

## VALMISTEYHTEENVETO

### 1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Pratsiol 1 mg tabletti

Pratsiol 2 mg tabletti

### 2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Pratsiol 1 mg tabletti: Yksi tabletti sisältää 1,1 mg pratsosiinihydrokloridia, joka vastaa 1 mg pratsosiinia.

Pratsiol 2 mg tabletti: Yksi tabletti sisältää 2,2 mg pratsosiinihydrokloridia, joka vastaa 2 mg pratsosiinia.

Apuaine, jonka vaikutus tunnetaan:

Yksi 1 mg:n tabletti sisältää 48,1 mg laktoosia.

Yksi 2 mg:n tabletti sisältää 96,1 mg laktoosia.

Täydellinen apuaineluettelo, ks. kohta 6.1.

### 3. LÄÄKEMUOTO

Tabletti.

Pratsiol 1 mg tabletti: Valkoinen tai hieman kellertävä, jakourteellinen, tasainen, viistoreunainen tabletti, koodi ORN 27, Ø noin 7 mm.

Pratsiol 2 mg tabletti: Valkoinen tai hieman kellertävä, jakourteellinen, tasainen, viistoreunainen tabletti, koodi ORN 335, Ø noin 9 mm.

Tabletin voi jakaa yhtä suuriin annoksiin.

### 4. KLIINiset TIEDOT

#### 4.1 Käyttöaiheet

Verenpainetauti.

Hyvänlaatuisen prostatahyperplasian oireiden lievitys.

#### 4.2 Annostus ja antotapa

##### Annostus

##### Verenpaineen hoito

Pratsiolin aloitusannostus on 0,5 mg 2–3 kertaa päivässä. Ensimmäinen annos on syytä ottaa illalla nukkumaan mennessä. Kerta-annosta nostetaan 3–7 vuorokauden välein 0,5–1 mg potilaan vasteen mukaan. Lopullisen hoitovasteen ilmenemiseen voi kulua 1–2 kk. Ylläpitoannos on yksilöllinen, enimmäisannos on 20 mg vuorokaudessa. Tavallinen ylläpitoannos on 4–6 mg/vrk 2–3 annokseen jaettuna.

##### Eturauhasen liikakasvu

Aloitusannostus on 0,5 mg 2 kertaa päivässä. Ensimmäinen annos on syytä ottaa illalla nukkumaan

mennessä. Kerta-annosta nostetaan 3–7 vuorokauden välein 0,5–1 mg potilaan vasteen mukaan. Lopullisen hoitovasteen ilmenemiseen voi kulua 1–2 kk. Tavallinen ylläpitoannos on 2 mg kahdesti vuorokaudessa, mitä ei tule ylittää.

Munuaisten ja maksan vajaatoiminnan yhteydessä sekä vanhuksilla saattaa annostusta olla tarpeen pienentää.

#### *Pediatriset potilaat*

Tietoja ei ole saatavilla

### **4.3 Vasta-aiheet**

Yliherkkyys vaikuttavalle aineelle, muille kinatsoliineille tai kohdassa 6.1 mainituille apuaineille.

### **4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet**

Ensimmäiseen annokseen liittyvän posturaalisen hypotension, huimauksen ja pyörtymisen välttämiseksi on syytä aloittaa hoito 0,5 mg:n annoksella, joka otetaan nukkumaan mennessä. Vanhukset ovat muita herkempiä pratsosiinin ortostaattista hypotensiota ja ensiannokseen liittyvää huimausta aiheuttavalle vaikutukselle. Tämä tulee huomioida myös hoidettaessa prostatahyperplasiapotilaita.

Pratsosiinin lisääminen muita verenpainetta laskevia lääkkeitä saavalle potilaalle saattaa laskea verenpainetta huomattavasti, ja hoito on aloitettava varovasti pienillä annoksilla.

Pratsosiinin ja fosfodiesteriäsi 5:n (PDE<sub>5</sub>) estäjien, sildenafilin, tadalafilin tai vardenafiliin, samanaikainen käyttö saattaa joillakin potilailla johtaa oireelliseen verenpaineen laskuun. Posturaalisen hypotension riskin minimoimiseksi potilaan alfasalpaajahoidon tulisi olla vakaa ennen PDE<sub>5</sub>-estäjähoitoa aloittamista.

Fyysinen rasitus, kuumuus ja alkoholi voivat pahentaa pratsosiinin hypotensiivistä vaikutusta.

