательстве. Офтальмологи должны быть готовы к возможному изменению методики оперативного вмешательства. Пациентов следует предупредить о том, что таблетку следует проглатывать целиком и о том, что запрещается измельчать, раздавливать, разжевывать, размалывать таблетку в порошок. Такие действия могут привести к несоответствующему высвобождению и абсорбции препарата, вследствие чего возможно более быстрое развитие нежелательных реакций. Есть сообщения о случаях развития приапизма (длительной болезненной эрекции полового члена, не связанной с сексуальной активностью) на фоне терапии альфа₁-адреноблокаторами, включая алфузозин. Если терапия приапизма не была проведена незамедлительно, это может привести к повреждению тканей полового члена и необратимой утрате потенции. Пациентов следует информировать о серьезности этого состояния (см. раздел 4.8) и необходимости немедленного обращения за медицинской помощью в случае сохранения эрекции в течение более 4-х часов.

Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.5 Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Противопоказанные комбинации

- С блокаторами альфа₁-рецепторов (празозин, урапидил, доксазозин): риск развития тяжелой ортостатической гипотензии и усиления гипотензивного действия (см. раздел 4.3).
- С мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 (такими как кетоконазол, итраконазол, позаконазол, вориконазол, теллапревир, ритонавир, нелфинавир, кларитромицин, кобицистат, эритромицин, телитромицин), так как увеличивается риск увеличения концентрации алфузозина в плазме крови и нежелательных реакций (см. раздел 4.3).

Взаимодействия, которые следует принимать во внимание

- С гипотензивными препаратами – усиление гипотензивного эффекта и риск развития ортостатической гипотензии (аддитивное действие) (см. раздел 4.4).
- С нитратами – увеличение риска развития рефлекторной тахикардии и снижения АД.
- Со средствами для ингаляционной и неингаляционной общей анестезии – возможна нестабильность АД во время общей анестезии.

- С дапоксетином – увеличение риска развития нежелательных реакций (особенно таких как головокружение или обморок).

Взаимодействие, требующее соблюдения мер предосторожности

- Ингибиторы фосфодиэстеразы 5 типа (силденафил, тадалафил, варденафил, аванафил) – риск развития ортостатической гипотензии, особенно у пожилых людей.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Препарат Алфупрост МР не предназначен для применения у женщин.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Препарат Алфупрост МР может оказывать влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Препарат может вызывать головокружение и другие побочные эффекты, которые могут влиять на указанные способности.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Наиболее частыми симптомами, о которых сообщалось в качестве нежелательных реакций были: обморок/головокружение, головная боль, тошнота, боль в животе, астения, недомогание.

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции, возможные на фоне терапии алфузозином, распределены по системно-органным классам, с указанием частоты их возникновения согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ):

очень часто ($\geq 10\%$);

часто ($\geq 1\% - < 10\%$);

нечасто ($\geq 0,1\% - < 1\%$);

редко ($\geq 0,01\% - < 0,1\%$);

очень редко ($< 0,01\%$) (включая отдельные случаи); частота неизвестна (по имеющимся данным установить частоту возникновения НР не представляется возможным).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Частота неизвестна: тромбоцитопения, нейтропения.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: обморок/головокружение, головная боль.

Нечасто: синкопальное состояние, сонливость, вертиго.

Частота неизвестна: ишемические нарушения мозгового кровообращения у пациентов с

уже имеющейся цереброваскулярной патологией.

Нарушения со стороны органа зрения

Нечасто: нарушение зрения.

Частота неизвестна: интраоперационный синдром атоничной радужки (см. раздел 4.4).

Нарушения со стороны сердца

Нечасто: тахикардия, ощущение сердцебиения (пальпитация).

Очень редко: возможное учащение или утяжеление приступов стенокардии у пациентов с ИБС (см. раздел 4.4).

Частота неизвестна: фибрилляция предсердий.

Нарушения со стороны сосудов

Нечасто: снижение АД, включая ортостатическую гипотензию, «приливы» крови к кожным покровам.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Нечасто: ринит.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: тошнота, боль в животе.

Нечасто: диарея, сухость слизистой оболочки полости рта, рвота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Частота неизвестна: гепатоцеллюлярная желтуха, печёночный холестаз.

Нарушения со стороны половых органов и молочной железы

Частота неизвестна: приапизм.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: сыпь, зуд.

Очень редко: крапивница, ангионевротический отёк.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Часто: астения, недомогание.

Нечасто: отеки, боль в груди.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, строение 1

Телефон: +7(499)578-06-70, +(499)578-02-20

Адрес электронной почты: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Интернет сайт: <http://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

Чрезмерное снижение артериального давления, рефлекторная тахикардия.

Лечение

В случае передозировки пациент подлежит госпитализации. При передозировке пациент должен находиться в положении «лёжа» и ему требуется постоянное мониторирование АД. При снижении АД рекомендуется введение сосудосуживающих средств и плазмозаменителей (для увеличения объёма циркулирующей крови). После восстановления АД (устранения гипотонии) необходимо продолжить контроль АД ещё приблизительно в течение суток.

Алфузозин плохо выводится с помощью гемодиализа из-за высокой степени связывания с белками плазмы.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: средства, применяемые в урологии; средства для лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы; альфа-адреноблокаторы.

