МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Омсулозин
наименование лекарственного препарата

Капсулы пролонгированного действия 400 мкг
лекарственная форма, дозировка

Ранбакси Лабораториз Лимитед, Индия
наименование производителя, страна

Изменение № 1

Дата внесения Изменения «____» 120514 20___ г.

Старая редакция	Новая редакция
Фармакологические свойства ***Фармакодинамика*** Омсулозин избирательно и конкурентно блокирует постсинаптические альфа$_{1A}$-адренорецепторы, находящиеся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры, а также α-$_{1D}$–адренорецепторы, находящиеся преимущественно в теле мочевого пузыря. Это приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря, простатической части уретры и улучшению функции детрузора, вследствие чего уменьшаются симптомы обструкции и	**Фармакологические свойства** ***Фармакодинамика*** Омсулозин избирательно и конкурентно блокирует постсинаптические альфа$_{1A}$-адренорецепторы, находящиеся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и предстательной части уретры, а также альфа$_{1D}$-адренорецепторы, находящиеся преимущественно в теле мочевого пузыря. Это приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря, предстательной части уретры и улучшению функции детрузора, вследствие чего уменьшаются симптомы обструкции и раздражения, связанные с доброкачественной гиперплазией предстательной железы. Терапевтический эффект обычно развивается через 2 недели после начала приема препарата, хотя у некоторых пациентов уменьшение

раздражения, связанные с доброкачественной гиперплазией предстательной железы. Терапевтический эффект обычно развивается через 2 недели после начала приема препарата, хотя у некоторых пациентов уменьшение выраженности симптомов отмечается уже после приема первой дозы. Способность тамсулозина воздействовать на альфа$_{1A}$-адренорецепторы в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с альфа$_{1B}$-адренорецепторами, которые расположены в гладких мышцах сосудов. Благодаря такой высокой селективности препарат не вызывает клинически значимого снижения системного артериального давления (АД) как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальным исходным АД.	выраженности симптомов отмечается уже после приема первой дозы. Способность тамсулозина воздействовать на альфа$_{1A}$-адренорецепторы в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с альфа$_{1B}$-адренорецепторами, которые расположены в гладких мышцах сосудов. Благодаря такой высокой селективности препарат не вызывает клинически значимого снижения системного артериального давления (АД) как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальным исходным АД.
Фармакокинетика	***Фармакокинетика***
После приема внутрь тамсулозин быстро и практически полностью абсорбируется в ЖКТ. Биодоступность препарата около 100%. После однократного приема внутрь 0,4 мг максимальная концентрация препарата в плазме достигается через 6 ч. В состоянии	После приема препарата внутрь, натощак в дозе 400 мкг, абсорбция тамсулозина составляет более 90% в желудочно-кишечном тракте (ЖКТ). Биодоступность препарата около 100%. После однократного приема внутрь 0,4 мг максимальная концентрация препарата в плазме достигается через 4-5 часов при приеме натощак, и через 6-7 часов при приеме после еды. Биодоступность препарата увеличивается на 30%, а максимальная концентрация в плазме на 40-70% при приеме натощак, по сравнению с теми же показателями после приема пищи. В состоянии равновесной концентрации (через 5 дней курсового приема) максимальная концентрация тамсулозина в плазме крови на 60-70% выше, чем после однократного приема препарата. Связывание с белками плазмы составляет 94-99%. Объем распределения составляет 0,2 л/кг. Препарат активно метаболизируется изоферментами семейства цитохромов P450 (преимущественно изоферментами CYP3A4 и CYP2D6) в печени, и

равновесной концентрации (через 5 дней курсового приема) максимальная концентрация тамсулозина в плазме крови на 60-70% выше, чем после однократного приема препарата. Связывание с белками плазмы 99%. Объем распределения составляет 0,2 л/кг. Препарат не подвержен "эффекту первого прохождения" и медленно метаболизируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов, обладающих высокой селективностью к альфа$_{1A}$-адренорецепторам. Большая часть тамсулозина присутствует в крови в неизмененном виде. Препарат и его метаболиты выводятся почками, около 9% выделяется в неизмененном виде. Период полувыведения при однократном приеме составляет 10 – 12 часов.

Показания

Лечение функциональных симптомов при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к препарату.

