

## **Состав**

*действующее вещество:* tamsulosin hydrochloride;

1 капсула содержит гидрохлорида тамсулозина 0,400 мг;

*вспомогательные вещества:*

*ядро гранул:* целлюлоза микрокристаллическая, метакрилатный сополимер (тип А) дисперсия 30% (содержащий полисорбат 80 и лаурилсульфат натрия), триэтилцитрат, тальк;

*оболочка гранул:* метакрилатный сополимер (тип А) дисперсия 30% (содержащий полисорбат 80 и лаурилсульфат натрия), триэтилцитрат, тальк;

*капсулы (состав корпуса):* железа оксид красный (Е 172), титана диоксид (Е 171), железа оксид желтый (Е 172), желатин;

*капсулы (состав крышки):* индигокармин – FD&C синий № 2 (Е 132), железа оксид черный (Е 172), титана диоксид (Е 171), железа оксид желтый (Е 172), желатин.

## **Лекарственная форма**

Капсулы жесткие с модифицированным высвобождением.

*Основные физико-химические свойства:* жесткая желатиновая капсула с корпусом оранжевого и крышкой оливкового цвета; капсула наполнена гранулами белого или почти белого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Средства, применяемые для лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Антагонисты  $\alpha_1$ -адренорецепторов. Код АТХ G04C A02.

## **Фармакодинамика**

### Механизм действия

Тамсулозин избирательно и конкурентно связывается с постсинаптическими  $\alpha_1A$ -адренорецепторами, в частности с адренорецепторами подтипов  $\alpha_1A$  и  $\alpha_1D$ . Это приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы и мочевыводящего канала.

## Фармакодинамические эффекты

Тамсулозин увеличивает максимальную объемную скорость мочеиспускания. Расслабляя гладкие мышцы предстательной железы и мочевыводящего канала, он уменьшает обструкцию мочевыводящих путей и тем самым облегчает мочеиспускание.

Он также улучшает резервуарную функцию, часто нарушенную из-за нестабильности мочевого пузыря.

Эти эффекты в отношении резервуарной функции и функции мочеиспускания сохраняются при длительном лечении. Тем самым он существенно уменьшает необходимость хирургического вмешательства или катетеризации.

Антагонисты  $\alpha 1$ -адренорецепторов могут снижать АД за счет снижения периферического сопротивления сосудов. В исследованиях тамсулозина клинически значимого снижения АД не наблюдалось.

## **Фармакокинетика**

### Всасывание.

Тамсулозин всасывается в кишечнике и почти полностью доступен. В случае применения тамсулозина сразу после еды его всасывание уменьшается. Чтобы тамсулозин все время всасывался примерно одинаково, его нужно применять в одно и то же время после еды. Тамсулозин имеет линейную кинетику.

После приема разовой дозы тамсулозина на полный желудок максимальная концентрация в плазме крови достигается примерно через 6 часов, а в равновесном состоянии, наступающем на 5-й день лечения, значение  $C_{max}$  примерно на две трети превышает значение  $C_{max}$  после применения разовой дозы.

### Распределение.

У мужчин тамсулозин связывается с белками плазмы крови примерно на 99%. Объем распределения незначителен (приблизительно 0,2 л/кг).

### Биотрансформация.

При первом прохождении через печень тамсулозин метаболизируется медленно. В плазме крови тамсулозин присутствует главным образом в виде неизмененного действующего вещества. Тамсулозин метаболизируется в печени.

У крыс почти никакая индукция микросомальных ферментов печени не была вызвана тамсулозином.

Ни один из метаболитов тамсулозина не имеет более высокой активности, чем исходное соединение.

### Выведение.

Тамсулозин и его метаболиты выводятся главным образом с мочой, при этом примерно 9% от применяемой дозы выводится в форме неизмененного действующего вещества. После однократного применения тамсулозина на полный желудок период полувыведения составляет примерно 10 часов, а после достижения равновесного состояния – примерно 13 часов.

### **Показания**

Лечение функциональных расстройств со стороны нижних мочевыводящих путей при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

### **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к действующему веществу, включая медикаментозно-индуцированный ангионабряк, или к любому из вспомогательных веществ лекарственного средства; наличие в анамнезе ортостатической гипотензии; тяжелая печеночная недостаточность.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Исследования взаимодействия тамсулозина с другими лекарственными средствами проводились только у взрослых.

