

**ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Профлосин®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Профлосин®

Международное непатентованное наименование: тамсулозин

Лекарственная форма: капсулы кишечнорастворимые с пролонгированным высвобождением

Состав:

1 капсула содержит (пеллеты, покрытые кишечнорастворимой оболочкой)

Ядро:

Действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид – 0,4 мг;

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая (тип 101), метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (1:1), дисперсия 30 %, триэтилцитрат, тальк.

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

Капсула

Корпус капсулы: краситель железа оксид красный (E 172), титана диоксид (E 171), краситель железа оксид желтый (E 172), желатин.

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

Описание

Непрозрачные желатиновые капсулы № 2 с корпусом светло-оранжевого цвета и крышечкой серо-зеленого цвета.

Содержимое капсул: пеллеты от белого до почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: альфа1 - адреноблокатор

Код АТХ: G04CA02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тамсулозин является специфическим блокатором постсинаптических α_1 -адренорецепторов, находящихся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры. Блокада α_1 -адренорецепторов тамсулозином приводит к снижению тонуса гладких мышц предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и улучшению оттока мочи. Одновременно уменьшаются как симптомы опорожнения, так и симптомы наполнения мочевого пузыря, обусловленные повышенным тонусом гладкой мускулатуры и детрузорной гиперактивностью при доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Такой фармакологический эффект сохраняется в течение длительного времени. Также существенно снижается необходимость в оперативном вмешательстве или катетеризации. Способность тамсулозина воздействовать на α_{1A} подтип адренорецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с α_{1B} подтипом адренорецепторов, расположенных в гладких мышцах сосудов. Благодаря своей высокой селективности, тамсулозин не вызывает клинически значимого снижения системного артериального давления как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальным исходным уровнем артериального давления.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь тамсулозин быстро абсорбируется в кишечнике и обладает почти 100 % биодоступностью. Всасывание тамсулозина несколько замедляется после приема пищи. Равномерность абсорбции может быть достигнута в случае, если пациент каждый раз принимает препарат после обычного завтрака. Тамсулозин характеризуется линейной кинетикой.

После однократного приема внутрь в дозе 0,4 мг его максимальная концентрация в плазме достигается через 6 часов. После многократного приема внутрь 0,4 мг в сутки равновесная концентрация достигается к 5-м суткам, при этом ее значение примерно на 2/3 выше значения этого параметра после приема однократной дозы.

Распределение

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

Метаболизм

Тамсулозин не подвергается эффекту «первого прохождения» и медленно метаболизируется в печени с образованием менее активных метаболитов. Большая часть тамсулозина присутствует в крови в неизменной форме. В эксперименте выявлена

способность тамсулозина незначительно индуцировать активность микросомальных ферментов печени.

Выведение

Тамсулозин и его метаболиты выводятся главным образом почками, около 9% тамсулозина выводится в неизменном виде. Период полувыведения ($T_{1/2}$) 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

- Гиперчувствительность к тамсулозину (в том числе, наличие лекарственного ангионевротического отека в анамнезе) или к любому из вспомогательных веществ (см. раздел «Состав»);
- ортостатическая гипотензия (в т.ч., в анамнезе);
- печеночная недостаточность тяжелой степени;
- возраст до 18 лет.

С осторожностью

- почечная недостаточность в терминальной стадии (клиренс креатинина менее 10 мл/мин);
- при одновременном применении с сильными, и средней активности ингибиторами изофермента CYP3A4;
- артериальная гипотензия.

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания

Тамсулозин не показан к применению у женщин.

Способ применения и дозы

Внутрь, по 1 капсуле (0,4 мг) 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.

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

Применение препарата в особых клинических группах пациентов

Пожилые пациенты

Коррекции дозы тамсулозина не требуется.

Дети и подростки до 18 лет

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

У пациентов с нарушением функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью коррекции дозы не требуется. Применение тамсулозина у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности (клиренс креатинина <10 мл/мин) требует соблюдения мер предосторожности и тщательного врачебного наблюдения.

У пациентов с нарушением функции печени

При печеночной недостаточности легкой и средней степени тяжести, коррекции режима дозирования препарата не требуется. Применение тамсулозина при печеночной недостаточности тяжелой степени противопоказано.

Побочное действие

Нежелательные реакции, возможные на фоне терапии тамсулозином, распределены по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения согласно рекомендациям ВОЗ: часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (невозможно определить на основании имеющихся данных).

