МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-005271-201218
УТВЕРЖДЕНО

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тамсулозин

Регистрационный номер:
Торговое наименование: Тамсулозин
Международное непатентованное наименование: тамсулозин
Лекарственная форма: таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой

Состав
Одна таблетка с пролонгированным высвобождением, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид – 0,4 мг;
вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, гипромеллоза 2208, кремния диоксид коллоидный гидрофобный, магния стеарат;
пленочная оболочка: [гипромеллоза 2910, тальк, титана диоксид, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000), краситель железа оксид желтый] или [сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу 2910, тальк, титана диоксид, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000), краситель железа оксид желтый].

Описание
Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета. На поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа
альфа1-адреноблокатор.

Код АТХ
G04CA02

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Тамсулозин является специфическим конкурентным блокатором постсинаптических α_1-адренорецепторов, особенно α_{1A} и α_{1D} подтипов, 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, уменьшает выраженность симптомов опорожнения. Тамсулозин также уменьшает выраженность симптомов наполнения мочевого пузыря, 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.

Блокаторы α_{1A}-адренорецепторов могут снижать артериальное давление (АД) за счет уменьшения периферического сопротивления. При применении тамсулозина в суточной дозе 0,4 мг случаев клинически значимого снижения АД не отмечалось.

Фармакокинетика

Всасывание

Данная лекарственная форма обеспечивает длительное и медленное высвобождение тамсулозина и достаточную экспозицию со слабыми колебаниями концентрации тамсулозина в плазме крови в течение 24 часов.

Тамсулозин всасывается в кишечнике. Абсорбция оценивается в 57 % от введенной дозы. Прием пищи не оказывает влияния на всасываемость тамсулозина. Тамсулозин характеризуется линейной фармакокинетикой. После однократного приема тамсулозина внутрь натощак в дозе 0,4 мг максимальная концентрация тамсулозина в плазме крови (C_{max}) достигается в среднем через 6 часов. В равновесном состоянии, которое достигается к 4-му дню приема тамсулозина, концентрация тамсулозина в плазме крови (C_{ss}) достигает наибольшего значения через 4-6 часов как натощак, так и после приема пищи. Максимальная концентрация в плазме крови увеличивается примерно от 6 нг/мл после первой дозы до 11 нг/мл в равновесном состоянии. Наименьшая концентрация тамсулозина в плазме крови составляет 40 % от максимальной концентрации в плазме крови натощак и после приема пищи. Существуют значительные индивидуальные различия среди пациентов в отношении концентрации тамсулозина в плазме крови после однократной дозы и многократного приема тамсулозина.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови – около 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 неизмененном виде. По экспериментальным данным, способность тамсулозина индуцировать активность микросомальных ферментов печени практически отсутствует.

При печеночной недостаточности не требуется коррекции режима дозирования.

Выведение

Тамсулозин и его метаболиты главным образом выводятся почками, при этом приблизительно 4-6 % тамсулозина выделяется в неизмененном виде.

Период полувыведения тамсулозина ($T_{1/2}$) при однократном приеме 0,4 мг тамсулозина в виде таблеток и в равновесном состоянии составляет 19 и 15 часов, соответственно.

Показания к применению

Доброкачественная гиперплазия предстательной железы (лечение нарушений мочеиспускания).

Противопоказания

- гиперчувствительность к тамсулозину или любому другому компоненту препарата;
- ортостатическая гипотензия;
- тяжелая печеночная недостаточность;
- детский возраст до 18 лет;
- лица женского пола (применяется только у мужчин).

С осторожностью

- хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина ниже 10 мл/мин);
- тяжелая печеночная недостаточность;
- артериальная гипотензия.

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 пролонгированное высвобождение действующего вещества.

Побочное действие

Классификация частоты развития побочных эффектов согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ):

очень часто ≥ 1/10;
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, включая отдельные сообщения;
частота неизвестна – по имеющимся данным установить частоту возникновения не представляется возможным.

