ЛП-№(001230)-(РГ-RU) от 06.03.2023

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 12.09.2022 № 21342
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тамсулозин ретард

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Тамсулозин ретард

Международное непатентованное наименование: тамсулозин

Лекарственная форма: таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

1 таблетка с пролонгированным высвобождением, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид 0,4 мг;

вспомогательные вещества: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), кремния диоксид коллоидный (аэросил), целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат;

вспомогательные вещества для оболочки: готовая смесь для пленочной оболочки желтая [спирт поливиниловый, частично гидролизованный, макрогол 3350, тальк, титана диоксид, краситель железа оксид желтый, краситель железа оксид красный, краситель железа оксид черный].

Описание:

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от желтого до желто-коричневого цвета. На поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

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 гладких мышц предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и улучшению оттока мочи. Одновременно уменьшаются как симптомы опорожнения, так и симптомы наполнения,

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 12.09.2022 № 21342
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

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. Равномерность абсорбции может быть достигнута 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 % тамсулозина выделяется в неизмененном виде.

Период полувыведения препарата (T½) при однократном приеме 0,4 мг после еды составляет 10 часов, при многократном приеме – 13 часов.

Показания к применению

Лечение дизурических расстройств, связанных с доброкачественной гиперплазией предстательной железы (ДГПЖ) у взрослых пациентов.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 12.09.2022 № 21342
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

Противопоказания

– Гиперчувствительность к тамсулозину (в том числе наличие лекарственного ангионевротического отека в анамнезе) или к любому из вспомогательных веществ в составе препарата;

– ортостатическая гипотензия (в т. ч. в анамнезе);

– печеночная недостаточность тяжелой степени;

– возраст до 18 лет.

С осторожностью

– Хроническая почечная недостаточность в терминальной стадии (клиренс креатинина (КК) ниже 10 мл/мин);

– артериальная гипотензия.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Тамсулозин не показан к применению у женщин.

Способ применения и дозы

Внутрь. Принимать после завтрака, запивая водой. Таблетки не рекомендуется разжевывать, так как это может повлиять на скорость высвобождения действующего вещества препарата.

Рекомендованная доза: по 1 таблетке (0,4 мг) препарата Тамсулозин ретард 1 раз в сутки.

Применение в особых клинических группах пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью коррекции дозы тамсулозина не требуется. При применении тамсулозина у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности (клиренс креатинина <10 мл/мин) следует соблюдать меры предосторожности.

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести коррекции дозы тамсулозина не требуется. Применение тамсулозина у пациентов с печеночной недостаточностью тяжелой степени противопоказано.

Пациенты пожилого возраста

Коррекции дозы тамсулозина у пожилых пациентов не требуется.

Дети

У детей и подростков до 18 лет

Тамсулозин не показан к применению у детей и подростков в возрасте до 18 лет.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 12.09.2022 № 21342
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

Побочное действие

Нежелательные реакции, возможные на фоне терапии тамсулозином, распределены по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения согласно рекомендациям ВОЗ: часто (от ≥ 1/100 до < 1/10), нечасто (от ≥ 1/1000 до < 1/100), редко (от ≥ 1/10000 до < 1/1000), очень редко (< 1/10000), частота неизвестна (невозможно определить на основании имеющихся данных).

Нарушения со стороны нервной системы:

часто – головокружение;

нечасто – головная боль;

редко – обморок.

Нарушения со стороны сердца:

нечасто – ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны сосудов:

нечасто – ортостатическая гипотензия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

нечасто – ринит.

Желудочно-кишечные нарушения:

нечасто – запор, диарея, тошнота, рвота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

нечасто – сыпь, зуд, крапивница;

редко – ангионевротический отек;

очень редко – синдром Стивенса – Джонсона;

частота неизвестна – многоформная экссудативная эритема, эксфолиативный дерматит.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

нечасто – нарушения эякуляции;

очень редко – приапизм.

Общие нарушения и реакции в месте введения:

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 нежелательным реакциям, описанным выше, при применении тамсулозина наблюдались фибрилляция предсердий, аритмия, тахикардия и одышка. В связи с тем, что данные были получены методом спонтанных сообщений в период после

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 12.09.2022 № 21342
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

регистрации, определение частоты и причинно-следственной связи этих явлений с приемом тамсулозина представляется затруднительным.

Передозировка

Симптомы: нет сообщений о случаях острой передозировки тамсулозином. Однако теоретически при передозировке возможно развитие острого снижения АД и компенсаторной тахикардии

Лечение**:** **с**имптоматическая терапия. 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 магния 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.

В исследованиях *in vitro* не было выявлено взаимодействия тамсулозина с сальбутамолом и финастеридом.

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

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 12.09.2022 № 21342
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

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 альфа1-адренорецепторов может привести к снижению АД.

При совместном применении тамсулозина с ингибиторами холинэстеразы, алпростадилом, анестетиками, диуретиками, леводопой, миорелаксантами, нитратами, антидепрессантами, бета-адреноблокаторами, блокаторами «медленных» (кальциевых каналов) и этанолом возможен риск выраженного снижения артериального давления.

Особые указания

Как и при использовании других альфа1-адреноблокаторов, при лечении препаратом Тамсулозин 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 положении до тех пор, пока указанные симптомы 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 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.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 12.09.2022 № 21342
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

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.

Так как клинических исследований тамсулозина у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени не проводилось, применение препарата у пациентов с клиренсом креатинина <10 мл/мин требует соблюдения мер предосторожности.

В случае развития ангионевротического отека следует немедленно прекратить терапию препаратом. Повторное назначение тамсулозина противопоказано.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами 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 с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, 0,4 мг, по 10, 14, 15 или 20 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

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

Срок годности

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

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель/ организация, принимающая претензии потребителя

АО «АЛИУМ», Россия.

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

Выпускающий контроль качества

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

Тел.: +7 (495) 646-28-68.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 12.09.2022 № 21342
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0003)

e-mail: info@binnopharmgroup.ru

Владелец регистрационного удостоверения

АО «АЛИУМ», Россия.

142279, Московская обл., г. Серпухов, п. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2

Тел.: +7 (495) 646-28-68.