Munuaisten ja maksan vajaatoiminnan yhteydessä sekä vanhuksilla tulee etenkin lääkitystä aloitettaessa noudattaa erityistä varovaisuutta.

Pratsosiinia ei suositella potilaille, joilla on sydämen vajaatoiminta, joka johtuu sydänpussin restriktiivisestä sairaudesta, aorta- tai hiippaläpän ahtaumasta tai keuhkoemboliasta. Pratsosiinia on syytä annostella varoen *angina pectorista* sairastaville potilaille.

Narkolepsian ja aivoverenkierron häiriöihin liittyvien oireiden on kuvattu pahentuneen pratsosiinihoidon aikana, joten pratsosiinin käyttöön näitä sairastavilla potilailla on syytä suhtautua pidättyvästi.

Harmaakaihileikkauksen yhteydessä on joillakin potilailla, jotka käyttävät tai ovat aiemmin käyttäneet tamsulosiinia, todettu IFIS-oireyhtymä (Intra-Operative Floppy Iris Syndrome, pienen pupillin syndrooman variantti). Kysymyksessä voi olla luokkavaikutus, koska yksittäisiä tapauksia on todettu myös muita alfa1-adrenoseptorisalpaajia käyttäneillä potilailla. Oireyhtymä saattaa lisätä leikkauskomplikaatioiden riskiä, joten harmaakaihileikkausta suunniteltaessa leikkaavan lääkärin ja hoitohenkilökunnan on selvitettävä, käyttääkö potilas parhaillaan tai onko hän aiemmin käyttänyt jotain alfa1-adrenoseptorisalpaajaa.

#### Apuaineet

Valmiste sisältää laktoosia, 1 mg tabletit 48,1 mg ja 2 mg tabletit 96,1 mg. Potilaiden, joilla on harvinainen perinnöllinen galaktoosi-intoleranssi, täydellinen laktaasiinpuutos tai glukoosi-galaktoosiimeytymishäiriö, ei pidä käyttää tätä lääkettä.

### Pediatriset potilaat

Pratsosiinia ei vähäisen kliinisen kokemuksen vuoksi suositella alle 12-vuotiaille lapsille.

## **4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset**

Pratsosiini voimistaa muiden verenpainetta alentavien lääkkeiden vaikutusta. Tämä on yleensä terapeuttisesti mielekästä, mutta voi johtaa hypotensioon erityisesti hyponatremisilla potilailla. Pratsosiinin ensiannokseen liittyvät huimaus ja pyöritys tulevat voimistuneesti esiin muita verenpainelääkkeitä, erityisesti beetasalpaajia ja kalsiuminestäjiä, saavilla potilailla.

Pratsosiinin ja fosfodiesteriäsi 5:n (PDE<sub>5</sub>) estäjien, sildenafilin, tadalafiilin tai vardenafiilin, samanaikainen käyttö saattaa joillakin potilailla johtaa oireelliseen verenpaineen laskuun (ks. kohta 4.4).

Indometasiini voi heikentää pratsosiinin verenpainetta laskevaa vaikutusta. Pratsosiini saattaa heikentää suonensisäisesti annetun klonidiinin verenpainetta alentavaa vaikutusta.

Feokromosytooman tutkimuksissa määritettävien katekoliamiinimetaboliittien pitoisuudet voivat nousta pratsosiini-hoidon yhteydessä, mikä voi johtaa väärin positiivisiin tuloksiin.

## **4.6 Hedelmällisyys, raskaus ja imetys**

### Raskaus

Pratsosiinia on käytetty raskaudenaikaisen kohonneen verenpaineen hoitoon, eikä se ole aiheuttanut äidille tai sikiölle haittoja. Koska kontrolloidut tutkimukset puuttuvat, sen raskaudenaikaiseen käyttöön on syytä suhtautua harkiten.

### Imetys

Pratsosiini erittyy ihmisen rintamaitoon vähäisessä määrin, ja sen imetyksenaikaiseen käyttöön on syytä suhtautua harkiten.

## **4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn**

Pratsiol voi heikentää suoriutumista autolla ajamisesta ja koneiden käytöstä, koska se varsinkin hoidon alussa aiheuttaa huimausta ja väsymystä ja voi johtaa pyörtymiseen.

## **4.8 Haittavaikutukset**

Ensimmäiseen annokseen liittyvät verenpaineen lasku, huimaus ja pyörtyminen ovat mahdollisia. Reaktion välttämiseksi on syytä aloittaa hoito 0,5 mg:n annoksella, joka otetaan nukkumaan mennessä. Hoidon jatkuessa tämä heijastevaikutus ei yleensä ilmene.

