

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тамсулозин-OBL

Регистрационный номер

Торговое наименование

Тамсулозин-OBL

Международное непатентованное наименование

Тамсулозин

Лекарственная форма

капсулы с модифицированным высвобождением

Состав

1 капсула с модифицированным высвобождением содержит:

действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид 0,4 мг в составе пеллет;

вспомогательные вещества: «инертные» пеллеты (сахароза, крахмал кукурузный, повидон), гипромеллоза, тальк, кремния диоксид коллоидный (аэросил), полисорбат-80;

вспомогательные вещества для оболочки: гипромеллоза, этилцеллюлоза, метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (1 : 1), триэтилцитрат;

капсулы твердые желатиновые: [корпус: желатин; крышечка: краситель азорубин, желатин].

Описание

Твердые желатиновые капсулы № 2 с прозрачным бесцветным корпусом и прозрачной крышечкой розового цвета. Содержимое капсул – сферические пеллеты белого или 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 гладкой мускулатуры предстательной

железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и улучшению оттока мочи. Одновременно уменьшаются как симптомы опорожнения, так и симптомы наполнения, обусловленные повышенным тонусом гладкой мускулатуры и детрузорной гиперактивностью при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Способность тамсулозина воздействовать на α_{1A} подтип адrenoрецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с α_{1B} подтипом адrenoрецепторов, которые расположены в гладких мышцах сосудов. Благодаря своей высокой селективности, тамсулозин не вызывает клинически значимого снижения системного артериального давления (АД) как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальными показателями АД.

Фармакокинетика

Всасывание: тамсулозин хорошо всасывается в кишечнике и обладает почти 100% биодоступностью. Всасывание тамсулозина несколько замедляется после приема пищи. Одинаковый уровень всасывания может быть достигнут в том случае, если пациент каждый раз принимает препарат после обычного завтрака. Тамсулозин характеризуется линейной кинетикой. После однократного приема внутрь 0,4 мг препарата его максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) достигается через 6 часов. После многократного приема внутрь 0,4 мг в день равновесная концентрация (C_{ss}) достигается к 5-му дню, при этом ее значение примерно на 2/3 выше значения этого параметра после приема однократной дозы.

Распределение: связь с белками плазмы - 99%, объем распределения небольшой (около 0,2 л/кг).

Метаболизм: тамсулозин медленно метаболизируется в печени с образованием менее активных метаболитов. Большая часть тамсулозина представлена в плазме крови в неизменной форме.

В эксперименте выявлена способность тамсулозина незначительно индуцировать активность микросомальных ферментов печени.

При незначительной и умеренной степени печеночной недостаточности не требуется коррекции режима дозирования.

Выведение: тамсулозин и его метаболиты главным образом выводятся почками, при этом приблизительно около 9% препарата выделяется в неизменном виде.

Период полувыведения препарата ($T_{1/2}$) при однократном приеме 0,4 мг после еды составляет 10 часов, при многократном - 13 часов.

При почечной недостаточности не требуется снижения дозы, при наличии у пациента тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) назначение тамсулозина необходимо проводить с осторожностью.

Показания к применению

Лечение дизурических расстройств при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Противопоказания

Гиперчувствительность к тамсулозину или любому другому компоненту препарата.

Дефицит сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Ортостатическая гипотензия (в т.ч. в анамнезе).

Выраженная печеночная недостаточность.

С осторожностью

Тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин); артериальная гипотензия.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат Тамсулозин-OBL предназначен для применения только у лиц мужского пола.

Способ применения и дозы

Внутрь, после завтрака, запивая водой, принимают по 1 капсуле (0,4 мг) 1 раз в сутки. Капсулу не рекомендуется разжевывать, так как это может повлиять на скорость высвобождения препарата.

У пациентов с нарушением функции печени и почек

При почечной недостаточности, а также при легкой и умеренной печеночной недостаточности не требуется коррекции режима дозирования.

Побочное действие

Частота развития нежелательных реакций представлена согласно классификации ВОЗ: очень часто ($\geq 1/10$ случаев), часто ($\geq 1/100$ и $< 1/10$ случаев), нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$ случаев), редко ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$ случаев) и очень редко ($< 1/10000$ случаев).

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

нечасто – ощущение сердцебиения, ортостатическая гипотензия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

нечасто – запор, диарея, тошнота, рвота.

Со стороны нервной системы:

часто – головокружение;

нечасто – головная боль;

редко – обморок.

Со стороны репродуктивной системы:

нечасто – нарушения эякуляции;

очень редко – приапизм.