С осторожностью: хроническая почечная недостаточность (снижение клиренса креатинина ниже 10 мл/мин), артериальная гипотензия (в т.ч. ортостатическая), тяжелая

менее чем 10% препарата выводятся с мочой в неизмененном виде. Поэтому ингибирование этих изоферментов (вследствие приема соответствующих препаратов) может привести к повышенной концентрации тамсулозина в плазме крови. Большая часть тамсулозина присутствует в крови в неизмененном виде. Препарат и его метаболиты преимущественно выводятся с мочой (76%), с калом (21%). Период полувыведения препарата при однократном приеме лекарственной формы капсулы пролонгированного действия составляет 14-15 часов.

Показания

Лечение функциональных симптомов при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к тамсулозина гидрохлориду или к любому другому компоненту препарата.
- Тяжелая печеночная недостаточность.
- Ортостатическая гипотензия.
- Детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Тяжелая почечная недостаточность (снижение клиренса креатинина ниже 10 мл/мин), острая печеночная недостаточность.

Способ применения и дозы

Препарат принимают по 1 капсуле (400 мкг) в сутки после приема пищи в одно и то же время, запивая достаточным количеством воды. Капсулу не рекомендуется разжевывать, так как это может оказать влияние на скорость высвобождения тамсулозина.

печеночная недостаточность.

Способ применения и дозы

Препарат принимают по 1 капсуле (400 мкг) в сутки после первого приема пищи, запивая достаточным количеством воды. Капсулу не рекомендуется разжевывать, так как это может оказать влияние на скорость высвобождения тамсулозина.

Побочное действие

Редко - головокружение, головная боль, астения, нарушение сна (сонливость или бессонница), ретроградная эякуляция, снижение либидо, боль в спине, ринит, тошнота, рвота, запор, диарея. В единичных случаях - ортостатическая гипотензия, тахикардия, сердцебиение, боль в грудной клетке. В крайне редких случаях – реакции гиперчувствительности (кожная сыпь, зуд, ангионевротический отек).

Передозировка

Случаев острой передозировки препарата отмечено не было.

Симптомы: возможно возникновение острой гипотензии.

Лечение: кардиотропная терапия. Если симптомы остаются, следует ввести объемозамещающие растворы или сосудосуживающие препараты. Для предотвращения дальнейшего

В случае отсутствия терапевтического эффекта после 2-4 недель приема препарата в дозе 400 мкг, суточная доза Омсулозина может быть увеличена до 800 мкг.

Прерванный курс лечения Омсулозином независимо от суточной дозы (400 или 800 мкг), следует возобновлять с дозы препарата 400 мкг в сутки.

Побочное действие

По частоте побочные эффекты были разделены на следующие категории: очень частые ≥ 1:10; частые ≥ 1:100 и < 1:10; нечастые ≥ 1:1000 и < 1:100; редкие ≥ 1:10000 и < 1:1000; очень редкие < 1:10000.

Нарушения общего состояния: редко – астения, боль в груди, боль в спине; очень редко – зубная боль.

Со стороны нервной системы: часто – головная боль; нечасто – головокружение; редко – обморок, нарушение сна (сонливость или бессонница).

Со стороны органов зрения: очень редко – нечеткость зрительного восприятия; единичные случаи – интраоперационная нестабильность радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка) при операции по поводу катаракты у пациентов, что повышает риск осложнений во время и после операции.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто – ощущение сердцебиения, ортостатическая гипотензия, тахикардия.

Со стороны дыхательной системы: редко – инфекционные заболевания (простудные заболевания, грипп и гриппоподобные симптомы), фарингит, усиление кашля; очень редко – синусит,

