

## **Состав**

*действующее вещество:* тамсулозина гидрохлорид;

1 капсула содержит тамсулозина гидрохлорида 0,4 мг;

*вспомогательные вещества:* целлюлоза микрокристаллическая, дисперсия 30 % метакрилатной кислоты – этилакрилатного сополимера (1:1), содержащего полисорбат 80 (около 2,8 %) и натрия лаурилсульфат (около 0,7 %), триэтилцитрат, тальк;

покрытие пеллет: дисперсия 30 % метакрилатной кислоты – этилакрилатного сополимера (1:1), содержащего полисорбат 80 (около 2,8 %) и натрия лаурилсульфат (около 0,7 %), тальк, триэтилцитрат;

состав капсул: железа оксид красный (E 172), титана диоксид (E 171), железа оксид желтый (E 172), желатин, индигокармин (E 132), железа оксид черный (E 172).

## **Лекарственная форма**

Капсулы с модифицированным высвобождением.

*Основные физико-химические свойства:* твердые желатиновые капсулы с корпусом оранжевого цвета и крышечкой оливкового цвета. В капсуле содержатся пеллеты белого или почти белого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Средства, применяемые при доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Антагонисты альфа1-адренорецепторов. Код АТХ G04C A02.

## **Фармакодинамика**

Механизм действия тамсулозина обусловлен селективным конкурентным связыванием с постсинаптическими  $\alpha 1$ -адренорецепторами, в частности с подтипами  $\alpha 1A$  и  $\alpha 1D$ , что приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря, простатической части уретры и улучшению выделения мочи.

Одновременно уменьшаются симптомы обструкции и раздражения, связанные с доброкачественной гиперплазией предстательной железы. Антагонисты  $\alpha 1$ -адренорецепторов имеют способность снижать артериальное давление путем

снижения периферического тонуса сосудов. Во время проведения испытаний действующего вещества тамсулозина гидрохлорида не отмечалось клинически выраженного снижения артериального давления. Препарат не вызывает клинически значимого снижения системного артериального давления у пациентов с нормальным исходным артериальным давлением.

Терапевтический эффект обычно развивается через 2 недели после начала приема препарата, хотя уменьшение симптомов заболевания возможно после приема первых доз.

## **Фармакокинетика**

Абсорбция. Тамсулозин быстро и почти полностью всасывается из кишечника. Всасывание замедляется, если препарат применяли после еды. Равномерного высвобождения действующего вещества можно достичь, если принимать тамсулозин в одно и то же время после приема пищи. Тамсулозину свойственна линейная кинетика. Пиковые уровни в плазме крови достигаются примерно через 6 часов после однократной дозы тамсулозина, принятой после еды. Стабильная концентрация достигается на 5 сутки после ежедневного приема препарата, при этом максимальная концентрация в плазме крови на 2/3 выше, чем после приема разовой дозы. Хотя эти данные касаются только пациентов пожилого возраста, можно ожидать аналогичный результат у пациентов младшего возраста.

Уровни тамсулозина в плазме крови у разных пациентов могут существенно отличаться как после разовой дозы, так и после многократного применения.

Распределение. Связывание с белками плазмы крови – 99 %. Объем распределения незначителен (примерно 0,2 л/кг).

Метаболизм. Тамсулозин не поддается эффекту первого прохождения и медленно метаболизируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов, сохраняющих высокую селективность к  $\alpha_1$ -адренорецепторам. Большая часть активного вещества присутствует в крови в неизменном виде.

Выведение. Тамсулозин и его метаболиты выводятся главным образом с мочой, причем примерно 9 % дозы выводится в неизменном виде.

После однократного приема дозы тамсулозина после еды и при стабильной концентрации в плазме крови периоды полувыведения составляют примерно 10 и 13 часов.

## Показания

Лечение функциональных нарушений со стороны нижних мочевыводящих путей при доброкачественной гиперплазии простаты.

## Противопоказания

- Гиперчувствительность к тамсулозину гидрохлориду, включая лекарственно-индуцированный ангионевротический отек, или к любой из вспомогательных веществ;
- ортостатическая гипотензия в анамнезе
- тяжелая печеночная недостаточность.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследование взаимодействия проводилось только у взрослых.

При одновременном применении тамсулозину гидрохлорида с *атенололом*, *эналаприлом*, *нифедипином*, *дигоксином* или *теофиллином* лекарственного взаимодействия не отмечалось. Одновременное применение с *циметидином* повышает, а с *фуросемидом* – снижает концентрацию тамсулозину в плазме крови, но поскольку эти уровни остаются в пределах нормы, в специальной коррекции дозирования тамсулозину нет необходимости.

