

Состав

действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид;

1 капсула содержит 0,4 мг тамсулозина гидрохлорида;

вспомогательные вещества:

содержание капсулы: целлюлоза микрокристаллическая, метакрилатного сополимера дисперсия, полисорбат 80, натрия лаурилсульфат, триэтилцитрат, тальк;

оболочка капсулы: желатин, индигокармин FD&C синий 2 (E 132), титана диоксид (E 171), железа оксид черный (E 172), железа оксид красный (E 172), железа оксид желтый (E 172).

Лекарственная форма

Капсулы с модифицированным высвобождением, твердые.

Основные физико-химические свойства: твердые желатиновые капсулы с корпусом оранжевого цвета и крышкой оливкового цвета.

Содержимое капсул – гранулы от белого до почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые при доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Антагонисты $\alpha 1$ -адренорецепторов. Код АТХ G04C A02.

Фармакодинамика

Тамсулозин избирательно и конкурентно блокирует постсинаптические $\alpha 1$ -адренорецепторы, в частности $\alpha 1A$ и $\alpha 1D$, находящихся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры. Это приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и улучшению оттока мочи. Одновременно уменьшаются симптомы обструкции и раздражения, связанные с доброкачественной гиперплазией предстательной железы (затруднение начала мочеиспускания, ослабление струи мочи, капание после окончания мочеиспускания, ощущение неполного опорожнения мочевого пузыря, частые позывы к мочеиспусканию, позывы к мочеиспусканию в ночное время, неотложность мочеиспускания).

Эти эффекты долгое время сохраняются при долгосрочном лечении и в значительной степени сдерживают проведение хирургической операции или катетеризации.

Антагонисты $\alpha 1$ -адренорецепторов обладают способностью снижать артериальное давление путем снижения периферического тонуса сосудов. Во время проведения испытаний тамсулозина не отмечалось клинически выраженного снижения артериального давления.

Фармакокинетика

Всасывание: тамсулозин хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта, а его биодоступность составляет почти 100 %. Всасывание тамсулозина происходит несколько медленнее после приема пищи. Однородность всасывания достигается в том случае, когда пациент принимает тамсулозин, капсулы с модифицированным высвобождением, в одно и то же время после приема пищи. Фармакокинетика тамсулозина имеет линейный характер.

После приема разовой дозы тамсулозина, капсулы с модифицированным высвобождением, после еды, пиковая концентрация тамсулозина в плазме крови достигается через 6 часов, а стабильная концентрация образуется на пятые сутки после ежедневного приема препарата. Стах при этом приблизительно на две трети выше той, что образуется после приема разовой дозы.

Распределение: у мужчин тамсулозин примерно на 99 % связывается с белками плазмы крови. Объем распределения препарата незначительный (примерно 0,2 л/кг).

Метаболизм: тамсулозина гидрохлорид не поддается эффекту первого прохождения и медленно метаболизируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов, сохраняющих высокую селективность к $\alpha 1$ -адренорецепторам. Большая часть активного вещества присутствует в крови в неизмененном виде.

Элиминация: тамсулозин и его метаболиты выводятся из организма преимущественно с мочой. Примерно 9 % от дозы остается в виде неизмененного действующего вещества.

После однократного приема дозы тамсулозина, капсулы с модифицированным высвобождением, после еды и при стабильной концентрации в плазме крови периоды полувыведения составляют примерно 10 и 13 часов.

Показания

Лечение функциональных расстройств со стороны нижних мочевых путей при доброкачественной гиперплазии простаты.

Противопоказания

Гиперчувствительность к тамсулозину гидрохлориду, включая лекарственно-индуцированный ангионевротический отек, или к любому из вспомогательных веществ; наличие в анамнезе ортостатической гипотензии; тяжелая печеночная недостаточность.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследования взаимодействий выполнялись только у взрослых.