всасывания препарата возможно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного. **Взаимодействие с другими лекарственными средствами** При одновременном применении Омсулозина с циметидином отмечено некоторое повышение концентрации тамсулозина в плазме крови, а с фуросемидом - снижение концентрации, однако, это не требует изменения дозы Омсулозина. Диклофенак и варфарин могут несколько увеличить скорость элиминации тамсулозина. Одновременное назначение Омсулозина с другими альфа$_1$-адреноблокаторами может привести к выраженному усилению гипотензивного эффекта. **Особые указания** Омсулозин следует применять с осторожностью у больных с предрасположенностью к ортостатической гипотензии. При первых признаках ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) больного следует усадить или уложить. Перед началом применения препарата необходимо верифицировать диагноз. У больных с нарушением функции	ринит. Со стороны пищеварительной системы: редко – тошнота, рвота, запор, диарея. Со стороны репродуктивной системы: нечасто – нарушение эякуляции; очень редко – снижение либидо, приапизм. Аллергические реакции: нечасто – кожная сыпь, зуд; редко – ангионевротический отек, в т.ч. отек Квинке. **Передозировка** Случаев острой передозировки препарата отмечено не было. *Симптомы*: возможно возникновение ортостатической гипотензии. *Лечение*: кардиотропная терапия. Если симптомы остаются, следует ввести объемозамещающие растворы или сосудосуживающие препараты. Для предотвращения дальнейшего всасывания препарата возможно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного. Для восстановления артериального давления и частоты сердечных сокращений (ЧСС) необходимо перевести пациента в горизонтальное положение. Гемодиализ неэффективен, т.к. тамсулозин активно связывается с белками плазмы. **Взаимодействие с другими лекарственными средствами** Совместное применение препарата с сильными и средними ингибиторами цитохромов Р450 (особенно с изоферментами CYP3A4 и CYP2D6) (кетоконазол, эритромицин, пароксетин, тербинафин и др.) ведет к некоторому увеличение

почек не требуется снижения дозы препарата. В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.	уровня тамсулозина в плазме крови. *In vitro* на уровне печеночного метаболизма взаимодействия с сальбутамолом не обнаружено. При совместном применении альфа$_1$-адреноблокаторов (в том числе тамсулозина) и ингибиторов ФДЭ-5, возможно снижение артериального давления, а так же существует потенциальный риск симптоматической гипотензии, поскольку оба препарата обладают сосудорасширяющим действием. Корректировка дозы не требуется при применении препарата с нифедипином, атенололом, эналаприлом, дигоксином и теофиллином. При одновременном применении с циметидином отмечено некоторое повышение концентрации тамсулозина в плазме крови. Совместное применение с фуросемидом приводит к незначительному снижению всасывания тамсулозина, что не требует коррекции дозы. Существует риск усиления гипотензивного эффекта при совместном употреблении с анестетиками и другими альфа$_1$-адреноблокаторами. Диклофенак и варфарин могут несколько увеличить скорость элиминации тамсулозина. **Особые указания** Препарат не предназначен для лечения артериальной гипертензии. При совместном приеме Омсулозина с альфа$_1$-адреноблокаторами в редких случаях возможно развитие ортостатической гипотензии (постуральная гипотензия, головокружение), ведущей к обмороку. При первых признаках ортостатической гипотензии (головокружение,

	слабость), пациент должен сесть или лечь и оставаться в этом положении до тех пор, пока вышеперечисленные признаки не исчезнут. Перед началом применения Омсулозина необходимо уточнить диагноз и исключить заболевания с аналогичными симптомами. Также пациентам необходимо проходить регулярные обследования (включая определение концентрации специфического простатического антигена (ПСА), если необходимо) и после лечения. 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. Пациентам с легкой или умеренной степенью нарушения функции печени, а также пациентам с почечной недостаточностью корректировка дозы не требуется. У пациентов пожилого возраста возможна повышенная чувствительность к действию препарата. Перед приемом препарата пациент должен быть уведомлен о возможности возникновения приапизма, поскольку это состояние может привести к импотенции без должного лечения. **Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами** В период лечения препаратом необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и другими потенциально опасными видами деятельности,

	требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, т.к. препарат может вызвать головокружение и другие побочные эффекты, которые могут влиять на указанные способности.

Зам. руководителя отдела регистрации ЛС
Тел.: (495)234-56-11 (доб. 2214)

Свидетельство о государственной регистрации юридического лица Г.Р. № 1037739... Москва
Представительство компании "РАНБАКСИ ЛАБОРАТОРИЗ ЛИМИТЕД" (ИНДИЯ)

Н.Г. Гордеева

Исполнитель:
Медицинский советник
Тел.: (495)234-56-11 (доб. 2242)

А.В. Оберемков

МЗ РФ
ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ
ЯВЛЯЕТСЯ ОБРАЗЦОМ ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА
0 0 0 0 0 0 0 0 0 5
НЦЭСМП