МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Тамсулозин ретард

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 000283-180416
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Тамсулозин ретард

Международное непатентованное наименование: Тамсулозин

Лекарственная форма: таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

1 таблетка содержит:

действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид 0,4 мг;

вспомогательные вещества: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) 41,25 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) 0,625 мг, целлюлоза микрокристаллическая 82,1 мг, магния стеарат 0,625 мг;

вспомогательные вещества для оболочки: Опадрай II (серия 85) 3 мг [спирт поливиниловый, частично гидролизованный, макрогол-3350, тальк, титана диоксид, краситель железа оксид желтый, краситель железа оксид красный, краситель железа оксид черный].

Описание:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой от желтого до коричневато-желтого цвета, круглые, двояковыпуклой формы. На поперечном разрезе видны два слоя.

Фармакотерапевтическая группа: альфа1-адреноблокатор.

Код АТХ: G04CA02.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Тамсулозин является специфическим блокатором постсинаптических альфа1-адренорецепторов, находящихся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры. Блокада альфа1-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 (ДГПЖ).

Способность тамсулозина воздействовать на альфа1А подтип адренорецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с альфа1В подтипом адренорецепторов, 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 неизмененной 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 неизмененном виде.

Период полувыведения препарата (Т½) при однократном приеме 0,4 мг после еды составляет 10 часов, при многократном приеме – 13 часов. При почечной недостаточности

не требуется снижения дозы, при наличии у пациента тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина (КК) 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, ортостатическая гипотензия (в т.ч. в анамнезе), выраженная печеночная недостаточность, детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина (КК) ниже 10 мл/мин).

Артериальная гипотензия.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат Тамсулозин ретард предназначен для применения только у лиц мужского пола.

Способ применения и дозы

Внутрь, после завтрака, запивая водой, принимают 1 таблетку пролонгированного действия, покрытую пленочной оболочкой (0,4 мг) 1 раз в сутки. Таблетку не рекомендуется разжевывать, так как это может повлиять на скорость высвобождения препарата.

Побочное действие

Частота развития нежелательных реакций представлена согласно классификации ВОЗ: очень часто (≥1/10 случаев), часто (≥1/100 и <1/10 случаев), нечасто (≥1/1000 и <1/100 случаев), редко (≥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 – сыпь, 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 артериального давления (АД) и компенсаторной тахикардии, в случае которой необходимо проведение симптоматической терапии. АД 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 *нифедипином* 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 ретард, поскольку концентрация препарата остается в пределах нормального диапазона.

Диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадинон, 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.

В исследованиях in vitro не было обнаружено взаимодействия на уровне печеночного метаболизма с амитриптилином, сальбутамолом, глибенкламидом и финастеридом. Диклофенак и варфарин могут увеличивать скорость выведения тамсулозина.

Одновременное применение тамсулозина с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 может привести к увеличению концентрации тамсулозина. Одновременное применение с кетоконазолом (сильный ингибитор изофермента CYP3A4) приводило к увеличению площади под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) и максимальной концентрации (C_{max}) тамсулозина в 2,8 и 2,2 раза соответственно.

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

Одновременное назначение тамсулозина и пароксетина, сильного ингибитора изофермента 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 α1-адренорецепторов может привести к снижению АД.

Особые указания

Как и при использовании других альфа1-адреноблокаторов, при лечении препаратом Тамсуло-зин ретард 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 положе-нии до тех пор, пока признаки не исчезнут.

При оперативных вмешательствах по поводу катаракты на фоне приема препарата возможно развитие синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (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 ретард, 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

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой, 0,4 мг.

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

По 1, 2, 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению в пачку из картона.

Срок годности

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

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Условия отпуска

По рецепту.

Производитель / Организация, принимающая претензии

ЗАО «Фармацевтическое предприятие «Оболенское».

142279, Россия, Московская обл., Серпуховский район, п. Оболенск, корп. 7-8.

Тел./факс: (4967) 36-01-07.

Директор по регистрации **Г.У. Сетдекова**