При одновременном применении тамсулозину гидрохлорида с атенололом, эналаприлом, нифедипином или теофиллином лекарственные взаимодействия не отмечались. Одновременное применение с циметидином повышает, а с фуросемидом – снижает концентрацию тамсулозину в плазме крови, но поскольку эти уровни остаются в пределах нормы, в специальной коррекции дозы тамсулозину нет необходимости.

В исследованиях *in vitro* диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадион, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не влияют на свободную фракцию тамсулозину в плазме крови человека. Подобным образом тамсулозин не изменяет уровень свободных фракций диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона в плазме крови человека.

Однако диклофенак и варфарин могут повышать скорость элиминации тамсулозину.

Одновременное применение тамсулозину гидрохлорида с сильными ингибиторами CYP3A4 может привести к увеличению влияния тамсулозину гидрохлорида. Одновременное применение с кетоконазолом (известный сильный ингибитор CYP3A4) приводило к увеличению AUC и C_{max} до 2,8 и 2,2 соответственно.

Тамсулозину гидрохлорид не следует назначать в сочетании с сильными ингибиторами CYP3A4 у пациентов с низким метаболизмом CYP2D6.

Тамсулозину гидрохлорид следует применять с осторожностью в комбинации с сильными и умеренными ингибиторами CYP3A4.

Одновременное применение тамсулозина гидрохлорида и пароксетина (сильный ингибитор CYP2D6) приводит к увеличению максимальной концентрации и AUC в 1,3 и 1,6 соответственно, но это не является клинически значимым.

Одновременное применение с другими α_1 -адренорецепторами может усиливать гипотензивное действие.

Особенности применения

Как и при применении других α_1 -адреноблокаторов, в отдельных случаях при применении тамсулозина возможно снижение артериального давления, что может иногда привести к потере сознания. При появлении первых признаков ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) пациент должен сесть или принять горизонтальное положение до исчезновения вышеуказанных симптомов.

Перед тем как начать лечение тамсулозином, следует пройти медицинское обследование с целью выявления других сопутствующих заболеваний, которые могут вызвать такие же симптомы как доброкачественная гиперплазия предстательной железы. Перед началом лечения необходимо провести ректальное обследование предстательной железы и при необходимости – тест на определение уровня специфического антигена предстательной железы (PSA) в начале и через одинаковые промежутки времени во время лечения.

Назначать препарат пациентам с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина <10 мл/мин) необходимо с особой осторожностью, поскольку клинических исследований по использованию тамсулозина для таких пациентов не проводилось.

У некоторых пациентов, которые принимали или принимают тамсулозин, во время хирургического вмешательства по поводу удаления катаракты и глаукомы отмечался синдром атонического зрачка (IFIS, вариант синдрома суженного зрачка), что может стать причиной увеличения количества осложнений во время или после проведения такой операции.

Как правило, за 1-2 недели перед проведением операции по поводу удаления катаракты и глаукомы рекомендуется прекратить лечение тамсулозином, однако польза от прекращения лечения тамсулозином на данный момент точно не установлена. О синдроме атонического зрачка сообщали также у пациентов, у которых прекратили применение тамсулозина в течение длительного времени до проведения оперативного вмешательства по поводу катаракты. У пациентов перед плановой операцией катаракты или глаукомы не рекомендуется начало приема тамсулозина гидрохлорида. При подготовке к операции хирурги и

офтальмологи должны узнать, принимал (или принимает) пациент тамсулозин с целью предупреждения возможных осложнений, связанных с IFIS.

Тамсулозина гидрохлорид не следует назначать в сочетании с сильными ингибиторами CYP3A4 пациентам с низким метаболизмом CYP2D6.

Тамсулозина гидрохлорид следует применять с осторожностью в комбинации с сильными и умеренными ингибиторами CYP3A4 (см. «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Сообщали о случаях аллергических реакций на тамсулозин у пациентов с наличием в анамнезе аллергии на сульфаниламиды. Следует соблюдать осторожность при применении тамсулозина гидрохлорида у пациентов, у которых ранее отмечалась аллергия на сульфаниламиды.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Исследование влияния препарата на способность управлять автотранспортом или механизмами не проводили. Однако пациенты должны быть предупреждены о возможности возникновения головокружения.