Код АТХ: G04CA01

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Алфузозин является производным хиназолина, активным при пероральном применении. Он является селективным антагонистом постсинаптических альфа₁-адренорецепторов, расположенных в предстательной железе, треугольнике мочевого пузыря и мочеиспускательном канале. Клинические проявления доброкачественной гипертрофии предстательной железы выражаются в инфравезикальной обструкции мочевыводящих путей, обусловленной как анатомическими (статическими), так и функциональными (динамическими) факторами. Функциональный компонент обструкции обусловлен возбуждением альфа₁-адренорецепторов, приводящим к сокращению гладкой мускулатуры предстательной железы, её оболочки, треугольника мочевого пузыря и предстательной части уретры, что приводит к увеличению сопротивления оттока мочи из мочевого пузыря и, по-видимому, к вторичной нестабильности мочевого пузыря.

Вследствие прямого воздействия на гладкую мускулатуру ткани предстательной железы, связанной с блокадой альфа₁-адренорецепторов, алфузозин уменьшает инфравезикальную обструкцию, давление в уретре и сопротивление оттоку мочи во время мочеиспускания. За счет этого алфузозин улучшает отток мочи и облегчает опорожнение мочевого пузыря. Эти благоприятные эффекты на уродинамику ведут к уменьшению симптомов раздражения мочевыводящих путей и симптомов, обусловленных нарушениями оттока мочи у пациентов с доброкачественной гиперплазией предстательной железы. У пациентов с максимальной скоростью оттока мочи (Q_{max}) < 15 мл/сек алфузозин, уже начиная с первой дозы, значительно увеличивает Q_{max} (в среднем на 30 %). Кроме того, у пациентов с доброкачественной гипертрофией предстательной железы алфузозин значительно снижает давление в детрузоре мочевого пузыря и увеличивает объем мочи, вызывающий позыв к мочеиспусканию, а также значительно снижает объем остаточной мочи. Эти эффекты приводят к уменьшению обструктивных и ирритативных симптомов доброкачественной гипертрофии предстательной железы. Препарат не оказывает неблагоприятного действия на сексуальную функцию.

Клиническая эффективность и безопасность

В связи с селективностью действия алфузозина его влияние на альфа₁-адренорецепторы сосудов и, соответственно, на АД, в случае его применения в терапевтических дозах, практически отсутствует.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Среднее значение относительной биодоступности составляет 104,4 %, по сравнению с применением алфузозина в дозе 7,5 мг в лекарственной форме немедленного высвобождения (2,5 мг 3 раза в сутки) у здоровых добровольцев среднего возраста. Исследования показали, что биодоступность алфузозина увеличивается при приеме препарата после еды (см. раздел 4.2).

Распределение

Максимальная концентрация алфузозина в плазме достигается через 9 часов после приема препарата, по сравнению с 1 часом для формы немедленного высвобождения. Связывание с белками плазмы крови составляет около 90 %.

Биотрансформация

Алфузозин подвергается значительному метаболизму в печени, в основном, с помощью изофермента CYP3A4. В моче обнаруживается только 11 % неизмененного алфузозина. Метаболиты алфузозина не обладают фармакологической активностью.

Элиминация

Период полувыведения алфузозина составляет 9,1 часов. Большинство метаболитов выводится через кишечник (75 – 90 %).

Фармакокинетика у особых групп пациентов

По сравнению со здоровыми добровольцами среднего возраста, у пациентов пожилого возраста (старше 75 лет) фармакокинетические показатели алфузозина не увеличиваются. По сравнению с лицами с нормальной функцией почек, средние значения максимальной концентрации в плазме крови (C_{max}) и площади под кривой «концентрация-время» (AUC) алфузозина у пациентов с почечной недостаточностью умеренно увеличены, без изменения периода полувыведения ($T_{1/2}$). Это изменение фармакокинетического профиля алфузозина не имеет клинического значения, поэтому не требуется коррекции дозы у пациентов с легкой и умеренно выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина >30 мл/мин.).

Фармакокинетический профиль алфузозина не изменяется при хронической сердечной недостаточности.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

гранулы:

лактоза безводная

кремния диоксид коллоидный

повидон (PVP-K 30)

тальк

магния стеарат

смесь для создания таблетки путем компрессии:

лактоза безводная

гипромеллоза

гипролоза

повидон (PVP-K 30)

кремния диоксид коллоидный

тальк

магния стеарат

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

10 таблеток в блистер из алюминиевой фольги, ПВХ и аклара. По 1, 2, 3 и 6 блистеров вместе с листком-вкладышем помещают в пачку картонную.

Не все размеры упаковок могут быть доступны для реализации.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Индия

Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд.,

Сан Хауз, Плот № 201 Б/1, Вестерн Экспресс Хайвэй, Горегаон (Ист), Мумбаи – 400063,

Махараштра

India

Sun Pharmaceutical Industries Ltd.,

Sun House, Plot No. 201 B/1, Western Express Highway, Goregaon (East), Mumbai – 400063,

Maharashtra

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения:

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Представительство компании Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд.

Россия, 107023, г. Москва, ул. Электrozаводская, д. 27, стр. 8, офисы 29, 30.

Тел.: +7 (495) 771-74-27.

Email: drugsafety.russia@sunpharma.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЕ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИЯ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Алфупрост МР доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети "Интернет" <https://eec.eaeunion.org>