Со стороны органов дыхания, грудной клетки и средостения:

нечасто – ринит.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки

нечасто – кожная сыпь, кожный зуд, крапивница;

редко – ангионевротический отек;

очень редко – синдром Стивенса-Джонсона;

частота неизвестна – мультиформная экссудативная эритема, эксфолиативный дерматит.

Прочие:

нечасто – астения;

частота неизвестна – носовое кровотечение.

Описаны случаи интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка) при операции по поводу катаракты и глаукомы у пациентов, принимавших тамсулозин.

В дополнение к побочным эффектам, описанным выше, при использовании тамсулозина наблюдались фибрилляция предсердий, аритмия, тахикардия и одышка. В связи с тем, что данные были получены методом спонтанных сообщений в период после регистрации, определение частоты и причинно-следственной связи этих явлений с приемом тамсулозина представляется затруднительным.

Передозировка

Нет сообщений о случаях острой передозировки тамсулозином. Однако, теоретически при передозировке возможно развитие острого снижения АД и компенсаторной тахикардии, в случае которой необходимо проведение симптоматической терапии. 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. Маловероятно, что диализ будет эффективен, так как тамсулозин сильно связан с белками плазмы.

Для предотвращения дальнейшего всасывания препарата целесообразно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного, например натрия сульфата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При назначении тамсулозина вместе с атенололом, эналаприлом или теофиллином взаимодействий обнаружено не было. При одновременном применении тамсулозина с циметидином отмечено некоторое повышение концентрации тамсулозина в плазме крови, а с фуросемидом - снижение концентрации, однако это не требует изменения дозы препарата Тамсулозин-OBL, поскольку концентрация препарата остается в пределах нормального диапазона. Диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадион, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не изменяют свободную фракцию тамсулозина в плазме человека *in vitro*. В свою очередь, тамсулозин также не изменяет свободные фракции диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона.

Диклофенак и варфарин могут увеличивать скорость выведения тамсулозина.

Одновременное назначение тамсулозина с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 может привести к увеличению концентрации тамсулозина. Одновременное назначение с кетоконазолом (мощный ингибитор CYP3A4) приводило к увеличению AUC и C_{max} тамсулозина в 2,8 и 2,2 раза соответственно.

Тамсулозин не следует применять в комбинации с сильными ингибиторами CYP3A4 у пациентов с нарушением метаболизма изофермента CYP2D6. Препарат следует применять с осторожностью в комбинации с сильными и умеренными ингибиторами CYP3A4.

Одновременное назначение тамсулозина и пароксетина, сильного ингибитора CYP2D6, приводило к увеличению C_{max} и AUC тамсулозина в 1,3 и 1,6 раза соответственно, однако данное увеличение признано клинически незначимым.

Одновременное назначение других антагонистов α_1 -адренорецепторов может привести к снижению АД.

Особые указания

Как и при использовании других α_1 -адреноблокаторов, при лечении препаратом Тамсулозин-OBL в отдельных случаях может наблюдаться снижение АД, которое иногда может привести к обморочному состоянию. При первых признаках ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) пациент должен сесть или лечь и оставаться в этом положении до тех пор, пока указанные симптомы не исчезнут.

При оперативных вмешательствах по поводу катаракты или глаукомы на фоне приема препарата возможно развитие синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки (синдром узкого зрачка), что необходимо учитывать хирургу для предоперационной подготовки пациента и при проведении операции. Целесообразность отмены терапии тамсулозином за 1-2 недели до операции по поводу катаракты или глаукомы до сих пор 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, которым запланирована операция по поводу катаракты или глаукомы.

Имеются сообщения о случаях развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии альфа1-адреноблокаторами. В случае сохранения эрекции в течение более 4-х часов следует немедленно обратиться за медицинской помощью. Если терапия приапизма не была проведена незамедлительно, это может привести к повреждению тканей полового члена и необратимой утрате потенции.

Прежде чем начать терапию препаратом Тамсулозин-OBL, пациент должен быть обследован с тем, чтобы исключить наличие других заболеваний, которые могут вызывать такие же симптомы, как и ДГПЖ. Перед началом лечения и регулярно во время терапии должно выполняться пальцевое ректальное обследование и, если требуется, определение простатического специфического антигена.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и занятиями потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций, в связи с тем, что возможно развитие головокружения.

Форма выпуска

Капсулы с модифицированным высвобождением 0,4 мг.

По 10, 14, 15, 20 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2, 3 контурных ячейковых упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель/организация, принимающая претензии

АО «АЛИУМ», Россия.

Московская обл., г.о. Серпухов, рп. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2.

Выпускающий контроль качества

Московская обл., г.о. Серпухов, рп. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2, стр. 1.

Тел.: (4967) 36-01-07.

aliumpharm.ru