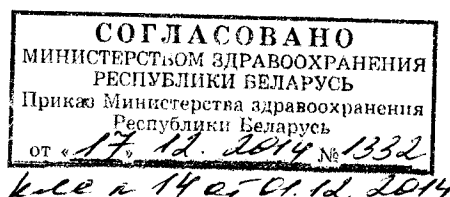


МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ



ИНСТРУКЦИЯ

(информация для специалистов)

по медицинскому применению лекарственного средства

ТАМСУЛОЗИН

Торговое название: Тамсулозин.

Международное непатентованное название: Тамсулозин (Tamsulosin).

Лекарственная форма: таблетки пролонгированного действия 0,4 мг.

Описание: таблетки белого цвета, круглые, с двояковыпуклой поверхностью.

На каждой таблетке с одной стороны нанесена надпись «T9SL», с другой стороны «0.4».

Состав: действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид - 0,4 мг; вспомогательные вещества: микрокристаллическая целлюлоза, гипромеллоза, карбомер, железа оксид красный (E172), магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

Фармакотерапевтическая группа: лекарства, используемые при доброкачественной гипертрофии предстательной железы, альфа-адреноблокаторы.

АТХ - код: G04CA02.

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Тамсулозин избирательно и конкурентным образом связывается с постсинаптическими α_{1A} и α_{1D} - адренорецепторами, которые способствуют сокращению гладких мышц, и блокирует их, вызывая расслабление гладких

мышц предстательной железы, ~~шейки мочевого пузыря~~ и простатической части уретры.

Тамсулозин усиливает скорость выделения мочи до максимальной путем расслабления гладких мышц предстательной железы и уретры, облегчая таким образом мочеиспускание.

Тамсулозин уменьшает как симптомы затруднения опорожнения пузыря, так и симптомы его наполнения, на которые оказывает сильное влияние сокращение гладких мышц. Благодаря снижению периферического сопротивления прием альфа-блокаторов может способствовать снижению артериального давления. Во время исследования влияния тамсулозина на пациентов с нормальным давлением клинически значимого снижения артериального давления не наблюдалось, поскольку его способность к связи с α_{1A} -подтипом рецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с α_{1B} -подтипом рецепторов в сосудах.

Фармакокинетика

Абсорбция

Тамсулозин быстро всасывается в кишечнике, причем его биодоступность является почти полной (100%). Скорость абсорбции снижается при приеме пищи до приема лекарственного препарата. Скорость всасывания можно поддерживать постоянной, если принимать тамсулозин после завтрака. Показатели кинетики тамсулозина носят линейный характер.

Пиковые уровни в плазме определяются приблизительно через 6 ч после приема одной дозы тамсулозина после приема полноценной пищи. На стабильном уровне концентрация устанавливается на пятый день ежедневного приема. C_{max} в плазме крови достигается через 4-6 ч как при приеме натощак, так и после приема пищи. C_{max} в плазме крови составляет 6 нг/мл при однократном приеме дозы в 0,4 мг и 11 нг/л в равновесном состоянии, при введении той же дозы. Концентрация тамсулозина в плазме крови перед очередным приемом через 24 ч составляет 40 % от C_{max} тамсулозина в плазме крови при приеме натощак и после приема пищи.

Уровни тамсулозина в плазме у разных пациентов сильно различаются как после однократного приема, так и после многократных приемов.

Распределение и элиминация

Более 99 % тамсулозина связывается с белками плазмы, объем распределения низкий (около 0,2 л/кг). Медленно метаболизируется в печени с образованием малоактивных метаболитов.

Тамсулозин и препараты его обмена выводятся преимущественно с мочой, причем около 4 % - 6 % полученной дозы в неизменном виде элиминации. Период полуэлиминации тамсулозина составляет приблизительно 10 ч (при приеме после еды) и 13 ч в устойчивом состоянии.

Показания к применению

Симптомы нарушения мочеиспускания, обусловленные доброкачественной гиперплазией предстательной железы (ДГПЖ).

Способ применения и дозы

Взрослые старше 18 лет и пожилые лица: по одной таблетке ежедневно, независимо от приема пищи. Таблетку проглатывают целиком, не разламывая и не разжевывая, что связано с действием активного вещества. При почечной недостаточности, а также легкой и умеренной печеночной недостаточности коррекции дозы не требуется.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к тамсулозину (в том числе развитие ангиоотека, обусловленного приемом лекарственного средства) или к любому вспомогательному веществу. Ортостатическая гипотензия в анамнезе. Тяжелая печеночная недостаточность.

Побочное действие

Во время удаления катаракты на фоне приема тамсулозина возможно сужение зрачка и интраоперационная нестабильность радужной оболочки глаза, известные как синдром сужения зрачка (IRIS).

Нежелательные явления, классифицированы по органам и системам, перечислены ниже в порядке убывающей частоты: частые ($\geq 1/100 < 1/10$),

нечастые ($\geq 1/1000 < 1/100$), редкие ($> 1/10000 < 1/1000$), очень редкие ($\geq 1/10000$).

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы. *Нечастые:* тахикардия, ортостатическая гипотензия. *Частота не установлена:* фибрилляция предсердий, аритмия, одышка.

