ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

АЛФІРУМ

(ALFIRUM)

Склад:

діюча речовина: alfuzosin;

1 таблетка містить альфузозину гідрохлориду 10 мг;

допоміжні речовини: лактоза безводна, кремнію діоксид колоїдний безводний, повідон, тальк, магнію стеарат, гіпромелоза, гідроксипропілцелюлоза.

Лікарська форма. Таблетки з модифікованим вивільненням.

Основні фізико-хімічні властивості: білі або майже білі круглі двоопуклі таблетки з маркуванням «RY 10» з одного боку таблетки.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються при доброякісній гіпертрофії передміхурової залози. Антагоністи альфа-адренорецепторів. Код АТХ G04C A01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Альфузозин є активним похідним хіназоліну. Фармакологічні випробування *in vitro* показали вибірковість дії альфузозину на альфа$_1$-адренорецептори, розташовані у передміхуровій залозі, на дні сечового міхура та у передміхуровій частині сечовипускального каналу.

Клінічні прояви доброякісної гіпертрофії передміхурової залози (ДГПЗ) пов'язані з інтравезикальною непрохідністю, механізм якої включає як анатомічні (статичні), так і функціональні (динамічні) фактори. Функціональний компонент закупорки відбувається через напруження гладкої мускулатури передміхурової залози, що передається альфа$_1$-адренорецепторами. Активація альфа$_1$-адренорецепторів стимулює скорочення гладкої мускулатури, підвищуючи тим самим тонус простати, оболонки простати, передміхурової частини сечовивідного каналу і дна сечового міхура, що призводить до закупорки відтоку із сечового міхура та, можливо, вторинної нестабільності сечового міхура.

Альфа-блокада послабляє інтравезикальну непрохідність шляхом прямої дії на гладку

мускулатуру передміхурової залози.

Альфузозин знижує тиск у сечовивідному каналі і таким чином зменшує опір відтоку сечі в ході сечовипускання. Альфузозин пригнічує гіпертонічну реакцію уретри раніше, ніж судинної мускулатури.

Альфузозин поліпшує параметри виділення, знижуючи тонус уретри та опірність відтоку із сечового міхура, полегшує випорожнення міхура.

Фармакокінетика.

Абсорбція.

Середнє значення відносної біодоступності становить 104,4 % порівняно з формою негайного вивільнення (2,5 мг двічі на добу) у здорових добровольців середнього віку, а C_{max} досягається через 9 годин після прийому препарату порівняно з 1 годиною для форми негайного вивільнення.

Дослідження показали, що відповідний фармакокінетичний профіль досягається при застосуванні препарату після їди.

У разі застосування препарату після їди середні значення C_{max} та C_{trough} становлять 13,6 (СВ = 5,6) та 3,2 (СВ = 1,6) нг/мл відповідно. Середнє значення AUC_{0-24} становить 194 (СВ = 75) нг*год/мл. Плато концентрації спостерігається від 3 до 14 годин, концентрація перевищує 8,1 нг/мл ($_{C}m_{ax}$) протягом 11 годин.

Розподіл.

Зв'язування альфузозину з білками плазми становить приблизно 90 %.

Метаболізм та виведення.

Альфузозин зазнає значного метаболізму в печінці, тільки 11 % початкової сполуки виявляється у незміненому вигляді в сечі. Більшість метаболітів (які не мають активності) виводиться з калом (75-91 %).

Період напіввиведення становить 9,1 години.

Спеціальні групи пацієнтів.

Ниркова недостатність. Середні значення C_{max} і AUC у хворих з нирковою недостатністю помірно збільшені, без зміни періоду напіввиведення. Вважається, що ця зміна фармакокінетичного профілю препарату не має клінічного значення. Тому вона не вимагає корекції дози.

Серцева недостатність. Фармакокінетичний профіль альфузозину не змінюється при хронічній серцевій недостатності.

Пацієнти літнього віку. У хворих літнього віку фармакокінетичні параметри (C_{max} та AUC) не збільшуються.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування доброякісної гіперплазії передміхурової залози.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до альфузозину або до інших компонентів препарату. Ортостатична гіпотензія, комбінація з іншими альфа-блокаторами, печінкова недостатність, хронічна ниркова недостатність (кліренс креатиніну < 30 мл/хв).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Потрібно дотримуватися особливої обережності при одночасному застосуванні альфузозину і гіпотензивних препаратів, нітратів та сильних інгібіторів CYP3A4 (кетоконазол, ітраконазол та ритонавір).

Застосування загальних анестетиків у пацієнтів, які приймають альфузозин, може спричиняти тяжку артеріальну гіпотензію. Рекомендується припинити застосування препарату за 24 години до операції.

