МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ТАМСУЛОЗИН КАНОН

Регистрационный номер: ЛП-004253

Торговое наименование: Тамсулозин Канон

Международное непатентованное наименование: тамсулозин

Лекарственная форма: таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой.

Состав

1 таблетка с пролонгированным высвобождением, покрытая пленочной оболочкой 0,4 мг, содержит:

действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид 0,40 мг;

вспомогательные вещества: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) 71,60 мг, кремния диоксид коллоидный 1,20 мг, лактозы моногидрат 15,40 мг, магния стеарат 2,40 мг, целлюлоза микрокристаллическая 149,00 мг;

пленочная оболочка: Опадрай II желтый 85F32410 7,00 мг, в том числе: поливиниловый спирт 2,800 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) 1,414 мг, тальк 1,036 мг, титана диоксид 1,645 мг, краситель железа оксид желтый 0,105 мг.

Описание

Таблетки круглые двояковыпуклые, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета. На поперечном разрезе – ядро почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: альфа$_1$-адреноблокатор.

Код АТХ: G04CA02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тамсулозин является специфическим конкурентным блокатором постсинаптических α_1-адренорецепторов, особенно α_{1A} и α_{1D} подтипов,

125207

отвечающих за расслабление гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры. Тамсулозин в дозировке 0,4 мг увеличивает максимальную скорость мочеиспускания, а также снижает тонус гладкой мускулатуры предстательной железы и уретры, улучшая отток мочи и, таким образом, уменьшение симптомов опорожнения и наполнения мочевого пузыря. Тамсулозин также уменьшает выраженность симптомов наполнения, в развитии которых важную роль играет гиперактивность детрузора.

При длительной терапии сохраняется воздействие на выраженность симптомов наполнения и опорожнения, уменьшая риск развития острой задержки мочи и необходимость оперативного вмешательства.

Как правило, терапевтический эффект развивается через 2 недели после начала приема препарата, хотя у ряда пациентов уменьшение выраженности симптомов отмечается после приема первой дозы. 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 такой высокой селективности препарат не вызывает какого-либо клинически значимого снижения системного артериального давления (АД) как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальными показателями артериального давления.

При применении тамсулозина в суточной дозе 0,4 мг случаев клинически значимого снижения артериального давления не отмечалось.

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 фармакокинетикой. После однократного приема внутрь натощак 0,4 мг тамсулозина максимальная

125207

концентрация тамсулозина в плазме (C_{max}) достигается в среднем через 6 часов. В равновесном состоянии, которое достигается к 4-му дню приема, концентрация тамсулозина в плазме (C_{ss}) достигает наибольшего значения через 4-6 часов как натощак, так и после приема пищи. Максимальная концентрация в плазме увеличивается примерно от 6 нг/мл после первой дозы до 11 нг/мл в равновесном состоянии. Наименьшая концентрация тамсулозина в плазме составляет 40% от максимальной концентрации в плазме натощак и после приема пищи. Существуют значительные индивидуальные различия среди пациентов в отношении концентрации препарата в плазме после однократной дозы и многократного приема.

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

Метаболизм: тамсулозин не подвергается эффекту "первого прохождения" и медленно биотрансформируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов, сохраняющих высокую селективность к α_{1A}-адренорецепторам. Большая часть тамсулозина представлена в плазме крови в неизмененной форме. Способность тамсулозина индуцировать активность микросомальных ферментов печени практически отсутствует (экспериментальные данные).

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

Период полувыведения препарата ($T_{1/2}$) при однократном приеме 0,4 мг после еды составляет 10 часов, при многократном приеме - 13 часов, конечное время полувыведения - 22 ч.

Показания к применению

Лечение дизурических расстройств при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Противопоказания

125207

- гиперчувствительность к тамсулозину (включая ангионевротический отек) и/или к любому вспомогательному веществу в составе препарата;
- ортостатическая гипотензия (в т. ч. в анамнезе);
- печеночная недостаточность тяжелой степени;
- возраст до 18 лет;
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции.

С осторожностью

Почечная недостаточность тяжелой степени (клиренс креатинина менее 10 мл/мин), артериальная гипотензия, при одновременном применении с мощными и средней активности ингибиторами изофермента CYP3A4.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

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

Способ применения и дозы

Внутрь, по 1 таблетке (0,4 мг) 1 раз в сутки независимо от приема пищи. Длительность применения не ограничена, препарат назначают в виде непрерывной терапии.

Таблетка должна быть принята целиком, ее нельзя разжевывать, так как это может повлиять на скорость высвобождения препарата.

Синдром отмены отсутствует.

Применение препарата в особых клинических группах пациентов

Дети и подростки до 18 лет

Соответствующих показаний для применения препарата у пациентов в возрасте до 18 лет нет. Безопасность и эффективность применения тамсулозина в данной возрастной категории не изучались.

У пациентов с нарушением функции почек

При почечной недостаточности легкой и средней степени тяжести коррекции дозы препарата не требуется. Применение тамсулозина у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (с клиренсом креатинина менее 10 мл/мин)

125207

требует соблюдения мер предосторожности и тщательного медицинского наблюдения.

У пациентов с нарушением функции печени

При печеночной недостаточности легкой и средней степени тяжести коррекции режима дозирования препарата не требуется. Применение тамсулозина при печеночной недостаточности тяжелой степени противопоказано.