Нарушения со стороны нервной системы. *Частые:* головокружение (до 1,3%); *нечастые:* головная боль; *редкие:* обмороки.

Нарушения органов дыхательной системы и средостения. *Нечастые:* ринит.

Желудочно-кишечные расстройства. *Нечастые:* запор, диарея, тошнота, рвота.

Нарушения кожи и подкожной клетчатки. *Нечастые:* сыпь, зуд, крапивница; *редкие:* ангионевротический отек; *очень редкие:* синдром Стивенса-Джонсона.

Репродуктивная система и молочные железы. *Нечастые:* нарушение эякуляции; *редкие:* приапизм.

Общие расстройства и осложнения по месту введения. *Нечастые:* астения.

Передозировка

Нет сообщений о случаях острой передозировки. Однако, теоретически возможны острая артериальная гипотензия (при которой систолическое артериальное давление составляет менее 70 мм рт.ст.), рвота и диарея, которые корректируются путем возмещения потери жидкости.

При возникновении острой артериальной гипотензии на фоне передозировки показаны меры, способствующие стабилизации функции сердечно-сосудистой системы. Нормализация артериального давления и восстановления нормальной частоты сердечных сокращений можно достичь, уложив пациента в горизонтальное положение. При отсутствии положительного эффекта показаны плазмозамещающие средства и, при необходимости, назначение сосудосуживающих препаратов.

По причине способности тамсулозина ~~активно связываться~~ с белками плазмы, положительный эффект от применения диализа маловероятен.

Целесообразно вызывать рвоту для уменьшения количества всасываемого вещества. Если в организм поступило большое количество препарата, показано промывание желудка, назначение активированного угля и осмотических слабительных средств.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

При одновременном приеме с атенололом, эналаприлом, нифедипином и теофиллином взаимодействия не наблюдались. При одновременном приеме с циметидином концентрация тамсулозина в плазме повышается, с фуросемидом снижается, однако остается в пределах нормального уровня. Диазепам, пропранолол, хлормадион, amitриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не влияют на свободную фракцию тамсулозина, сам тамсулозин также не меняет свободную фракцию диазепама, пропранолола и хлормадинона. Установлено, что тамсулозин в исследованиях *in vitro* микросомальных фракций печени (представляющих систему метаболизма энзимов, связанного с цитохромом P-450) не взаимодействует с amitриптилином, сальбутамолом, глибенкламидом и финастеридом. Прием диклофенака и варфарина может усиливать выведение тамсулозина.

Сильные ингибиторы CYP3A4 (кетоконазол) замедляют метаболизм тамсулозина и повышают его максимальную концентрацию и AUC в 2,2 и 2,8 раз соответственно. Прием сильных ингибиторов CYP2D6 (пароксетин) также повышает максимальную концентрацию и AUC тамсулозина в 1,3 и 1,6 раз, однако это не является клинически значимым.

Одновременный прием с другими антагонистами α_{1A} -адренорецепторов может способствовать снижению артериального давления.

Меры предосторожности

Прием тамсулозина может способствовать снижению артериального давления, в редких случаях сопровождающегося потерей сознания. Если

появляются первые признаки развития ортостатической гипотензии (головокружение, слабость), пациента следует усадить или уложить до исчезновения данных симптомов.

Пациента следует обследовать перед назначением тамсулозина, чтобы исключить наличие иных заболеваний, которые могут сопровождаться симптомами, схожими с симптомами доброкачественной гиперплазией простаты. Предстательную железу следует обследовать через задний проход и, если возникает необходимость, назначить анализ на специфический антиген предстательной железы перед началом лечения и впоследствии выполнять данный анализ с регулярными интервалами. К лечению пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) следует подходить с осторожностью, поскольку применение препарата у этой категории пациентов не изучалось.

Развитие ангиоотека после приема тамсулозина отмечается редко. В подобном случае прием препарата следует немедленно прекратить, а за пациентом следует наблюдать до исчезновения отека. Повторно назначать тамсулозин не следует.

У некоторых пациентов, принимавших тамсулозин на момент проведения операции или ранее, при удалении катаракты наблюдался синдром сужения зрачка. Развитие синдрома сужения зрачка может приводить к увеличению риска осложнений во время операции. Пациентам, у которых планируется удаление катаракты, назначать лечение тамсулозином не рекомендуется.

Применение в особых группах пациентов

Беременность и лактация. Тамсулозин предназначен для приема только мужчинами.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Исследования по влиянию на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами не проводились. Однако пациенты должны знать, что во время приема тамсулозина возможно головокружение.

Упаковка

10 таблеток в контурной ячейковой упаковке.

3 контурные ячейковые упаковки вместе с листком-вкладышем помещают в пачку.

Условия хранения

В защищенном от света и влаги месте, при температуре не выше ~~25~~ °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Информация о производителе

Произведено: Syntho Hispania S.L., Pol. Ind. Les Salines. Carrer Castello 1, 08830 Sant Boi De Llobregat (Barcelona), Испания.

Расфасовано и упаковано: Открытое акционерное общество «Борисовский завод медицинских препаратов», Республика Беларусь. Минская обл., г. Борисов, ул. Чапаева, 64, тел/факс +375 (177)735612.