При одновременном применении гидрохлорида тамсулозина с ателололом, эналаприлом или теофиллином лекарственного взаимодействия не отмечалось.

Одновременное применение с циметидином повышает, а с фуросемидом снижает концентрацию тамсулозина в плазме крови, но поскольку эти уровни остаются в пределах нормы, в специальной коррекции дозировки тамсулозина нет необходимости.

В исследованиях *in vitro* диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадион, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не влияют на свободную фракцию тамсулозина в плазме крови человека. Аналогично тамсулозин не изменяет уровень свободных фракций диазепамы, пропанолаола,

трихлорметиазида и хлормадинона в плазме крови человека. Однако диклофенак и варфарин могут повышать скорость выведения тамсулозина.

Одновременное применение с сильными ингибиторами CYP3A4 может привести к увеличению эффекта гидрохлорида тамсулозина. При одновременном применении с кетоконазолом (известный сильный ингибитор CYP3A4) индуцируется увеличение показателей AUC и C<sub>max</sub> гидрохлорида тамсулозина с коэффициентом 2,8 и 2,2 соответственно.

Тамсулозина гидрохлорид не следует применять в комбинации с сильными ингибиторами CYP3A4 пациентам с фенотипом, для которого характерен низкий уровень метаболизма CYP2D6.

Тамсулозина гидрохлорид следует применять с осторожностью в сочетании с сильными и умеренными ингибиторами CYP3A4.

При одновременном применении с пароксетином, сильным ингибитором CYP2D6, возрастают показатели C<sub>max</sub> и AUC тамсулозина в 1,3 и 1,6 раза соответственно, но это увеличение не считается клинически значимым.

Одновременное применение тамсулозина с другими α<sub>1</sub>-адреноблокаторами может привести к гипотензивному эффекту.

### **Особенности применения**

Как и другие антагонисты α<sub>1</sub>-адренорецепторов, тамсулозин может вызвать в отдельных случаях снижение АД, что иногда может привести к потере сознания. При первых признаках ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) пациенту необходимо сесть или лечь до исчезновения симптомов.

Лечению тамсулозином должно предшествовать обследование больного с целью исключения любого другого заболевания, протекающего с жалобами, похожими на такие, как при доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Ректальное пальцевое обследование простаты и, если необходимо, измерение уровня специфического антигена простаты (PSA) следует провести перед лечением и через регулярные промежутки времени во время лечения.

Лечение пациентов с тяжелой формой почечной недостаточности (клиренс креатинина < 10 мл/мин) требует особой осторожности, поскольку исследования с участием таких пациентов не проводились.

Во время хирургической операции по поводу катаракты и глаукомы у некоторых пациентов, принимающих или принимавших тамсулозин, наблюдался интраоперационный синдром атонической радужки (ИСАР, вариант синдрома

узких зрачков). Исар может усугублять процедурные осложнения во время и после операции.

В отдельных случаях следует прекратить применение тамсулозина за 1-2 недели до проведения операции по катаракте и глаукоме, однако целесообразность прекращения лечения тамсулозином до сих пор полностью не установлена. Также сообщали об ИСАР у пациентов, прекративших применение тамсулозина задолго до операции по поводу катаракты.

Пациентам, которые готовятся к хирургической операции по поводу катаракты и глаукомы, терапию тамсулозином не рекомендуется.

Чтобы избежать ИСАР, что может возникнуть во время операции по поводу катаракты и глаукомы, хирурги и офтальмологи должны еще в процессе предоперационной оценки выяснить, не применял ли пациент к операции тамсулозин или продолжает ли он применять это лекарственное средство.

Тамсулозин не следует применять в сочетании с сильными ингибиторами CYP3A4 пациентам с фенотипом, для которого характерен низкий уровень метаболизма CYP2D6.

Тамсулозин следует применять с осторожностью в комбинации с сильными и умеренными ингибиторами CYP3A4 (см. Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий).

Зафиксированы случаи аллергических реакций на тамсулозин у пациентов с наличием в анамнезе аллергии на сульфаниламиды. Следует соблюдать осторожность при применении гидрохлорида тамсулозина у пациентов, у которых ранее отмечалась аллергия на сульфаниламиды.

### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

Исследования влияния тамсулозина на способность управлять автотранспортом или работать с другими механизмами не проводились. Однако пациентам следует учитывать, что в результате применения этого лекарственного средства может возникать головокружение.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

Тамсулозин не показан для применения у женщин.