Haittavaikutusten yleisyysluokat on määritelty seuraavasti:

Yleiset (> 1/100), melko harvinaiset (> 1/1000, < 1/100), harvinaiset (< 1/1 000, mukaan lukien yksittäiset raportit).

	Yleiset	Melko harvinaiset	Harvinaiset
Immuunijärjestelmä			Allergiset reaktiot
Psyykkiset häiriöt	Masennus, hermostuneisuus	Unihäiriöt	Hallusinaatiot
Hermosto	Huimaus, väsyneisyys, päänsärky, voimattomuus	Parestesiat	
Silmät	Näköhäiriöt	Silmien punoitus	
Kuulo ja		Tinnitus	

tasapainoelin			
Sydän	Tykyttely	Rintakipu	
Verisuonisto	Ortostaattinen hypotensio		Pyörtyminen, turvotukset
Hengityselimet, rintakehä ja välikarsina	Hengenahdistus, nenän tukkoisuus	Nenäverenvuoto	
Ruuansulatuselimistö	Pahoinvointi, oksentelu, ripuli, ummetus, kuiva suu	Vatsakivut	Pankreatiitti
Maksa ja sappi			Poikkeavat maksa-arvot
Iho ja ihonalainen kudos	Ihottuma	Lisääntynyt hikoilu, kutina	Alopesia, <i>lichen planus</i>
Luusto, lihakset ja sidekudos		Nivelkivut	
Munuaiset ja virtsatiet	Tiheävirtsaus		Virtsainkontinenssi
Sukupuolielimet ja rinnat		Impotenssi	Priapismi

#### Epäillyistä haittavaikutuksista ilmoittaminen

On tärkeää ilmoittaa myyntiluvan myöntämisen jälkeisistä lääkevalmisteen epäillyistä haittavaikutuksista. Se mahdollistaa lääkevalmisteen hyöty-haitta-tasapainon jatkuvan arvioinnin. Terveydenhuollon ammattilaisia pyydetään ilmoittamaan kaikista epäillyistä haittavaikutuksista seuraavalle taholle:

www-sivusto: [www.fimea.fi](http://www.fimea.fi)

Lääkealan turvallisuus- ja kehittämiskeskus Fimea

Lääkkeiden haittavaikutusrekisteri

PL 55

00034 FIMEA

## 4.9 Yliannostus

Pratsosiinin akuutti toksisuus on ilmeisesti melko alhainen. Yli 60 mg:n annoksilla on aiheutunut vaikeita myrkytyksiä, joiden tärkeimmät oireet ovat hypotensio, takykardia, päänsärky, tajuttomuus, dyspnea ja pahoinvointi.

Yliannostuksen hoito koostuu lääkehiilen annosta ja verenkierron ylläpitämisestä. Verenkiertoa voidaan tukea makuuasennolla, nestehoidolla ja tarvittaessa vasopressorein (esim. dopamiini).

Dialyysistä ei ole hyötyä.

## 5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

### 5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen ryhmä: Adrenergisia alfareseptoreja salpaavat lääkeaineet, ATC-koodi: C02CA01

Pratsosiini salpaa jo pieninä pitoisuuksina adrenergisia  $\alpha_1$ -reseptoreita, mistä seuraa sileän lihaksen jänteyden ja erityisesti diastolisen verenpaineen aleneminen. Pratsosiini ei merkittävästi salpaa  $\alpha_2$ -reseptoreita, mutta se estää syklisten nukleotidien hajoamista salpaamalla fosfodiesteriaseja.

Pratsosiini laajentaa sekä laskimoita että valtimoita. Sen verenpainetta alentava vaikutus perustuu

virtausvastuksen ja sydämen esikuorman pienenemiseen. Tähän liittyy aluksi pulssitason nousu, pitkäaikaishoidossa syke voi jonkin verran hidastua.

Sydämen vajaatoimintaa sairastavilla pratsosiini lisää sydämen isku- ja minuuttitulavuutta lisäämättä hapenkulutusta. Aortta- ja hiippaläppävuodoissa pratsosiini voi vähentää takaisinvirtausta. Verenpainepotilailla on osoitettu sydämen hapenkulutuksen väheneminen ja vasemman kammion hypertrofian väheneminen.