Применение в период беременности или кормления грудью

Тамсулозин не показан для применения женщинам.

Фертильность.

Во время клинических исследований тамсулозина в течение короткого и длительного времени отмечались нарушения эякуляции. Случаи нарушения эякуляции, ретроградной эякуляции и недостаточной эякуляции отмечались в послерегистрационном периоде.

Способ применения и дозы

Рекомендуемая доза для взрослых – 1 капсула ежедневно, после завтрака или после первого приема пищи. Капсулу проглатывать целиком, не разламывать и не разжевывать, поскольку это будет препятствовать модифицированному высвобождению активного ингредиента.

У пациентов с почечной недостаточностью не требуется коррекция дозы. У пациентов с умеренной и средней степени тяжести печеночной недостаточностью не требуется коррекция дозы (см. также

«Противопоказания»).

Дети

Препарат не применять детям.

Безопасность и эффективность тамсулозина у детей до 18 лет не оценивали.

Передозировка

Симптомы.

Передозировка тамсулозина гидрохлоридом может потенциально вызвать тяжелое гипотензивное действие. Тяжелое гипотензивное действие отмечалось при различных степенях передозировки.

Лечение.

В случае резкого снижения давления вследствие передозировки следует проводить поддерживающую терапию, направленную на восстановление нормальной функции сердечно-сосудистой системы (например, пациент должен принять горизонтальное положение). Если эта мера не действует, провести инфузионную терапию и назначить вазопрессорные средства. Необходимо следить за функцией почек и проводить общую поддерживающую терапию. Вследствие высокой степени связывания тамсулозина с белками плазмы крови проведение гемодиализа вряд ли целесообразно.

С целью прекращения дальнейшего всасывания препарата можно искусственно вызвать рвоту. При передозировке значительного количества препарата пациенту необходимо промыть желудок с применением активированного угля и низкоосмотических слабительных средств, таких как сульфат натрия.

Побочные реакции

Система организма	Часто (>1/100, <1/10)	Нечасто (>1/1000, <1/100),	Редко (>1/10000, <1/1000)	Очень редко (<1/10000)	В (с о в д д
Неврологические расстройства	Головокружение (1,3 %)	Головная боль	Обморок		

Со стороны органов зрения					З З Н З
Со стороны сердца		Ощущение сердцебиения			
Сосудистые расстройства		Ортостатическая гипотензия			
Респираторно-медиастинальные расстройства		Ринит			Н К
Желудочно-кишечные расстройства		Запор, диарея, тошнота, рвота			С
Со стороны кожи и слизистых оболочек		Сыпь, зуд, крапивница	Ангинеуротический отек	Синдром Стивенса-Джонсона	М э э д
Репродуктивные нарушения	Расстройства эякуляции, включая ретроградную эякуляцию и недостаточность эякуляции			Приапизм	
Общие расстройства		Астения			

*- отмечались в пострегистрационный период.

Во время послерегистрационного надзора описаны случаи интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром суженного зрачка) при операции по поводу катаракты и глаукомы у пациентов, принимавших тамсулозин (см. раздел «Особенности применения»).

Послерегистрационный опыт: помимо вышеуказанных побочных реакций сообщалось о случаях фибрилляции предсердий, аритмии, тахикардии и диспноэ. Так как об указанных случаях сообщали спонтанно, частота сообщений и роль тамсулозина в этом случае не может быть достоверно установлена.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Данный препарат не требует особого температурного режима хранения.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 капсул в блистере, по 3 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АЛКАЛОИД АД Скопье/ ALKALOID AD Skopje.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Бульвар Александра Македонского, 12, Скопье, 1000, Республика Македония/
Boulevard Aleksandar Makedonski 12, Skopje, 1000, Republic of Macedonia.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).