Побочное действие

Частота нежелательных реакций, развивающихся при приеме тамсулозина, классифицирована согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто (≥1/10 случаев); часто (≥1/100, <1/10 случаев); нечасто (≥1/1000, <1/100 случаев); редко (≥1/10000, <1/1000 случаев); очень редко (<1/10000 случаев); частота неизвестна – по имеющимся данным установить частоту возникновения не представлялось возможным.

Нарушения со стороны нервной системы:

часто – головокружение;

нечасто – головная боль;

редко – обморок.

Нарушения со стороны органа зрения:

частота неизвестна - интраоперационная нестабильность радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка) при операции по поводу катаракты, глаукомы.

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;

частота неизвестна – носовое кровотечение.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:

нечасто - запор, диарея, тошнота, рвота;

частота неизвестна – сухость во рту.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

нечасто – сыпь, зуд, крапивница;

редко – ангионевротический отек;

очень редко – синдром Стивенса – Джонсона;

частота неизвестна - многоформная эритема, эксфолиативный дерматит.

Нарушения со стороны половых органов и молочной железы:

часто – нарушение эякуляции (включая ретроградную эякуляцию, эякуляционную недостаточность);

очень редко –приапизм.

Общие расстройства и нарушения в месте введения:

нечасто – астения.

В дополнение к нежелательным реакциям, 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.

Если любые из указанных в инструкции нежелательных реакций усугубляются, или Вы заметили любые другие нежелательные реакции, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Нет сообщений о случаях острой передозировки тамсулозином.

Симптомы: снижение АД, компенсаторная тахикардия.

Лечение симптоматическое. АД и частота сердечных сокращений могут восстановиться при принятии больным 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 интенсивно связывается с белками плазмы.

Для предотвращения дальнейшего всасывания препарата целесообразно промывание желудка, прием активированного угля и осмотических слабительных.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При совместном применении тамсулозина с *атенололом, эналаприлом, нифедипином* или *теофиллином* взаимодействий обнаружено не было.

При одновременном применении с *циметидином* отмечено некоторое повышение концентрации тамсулозина в плазме крови, с *фуросемидом* - снижение концентрации, однако, это не требует изменения дозы тамсулозина, 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 *амитриптиллином, сальбутамолом, глибенкламидом* и *финастеридом*. *Диклофенак* и *варфарин* могут увеличивать скорость выведения тамсулозина.

Одновременное применение тамсулозина с *мощными ингибиторами изофермента CYP3A4* может привести к увеличению концентрации тамсулозина. Одновременное применение с *кетоконазолом* (мощный 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 мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 у пациентов с нарушением метаболизма изофермента CYP2D6.

125207

Препарат следует использовать с осторожностью в комбинации с мощными и средней активности ингибиторами изофермента CYP3A4.

Одновременное назначение тамсулозина и *пароксетина,* мощного 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 *блокаторов α_1-адренорецепторов* может привести к гипотензивному эффекту.

Особые указания

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

Прежде чем начать терапию тамсулозином, пациент должен быть обследован с тем, чтобы исключить наличие других заболеваний, которые могут вызывать такие же симптомы, как и доброкачественная гиперплазия простаты. Перед началом лечения и регулярно во время терапии должно выполняться пальцевое ректальное обследование и, если требуется, определение простатического специфического антигена (ПСА).

У некоторых пациентов при оперативных вмешательствах по поводу катаракты или глаукомы на фоне приема препарата возможно развитие синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка), который может привести к осложнениям во время операции или в послеоперационном периоде. Целесообразность отмены терапии тамсулозином за 1-2 недели до операции по поводу катаракты или глаукомы 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

125207

тамсулозином у пациентов, которым запланирована операция по поводу катаракты или глаукомы. Во время предоперационного обследования пациентов хирург и врач-офтальмолог должны учитывать, принимает или принимал ли данный пациент тамсулозин. Это необходимо для подготовки к возможности развития во время операции интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза.

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

Лечение тамсулозином пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) требует осторожности, т.к. исследований у этой категории пациентов не проводилось.

При почечной недостаточности легкой и средней степени тяжести, а также при печеночной недостаточности легкой или средней степени тяжести не требуется коррекция режима дозирования.

Имеются сообщения о случаях развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии альфа-1-адреноблокаторами. В случае сохранения эрекции до 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.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

Влияние применения тамсулозина на способность к управлению транспортными средствами и механизмами не изучалось. Тем не менее, в связи с возможным головокружением, следует воздержаться от управления транспортными средствами и механизмами, а также занятием деятельностью, требующей повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, 0,4 мг.

125207

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной, пленки ПВХ/ПХТФЭ или фольги алюминиевой многослойной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

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

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С во вторичной упаковке (пачке картонной).

Хранить в недоступном для детей месте

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия.

141100, Московская область, г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.

Информация об организациях, в которые могут быть направлены претензии по качеству лекарственного препарата

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия.

141100, Московская область, г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.

Тел.: (495) 797-99-54, факс: (495) 797-96-63.

Электронный адрес: safety@canonpharma.ru

Получить дополнительные данные о препарате, сообщить о нежелательных лекарственных реакциях можно по телефону 8 (800) 700-59-99 (бесплатная линия 24 часа) или на сайте www.canonpharma.ru в разделе «Политика в области качества» - «Безопасность препаратов».

Производитель

ЗАО «Канонфарма продакшн»

Россия, 141100, Московская область, г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.

Тел.: (495) 797-99-54, факс: (495) 797-96-63
www.canonpharma.ru

Директор департамента по регуляторным
вопросам, клиническим исследованиям
и разработкам новых ЛС
ЗАО «Канонфарма продакшн» О.А. Лисакович





125207