В исследованиях *in vitro* *диазепам*, *пропранолол*, *трихлорметиазид*, *хлормадинон*, *амитриптилин*, *диклофенак*, *глибенкламид*, *симвастатин* и *варфарин* не влияли на свободную фракцию тамсулозину в плазме крови человека. Подобным образом тамсулозин не изменял уровень свободных фракций *диазепама*, *пропранолола*, *трихлорметиазида* и *хлормадинона* в плазме крови человека. Однако *диклофенак* и *варфарин* могут ускорять элиминацию тамсулозину из плазмы крови.

Одновременное применение с *сильными ингибиторами CYP3A4* может привести к увеличению влияния тамсулозину гидрохлорида. Применение с *кетоназолом* (известным сильным ингибитором CYP3A4) приводит к увеличению AUC и  $C_{\max}$  тамсулозину гидрохлорида в 2,8 и 2,2 раза соответственно.

Тамсулозину гидрохлорид следует применять с осторожностью в комбинации с сильными (например, *кетоназолом*, *итраконазолом*, *вориконазолом*, *klarитромицином*, *индинавиром*, *нелфинавиром*, *ритонавиром*, *саквинавиром*) и умеренными (например, *эритромицином*) ингибиторами CYP3A4. А пациентам

с низким метаболизмом CYP2D6 тамсулозина гидрохлорид не следует назначать в сочетании с *сильными ингибиторами CYP3A4*.

Одновременное применение с *пароксетином* (сильный ингибитор CYP2D6) приводит к увеличению концентрации  $C_{\max}$  и AUC тамсулозина в 1,3 и 1,6 раза соответственно, но это повышение не считается клинически значимым.

Существует риск усиления гипотензивного эффекта при применении тамсулозина одновременно с препаратами, которые могут снижать кровяное давление, в т.ч. *анестетиками, ингибиторами фосфодиэстеразы-5, другими  $\alpha_1$ -адреноблокаторами*.

Исследования *in vitro* с микросомальными фракциями печени не показали взаимодействия с *амитриптилином, сальбутамолом, глибенкламидом и финастеридом*.

### **Особенности применения**

Как и при применении других  $\alpha_1$ -адреноблокаторов, в отдельных случаях при применении Тамсулида возможно снижение артериального давления, что может иногда привести к потере сознания. При появлении первых признаков ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) пациент должен принять горизонтальное положение до исчезновения вышеуказанных симптомов.

Перед тем как начать лечение препаратом Тамсулид, следует пройти медицинское обследование с целью выявления других сопутствующих заболеваний, которые могут вызвать такие же симптомы, как доброкачественная гиперплазия предстательной железы. Перед началом лечения необходимо провести ректальное обследование предстательной железы и при необходимости до начала и регулярно во время лечения контролировать уровень специфического антигена предстательной железы (PSA).

Необходимо с особой осторожностью назначать препарат пациентам с тяжелой формой почечной недостаточности (клиренс креатинина < 10 мл/мин) из-за отсутствия достаточного клинического опыта.

Изредка сообщалось о развитии ангионевротического отека после применения тамсулозина. В таком случае лечение следует немедленно прекратить и контролировать состояние пациента до исчезновения отека, тамсулозин не следует повторно принимать.

У некоторых пациентов, которые принимали или принимают тамсулозин, во время хирургического вмешательства по поводу удаления катаракты и глаукомы

отмечалась нестабильность радужной оболочки глаза (синдром атонического зрачка (IFIS), вариант синдрома суженного зрачка), связанная с блокировкой  $\alpha 1$ -рецепторов. IFIS увеличивает риск развития глазных осложнений во время или после такой операции.

Как правило, за 1-2 недели перед проведением операции по поводу катаракты и глаукомы рекомендуется прекратить лечение тамсулозином, однако польза, целесообразность и сроки прекращения лечения тамсулозином на сегодня точно не установлены. Об IFIS сообщалось также и у пациентов, которые прекратили применение тамсулозина в течение более длительного времени до начала операции.

Начинать терапию тамсулозином гидрохлоридом не рекомендуется пациентам, которым запланирована операция по поводу катаракты или глаукомы. При подготовке к операции хирурги-офтальмологи должны узнать, принимал ли (или принимает) пациент тамсулозин с целью предупреждения возможных осложнений, связанных с IFIS.

Тамсулозин интенсивно метаболизируется, главным образом, CYP3A4 и CYP2D6. Пациентам с низким метаболизмом CYP2D6 не следует назначать тамсулозина гидрохлорид в сочетании с сильными ингибиторами CYP3A4 (например, кетоконазолом).

Тамсулозина гидрохлорид следует применять с осторожностью в сочетании с сильными (например, кетоконазолом) и умеренными ингибиторами CYP3A4 (например, эритромицином) (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

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

Препарат следует принимать по назначению врача.