Тип нарушения	Частота				
	Часто	Нечасто	Редко	Очень редко	Частота неизвестна
Нарушения со стороны нервной системы	голово-кружение (1,3 %)	головная боль	обморок	-	-
Нарушения со стороны сердца	-	сердцебиение	-	-	-
Нарушения со стороны сосудов	-	ортостати-ческая гипотензия	-	-	-
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения	-	ринит	-	-	-
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	-	запор, диарея, тошнота, рвота	-	-	сухость во рту
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	-	сыпь, зуд, крапивница	ангионев-ротичес-кий отек	синдром Стивенса-Джонсона	многоформная эритема, эксфолиативный отек
Нарушения со стороны половых органов и молочной железы	наруше-ние эякуля-ции	-	-	приапизм	отсутствие семяизвержения
Нарушения со стороны органа зрения	-	-	-	-	нечеткость, ухудшение зрения

Общие нарушения и реакции в месте введения	-	астения	-	-	-

Описаны случаи интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка) при операции по поводу катаракты и глаукомы у пациентов, принимавших тамсулозин.

Пострегистрационное применение препарата

В дополнение к побочным эффектам, 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.

Передозировка

Симптомы

Снижение артериального давления, компенсаторная тахикардия.

Лечение

Симптоматическое. АД и частота сердечных сокращений могут восстановиться при принятии пациентом горизонтального положения. При отсутствии эффекта можно применить средства, увеличивающие объем циркулирующей крови, и, если необходимо, сосудосуживающие средства. Необходимо контролировать функцию почек. Проведение гемодиализа нецелесообразно, так как тамсулозин в значительной степени связывается с белками плазмы крови.

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При применении тамсулозина вместе с атенололом, эналаприлом, нифедипином и теофиллином лекарственного взаимодействия обнаружено не было.

При одновременном применении тамсулозина с циметидином отмечено некоторое повышение концентрации тамсулозина в плазме крови; с фуросемидом – снижение концентрации, однако это не требует коррекции дозы, так как концентрация тамсулозина остается в пределах нормального диапазона.

Диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадинон, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не изменяют свободную фракцию тамсулозина в плазме крови 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 кривой «концентрация-время» (AUC) и максимальной концентрации (C_{max}) тамсулозина в 2,8 и 2,2 раза соответственно. Тамсулозин не следует применять в комбинации с активными ингибиторами изофермента CYP3A4 у пациентов с нарушением метаболизма изофермента CYP2D6. Препарат следует применять с осторожностью в комбинации с сильными и умеренными ингибиторами изофермента CYP3A4. Одновременное применение 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 применение других блокаторов α_1-адренорецепторов может привести к гипотензивному эффекту.

Особые указания
Как и при применении других альфа1-адреноблокаторов, при лечении тамсулозином в отдельных случаях может наблюдаться снижение АД, которое, в редких случаях, 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.
Синдром отмены отсутствует.
У некоторых пациентов, принимающих или ранее принимавших тамсулозин, во время оперативного вмешательства по поводу катаракты и глаукомы отмечалось 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 до сих пор не показана. 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. 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 синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза.
Прежде чем начать терапию тамсулозином, пациент должен быть обследован с тем, чтобы исключить наличие других заболеваний, которые могут вызвать такие же симптомы, как доброкачественная гиперплазия предстательной железы. Перед началом лечения и регулярно во время терапии должно выполняться пальцевое ректальное обследование и, при необходимости, определение простатического специфического антигена (ПСА).
Есть 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.
При почечной недостаточности не требуется изменения дозы.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами
Данные об отрицательном влиянии на способность к управлению транспортными средствами и занятию потенциально опасными видами деятельности отсутствуют. Тем не менее, в связи с возможностью возникновения головокружения, до выяснения индивидуальной реакции пациента, следует воздержаться от занятий, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, в том числе от управления транспортными средствами и механизмами.

Форма выпуска
Таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, 0,4 мг.
10, 15 или 20 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной или поливинилхлоридной/поливинилиденхлоридной и фольги алюминиевой.

30, 60 или 90 таблеток в банке из полиэтилена высокой плотности, укупоренной крышкой натягиваемой с контролем первого вскрытия из полиэтилена высокой плотности.
3, 6 или 9 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток, 2, 4 или 6 контурных ячейковых упаковок по 15 таблеток, 3 контурные ячейковые упаковки по 20 таблеток или одна банка вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.

Условия хранения
Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.
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
АО «ВЕРТЕКС», Россия
Юридический адрес: 197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А.

Производитель
АО «ВЕРТЕКС», Россия
Адрес производства: г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А.
Организация, принимающая претензии потребителей:
АО «ВЕРТЕКС», Россия
199106, г. Санкт-Петербург, Васильевский остров, 24-линия, д. 27, лит. А.
Тел./факс:

Представитель АО «ВЕРТЕКС» С.А. Копатько