Особливості застосування.

Як і у випадку застосування всіх альфа$_1$-блокаторів, у деяких пацієнтів (особливо у хворих, які отримують гіпотензивне лікування) протягом декількох годин після прийому препарату може розвинутися постуральна гіпотензія із симптомами (запаморочення, втома, підвищене потовиділення) або без них. У таких випадках хворий повинен лежати до повного зникнення симптомів. Ці явища завичай тимчасові, спостерігаються на початку лікування та не потребують припинення застосування препарату. Хворого необхідно попередити про можливість виникнення таких явищ.

Пацієнтам з відомою підвищеною чутливістю до альфа$_1$-блокаторів слід починати лікуватися з менших доз. Необхідно регулярно контролювати артеріальний тиск, особливо на початку лікування.

Пацієнтам з коронарною недостатністю не застосовувати препарат. Необхідно продовжити специфічне лікування коронарної недостатності. Якщо поновлюється або погіршується перебіг стенокардії при звичайній антиангінальній терапії, Альфірум слід відмінити.

У деяких пацієнтів, які лікувалися або раніше застосовували тамсулозин, під час операції з приводу катаракти спостерігався інтраопераційний синдром атонічної райдужки (ІСАР, варіант синдрому вузьких зіниць). Окремі повідомлення одержані також у випадку застосування інших альфа$_1$-блокаторів, тому не можна виключати можливість такого ефекту при застосуванні Алфіруму. Оскільки ІСАР може підвищувати процедурні ускладнення під час операції з приводу катаракти, хірурга-офтальмолога необхідно заздалегідь попередити про існуюче або попереднє застосування альфа$_1$-блокаторів.

Досвід застосування препарату в осіб з порушеннями функції нирок обмежений, тому рекомендується з обережністю застосовувати препарат таким пацієнтам.

Препарат не застосовувати пацієнтам з кліренсом креатиніну менше 30 мл/хв.

Вміст лактози.

Оскільки препарат містить лактозу, його не слід застосовавати пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, з гострою лактозною недостатністю, глюкозо-галактозною мальабсорбцією або недостатністю.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Не застосовувати у період вагітності або годування груддю.

|із|***Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.***

Препарат може спричиняти такі небажані реакції як вертиго, запаморочення та астенію, тому під час лікування слід утримуватися від керування автомобілем або роботи з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначений виняткова чоловікам!

Рекомендована доза становить 1 таблетку 10 мг щодня. Застосовувати одразу після їди. Таблетки необхідно ковтати цілими. Хворого слід попередити, що таблетки не можна розкушувати, розжовувати, подрібнювати або розтирати у порошок. Подрібнювання таблеток може призвести до швидкого вивільнення та всмоктування діючої речовини препарату та внаслідок цього – до швидкої появи побічних ефектів препарату.

Діти.

Препарат не застосовувати дітям.

Передозування.

При передозуванні препарату спостерігається артеріальна гіпотензія. При передозуванні необхідно госпіталізувати хворого, провести лікування артеріальної гіпотензії. Хворий повинен перебувати у лежачому положенні.

Препарат погано діалізується через високий ступінь зв’язування з білками.

Побічні реакції.

Побічні реакції зазначені за частотою: дуже поширені (> 1/10), поширені (> 1/100; < 1/10), непоширені (> 1/1000; < 1/100), рідко поширені (> 1/10000; < 1/1000), дуже рідко поширені (< 1/10000). У кожній групі побічні реакції наведені у порядку зменшення тяжкості.

З боку нервової системи: поширені − непритомність/запаморочення, головний біль; непоширені − вертиго, нездужання, сонливість.

З боку серцево-судинної системи: непоширені − тахікардія, прискорене серцебиття, артеріальна гіпотензія (постуральна), синкопе; дуже рідко поширені − виникнення, погіршення або рецидив стенокардії у пацієнтів з попередньо існуючою хворобою коронарних артерій.

З боку травного тракту: поширені − нудота, біль у животі; непоширені − діарея, сухість у роті.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: непоширені − висипання, свербіж; дуже рідко поширені − кропив'янка, ангіоневротичний набряк.

Загальні порушення: поширені − астенія; непоширені − припливи, набряк, біль у грудях; у поодиноких випадках – пріапізм.

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С у сухому та недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери в картонній упаковці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Сан Фармасьютикал Індастріз Лімітед/

Sun Pharmaceutical Industries Limited.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

с. Гангувала, Паонта Сахіб, Дістрікт Сірмоур, Хімачал Прадеш 173025, Індія/

V. Ganguwala, Paonta Sahib, District Sirmour, Himachal Pradesh 173025, India.