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

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

Нарушения со стороны сердца: нечасто – «ощущение сердцебиения».

Нарушения со стороны сосудов: нечасто - 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 половых органов и грудной железы: часто – нарушения эякуляции, ретроградная эякуляция, анэякуляция; *очень редко* – приапизм.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – кожная 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.

Опыт пострегистрационного применения: в дополнение к перечисленным выше нежелательным реакциям на фоне применения тамсулозина были зарегистрированы отдельные случаи фибрилляции предсердий, нарушения ритма сердца, тахикардии и диспноэ. В связи с тем, что данные были получены методом спонтанных сообщений в пострегистрационный период применения тамсулозина, не представляется возможным с достаточной степенью надежности оценить частоту развития данных нежелательных реакций и их связь с терапией тамсулозином.

Передозировка

Симптомы

Нет сообщений о случаях острой передозировки тамсулозином. Передозировка тамсулозина может вызвать серьезное снижение артериального давления и компенсаторную тахикардию.

Лечение

При передозировке лечение симптоматическое. Артериальное давление и частота сердечных сокращений могут восстановиться при принятии человеком горизонтального положения. При отсутствии эффекта можно применить средства, увеличивающие объем циркулирующей крови и, если необходимо, сосудосуживающие средства. Необходимо контролировать функцию почек. Проведение гемодиализа нецелесообразно, так как тамсулозин активно связывается с белками плазмы. Для предотвращения дальнейшего всасывания препарата целесообразно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного, например, магния сульфата.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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, поскольку концентрация тамсулозина остается в пределах нормального диапазона. Диклофенак и варфарин могут увеличивать скорость выведения тамсулозина.

In vitro диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадион, amitриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин, варфарин не влияли на свободную фракцию тамсулозина в плазме крови человека. В свою очередь тамсулозин не изменял свободные фракции диазепама, пропранолола, трихлорметиазид 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 средней активности 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, алпростадиллом, анестетиками, диуретиками, леводопой, миорелаксантами, нитратами, антидепрессантами, бета-адреноблокаторами, блокаторами «медленных» кальциевых каналов, этанолом может приводить к выраженному снижению артериального давления.

В исследованиях *in vitro* не были выявлены взаимодействия с сальбутамолом и финастеридом.

Особые указания

Как и при применении других α_1 -адреноблокаторов, при лечении тамсулозином в отдельных случаях может наблюдаться снижение артериального давления, которое иногда может привести к обмороку. 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 почечной недостаточностью тяжелой степени (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) требует осторожности, так как исследований в этой популяции пациентов не проводилось.

У некоторых пациентов, принимающих или ранее принимавших тамсулозин, во время проведения оперативных вмешательств по поводу катаракты или глаукомы возможно развитие синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром «узкого зрачка»), который может привести к осложнениям во время операции или в послеоперационном периоде. Целесообразность отмены терапии тамсулозином за 1-2 недели до операции по поводу катаракты или глаукомы не доказана. Случаи интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза имели место у пациентов, прекративших прием препарата и в более ранние сроки перед операцией. Не рекомендуется начинать терапию тамсулозином у пациентов, которые планируют оперативное вмешательство по поводу катаракты или глаукомы. Во время предоперационного обследования пациентов хирург и врач-офтальмолог должны учитывать, принимает или принимал ли данный пациент тамсулозин. Это необходимо для принятия соответствующих мер.

В пострегистрационных исследованиях 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.

В случае развития ангионевротического отека следует немедленно прекратить терапию препаратом. Повторное назначение тамсулозина противопоказано.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и 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 с пролонгированным высвобождением, 0,4 мг.

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

По 1, 3 или 10 блистеров с инструкцией по медицинскому применению препарата в картонной пачке.

Условия хранения

Не храните при температуре выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

Менарини Интернэшнл Оперейшнз Люксембург С.А., Люксембург

1, Авеню де ла Гар, L-1611

Люксембург

Производитель***Производство готовой лекарственной формы***

Синтон Испания, С.Л.

К/Кастельо, № 1

Сант Бой де Льобрегат

08830 Барселона, Испания

Выпускающий контроль

Менарини – Фон Хейден ГмбХ

Лейпцигер штрассе 7-13

01097 Дрезден

Германия

Организация, принимающая претензии от потребителей:

ООО «Берлин-Хеми/А.Менарини», Россия

123112, г. Москва, Пресненская набережная, д. 10, БЦ «Башня на Набережной», Блок Б,
тел. (495) 785-01-00, факс (495) 785-01-01.