Во время клинических исследований тамсулозин в течение короткого и длительного времени отмечались нарушения эякуляции. Случаи нарушения

эякуляции, ретроградной эякуляции и недостаточной эякуляции отмечались в послерегистрационном периоде.

## **Способ применения и дозы**

Одна капсула ежедневно, которую принимают после завтрака или первого еды за день.

Капсулу следует глотать целиком, ее нельзя измельчать или жевать, поскольку это препятствует модифицированному высвобождению активного вещества.

Никакой корректировки дозы не требуется при нарушении функции почек. У пациентов с легким и средним печеночным недостаточным изменением дозы не требуется (см. также раздел «Противопоказания»).

## **Дети**

Нет соответствующих показаний для применения тамсулозина у детей.

Безопасность и эффективность применения тамсулозина у детей младше 18 лет не установлена.

## **Передозировка**

### *Симптомы.*

Передозировка тамсулозином гидрохлоридом может вызвать тяжелое гипотензивное действие. Тяжелое гипотензивное действие отмечалось при разных степенях передозировки.

### *Лечение.*

В случае внезапного снижения АД вследствие передозировки следует проводить поддерживающую терапию, направленную на восстановление нормальной функции сердечно-сосудистой системы. Для нормализации АД и частоты сердечных сокращений пациента следует положить в горизонтальное положение. Если эта мера не помогает, рекомендуется использовать плазмозаменители и, при необходимости, сосудосуживающие лекарственные средства. Следует контролировать функцию почек и проводить поддерживающую терапию. Проведение гемодиализа вряд ли целесообразно, поскольку тамсулозин в значительной степени связывается с белками плазмы крови.

Помогут меры, направленные на предотвращение всасывания, например, вызывание рвоты. При значительной передозировке необходимо провести

промывание желудка, а также использовать активированный уголь и осмотическое слабительное средство, например сульфат натрия.

### Побочные реакции

Класс/системы органов	Часто ( $\geq 1/100$ , $< 1/10$ )	Нечасто ( $\geq 1/1000$ , $< 1/100$ )	Редко ( $\geq 1/10000$ , $< 1/1000$ )	Очень редко ( $\geq 1/10000$ )	Н (н о и)
Со стороны нервной системы	головокружение (1,3 %)	головная боль	обморок		
Со стороны органов зрения					зат. зре нар зре
Со стороны сердца		ощущение сердцебиения			
Со стороны сосудов		ортостатическая гипотензия			
Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения		ринит			нос кро
Со стороны желудочно-кишечного тракта		запор, диарея, тошнота, рвота			сух
Со стороны кожи и подкожных тканей		сыпь, зуд, крапивница	ангио отек	синдром Стивенса-Джонсона	мул. эри экс дер

Со стороны репродуктивных органов и молочных желез	расстройства эякуляции, включая ретроградную эякуляцию и недостаточность эякуляции			приапизм	
Общие нарушения и нарушения в месте применения		астения			

\*- отмечались в послерегистрационном периоде.

Во время послерегистрационного наблюдения описаны случаи интраоперационного синдрома атонической радужной оболочки глаза (ИСАР) при операции по поводу катаракты и глаукомы у пациентов, принимавших тамсулозин (см. «Особенности применения»).

Послерегистрационный опыт. Кроме вышеуказанных побочных реакций сообщали о случаях фибрилляции предсердий, аритмии, тахикардии и одышки при применении тамсулозин. Поскольку мировой послерегистрационный опыт является источником выше спонтанных случаев, частота сообщений и роль тамсулозина в этих случаях не могут быть достоверно установлены.

#### Сообщения о подозреваемых побочных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых побочных реакциях после регистрации лекарственного средства. Это позволяет проводить постоянный мониторинг соотношения польза/риск лекарственного средства. К работникам здравоохранения обращаются с просьбой сообщать о любых подозреваемых побочных реакциях.

#### **Срок годности**

3 года.

Не применять препарат по истечении срока годности.

#### **Условия хранения**

Специальных условий хранения не требуется. Хранить в оригинальной упаковке.

**Упаковка**

По 10 капсул в блистере; по 3 блистера в картонной коробке.

**Категория отпуска**

По рецепту.

**Производитель**

Менарини-фон Хейден ГмбХ/Menarini-Von Heyden GmbH.

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Лейпциггер штрассе 7-13, 01097 Дрезден, Германия./Leipziger Strasse 7-13, 01097 Dresden, Germany.

**Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).