Munuaisten verenvirtaus ja hiussuonikeräsuodoksen määrä eivät muutu tai lisääntyvät hiukan pratsosiinihoidon aikana. Munuaisten vajaatoimintaa sairastavilla pratsosiini ei oleellisesti vaikuta munuaistoimintaan. Pratsosiini nostaa HDL/LDL-suhdetta ja alentaa plasman triglyseridipitoisuutta.

Pratsosiinia on käytetty paitsi sydämen vajaatoiminnan ja kohonneen verenpaineen lääkkeenä, myös eturauhasen liikakasvuun ja neurogeeniseen rakkoon liittyvän virtsausvaikeuden hoitoon, Raynaudin taudin hoitoon sekä feokromosytooman leikkausta edeltävänä hoitona.

## 5.2 Farmakokinetiikka

### Imeytyminen

Pratsosiinin biologinen hyötyosuus suun kautta otettuna on 43–85 %, keskimäärin 68 %. Alkureitin aikana pratsosiinia metaboloivat suolen mikrobit ja suolen seinämän ja maksan entsyymit. Plasmassa pratsosiinin huippupitoisuus tulee noin kahden tunnin kuluttua annostelusta. Ruokailu voi hidastaa pratsosiinin imeytymistä vaikuttamatta imeytyneen lääkeaineen määrään.

### Jakautuminen

Pratsosiinin jakaantumistilavuus on 0,6 l/kg, vanhuksilla korkeampi kuin nuorilla. Plasmassa pratsosiinista sitoutuu orosomukoidiin ja heikommin albumiiniin 92–97 %. Vapaan pratsosiinin osuus lisääntyy maksakirroosissa, hypoalbuminemiassa ja kroonisessa munuaisten vajaatoiminnassa. Orosomukoidipitoisuutta lisäävät sairaudet, kuten tulehdustaudit, alentanevat plasman vapaan pratsosiinin määrää.

### Eliminaatio

Pratsosiini metaboloidaan maksassa lähes täysin, metaboliiteista osa on heikosti aktiivisia. Pratsosiinin puhdistuma on 3 ml/min/kg ja eliminaatiovaiheen puoliintumisaika on 2–4 tuntia, nuorilla keskimäärin lyhyempi kuin vanhuksilla. Sydämen vajaatoiminnan yhteydessä pratsosiinin puhdistuma pienenee ja eliminaatiovaiheen puoliintumisaika voi pidentyä yli kaksinkertaiseksi; myös raskaus hidastaa pratsosiinin eliminaatiota. Pratsosiinin verenpainetta alentava vaikutus kestää pidempään kuin puoliintumisajasta on pääteltävissä, kuitenkin selvästi alle vuorokauden.

Plasman pratsosiinipitoisuuden ja verenpainevasteen välillä ei ole selkeää riippuvuutta. Pratsosiini ei ole dialysoitavissa.

## 5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta

Pratsosiini ei ole osoittautunut mutageeniseksi *in vivo* -kokeissa. Rotilla tehdyssä suuriannoksisessa 18 kk:n pratsosiinialtistuksessa ei havaittu karsinogeenista vaikutusta. Pratsosiinilla ei ole merkittävää vaikutusmekanismiin liittymätöntä toksisuuspotentiaalia ihmisellä. Eläinkokeissa pratsosiini ei ole ollut teratogeeninen.

## 6. FARMASEUTTISET TIEDOT

### 6.1 Apuaineet

Laktoosimonohydraatti  
Maissitärkkelys  
Liivate

Talkki  
Magnesiumstearaatti

## **6.2 Yhteensopimattomuudet**

Ei oleellinen.

## **6.3 Kesto aika**

3 vuotta.

## **6.4 Säilytys**

Säilytä alle 25 °C. Säilytä alkuperäispakkauksessa. Herkkä valolle.

## **6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoko**

Pratsiol 1 mg ja 2 mg tabletti: HDPE-tölkki, HDPE-kierrekorkki; 100 tablettia.

## **6.6 Erityiset varotoimet hävittämiselle**

Ei erityisvaatimuksia.

## **7. MYYNTILUVAN HALTIJA**

Orion Oyj  
Orionintie 1  
02200 Espoo

## **8. MYYNTILUVAN NUMERO**

Pratsiol 1 mg tabletit: 7804  
Pratsiol 2 mg tabletit: 7805

## **9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

Myyntiluvan myöntämisen päivämäärä: 21. elokuuta 1979  
Viimeisimmän uudistamisen päivämäärä: 4. elokuuta 2010

## **10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

09.05.2019