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

Исследования влияния препарата на способность управлять автотранспортными средствами или другими механизмами не проводились. Однако пациентов необходимо предупредить о возможности возникновения головокружения.

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

Тамсулид не показан для применения женщинам.

*Фертильность.* Во время клинических исследований тамсулозина в течение короткого и длительного времени отмечались нарушения эякуляции. Случаи нарушения эякуляции, ретроградной эякуляции и недостаточной эякуляции отмечались в послерегистрационный период применения тамсулозина.

### **Способ применения и дозы**

Рекомендуемая доза для взрослых – 1 капсула ежедневно, после завтрака или после первого приема еды. Капсулу следует глотать целой, сидя или стоя. Капсулу нельзя разжевывать, разламывать, поскольку это будет препятствовать модифицированному высвобождению активного ингредиента.

*Пациенты пожилого возраста* не требуют коррекции дозы. Однако следует иметь в виду, что у гериатрических пациентов риск ортостатической гипотензии увеличен.

*Пациентам с почечной недостаточностью* не требуется коррекция дозы.

*Пациентам с печеночной недостаточностью* умеренной и средней степени тяжести не требуется коррекция дозы (см. также «Противопоказания»).

### **Дети**

Препарат не применять детям. Безопасность и эффективность тамсулозина у детей (до 18 лет) не оценивалась.

### **Передозировка**

*Симптомы.* Передозировка тамсулозина гидрохлорида может вызвать острые и тяжелые гипотензивные эффекты, а также рвоту и понос. Тяжелые гипотензивные эффекты наблюдались при различных степенях передозировки.

*Лечение.* В случае возникновения острой артериальной гипотензии вследствие передозировки следует проводить поддерживающую терапию, направленную на восстановление нормальной функции сердечно-сосудистой системы (например, пациент должен принять горизонтальное положение). Если это не помогает, следует провести инфузионную терапию и назначить вазопрессорные средства. Следует контролировать функцию почек и проводить общие поддерживающие мероприятия. Из-за высокой степени связывания тамсулозина с белками плазмы крови проведение гемодиализа вряд ли целесообразно.

С целью прекращения дальнейшего всасывания препарата можно искусственно вызвать рвоту. При передозировке значительным количеством препарата пациенту следует промыть желудок, можно применить активированный уголь и низкоосмотические слабительные средства, такие как сульфат натрия.

## **Побочные реакции**

Побочные реакции классифицированы по органам и системам и частоте возникновения: часто ( $> 1/100$ ,  $< 1/10$ ); нечасто ( $> 1/1000$ ,  $< 1/100$ ); редко ( $> 1/10000$ ,  $< 1/1000$ ); очень редко ( $< 1/10000$ ), неизвестно (невозможно оценить по доступным данным).

*Нервная система:* часто – головокружение, нечасто – головная боль, редко – обморок (синкопе).

*Органы зрения:* редко – затуманивание зрения\*, нарушение зрения\*.

*Сердечно-сосудистая система:* нечасто – ортостатическая гипотензия, ощущение сердцебиения (пальпитация).

*Дыхательная система:* нечасто – ринит, неизвестно – носовое кровотечение\*.

*Репродуктивная система:* часто – расстройства эякуляции, включая ретроградную эякуляцию и недостаточность эякуляции, очень редко – приапизм.

*Пищеварительный тракт:* нечасто – запор, диарея, тошнота, рвота, неизвестно – сухость во рту.

*Кожа, подкожная клетчатка:* нечасто – зуд, высыпания, крапивница, редко – ангионевротический отек, очень редко – синдром Стивенса-Джонсона, неизвестно – мультиформная эритема\*, эксфолиативный дерматит\*.

*Общие расстройства:* нечасто – астения.

\*Отмечались в послегистрационный период применения тамсулозина.

Кроме вышеупомянутых побочных реакций в послегистрационный период поступали спонтанные сообщения о случаях атриальной фибрилляции, тахикардии, аритмии, диспноэ. Поскольку об указанных случаях сообщалось спонтанно, частота реакций и их связь с тамсулозином не могут быть достоверно определены.

Как и при приеме других альфа-блокаторов, может наблюдаться сонливость, сухость во рту, отеки.

Описаны случаи интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (вариант синдрома узкого зрачка, известный как IFIS) во время операции по поводу катаракты и глаукомы у пациентов, длительное время принимавших тамсулозин.

### **Срок годности**

3 года.

Не применять после окончания срока годности, указанного на упаковке.

### **Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 10 капсул в блистере; по 3 блистера в пачке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

ПАО «Научно-производственный центр «Борщаговский химико-фармацевтический завод».

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

Украина, 03134, г. Киев, ул. Мира, 17.

### **Источник инструкции**

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