ЛП-№(001224)-(РГ-RU) от 30.08.2024

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.08.2024 № 18006
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0005)

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

Средства, применяемые в урологии; средства для лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы; альфа-адреноблокаторы.

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

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.08.2024 № 18006
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0005)

мочи. Одновременно уменьшаются как симптомы опорожнения, так и симптомы наполнения, обусловленные повышенным тонусом гладких мышц и детрузорной гиперактивностью при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Способность тамсулозина воздействовать на α_{1A} подтип адренорецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с α_{1B} 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 ($T_{½}$) при однократном приеме 0,4 мг после еды составляет 10 часов, при многократном – 13 часов.

Показания к применению

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

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.08.2024 № 18006
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0005)

Противопоказания

Гиперчувствительность к тамсулозину и/или любому из вспомогательных веществ в составе препарата.

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

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

Печеночная недостаточность тяжелой степени.

Возраст до 18 лет.

С осторожностью

У пациентов с хронической почечной недостаточностью в терминальной стадии (клиренс креатинина ниже 10 мл/мин), артериальная гипотензия, при одновременном применении с сильными ингибиторами и ингибиторами средней активности изофермента CYP3A4.

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. Капсулы не рекомендуется разжевывать, так как это может повлиять на скорость высвобождения действующего вещества препарата.

Рекомендованная доза: по 1 капсуле (0,4 мг) препарата Тамсулозин-OBL 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.

У детей и подростков до 18 лет

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

Побочное действие

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.08.2024 № 18006
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0005)

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

Нарушения со стороны сердца:

нечасто – ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны сосудов:

нечасто – ортостатическая (постуральная) гипотензия.

Желудочно-кишечные нарушения:

нечасто – запор, диарея, тошнота, рвота;

частота неизвестна* – сухость во рту.

Нарушения со стороны нервной системы:

часто – головокружение (1,3 %);

нечасто – головная боль;

редко – обморок.

Нарушения со стороны органа зрения:

частота неизвестна* – нарушение зрения, нечеткость зрения.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

часто – нарушение эякуляции, включая ретроградную эякуляцию и анэякуляцию;

очень редко – приапизм.

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

нечасто – ринит;

частота неизвестна* – носовое кровотечение.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

нечасто – кожная сыпь, кожный зуд, крапивница;

редко – ангионевротический отек;

очень редко – синдром Стивенса – Джонсона;

частота неизвестна* – мультиформная эритема, эксфолиативный дерматит, реакции светочувствительности.

Общие нарушения и реакции в месте введения:

нечасто – астения;

частота неизвестна* – дискомфорт в груди.

* Сообщения, полученные в пострегистрационный период

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.08.2024 № 18006
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0005)

Описаны отдельные случаи интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром «узкого зрачка»), повышающей риск осложнений во время и после операций 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 регистрации, определение частоты и причинно-следственной связи этих явлений с приемом тамсулозина представляется затруднительным.

Дискомфорт в груди может быть вызван или связан с другими заболеваниями, такими как респираторные заболевания или сердечные заболевания.

Передозировка

Симптомы

Нет сообщений о случаях острой передозировки тамсулозина. Однако теоретически при передозировке возможно развитие острого снижения АД и компенсаторной тахикардии.

Лечение

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 магния 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.

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

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.08.2024 № 18006
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0005)

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 сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 может привести к увеличению концентрации тамсулозина. Одновременное назначение с кетоконазолом (сильный 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 ингибиторами средней активности 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.

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 применении 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.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.08.2024 № 18006
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0005)

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.

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.

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 занятиях 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, 6 контурных ячейковых упаковок 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.

Держатель регистрационного удостоверения/ Организация, принимающая претензии от потребителей

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.08.2024 № 18006
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0005)

АО «АЛИУМ», Россия

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

Телефон: +7 (495) 646-28-68.

e-mail: info@binnopharmgroup.ru

Производитель

1. 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.

2. ООО «НИАРМЕДИК ФАРМА», Россия

Калужская обл., г.о. город Обнинск, г. Обнинск, шоссе Киевское, д. 120, к. 4.

Выпускающий контроль качества

Калужская обл., г.о. город Обнинск, г. Обнинск, шоссе Киевское, д. 120, к. 7.