

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ  
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

**Тамсулозин-ВЕРТЕКС**

**Регистрационный номер:** ЛП-002820

**Торговое наименование:** Тамсулозин-ВЕРТЕКС

**Международное непатентованное наименование:** тамсулозин

**Лекарственная форма:** капсулы с пролонгированным высвобождением

**Состав**

Одна капсула с пролонгированным высвобождением содержит:

Тамсулозина гидрохлорид субстанция-пеллеты 0,2 % – 200,0 мг [*действующее вещество:* тамсулозина гидрохлорид – 0,4 мг; *вспомогательные вещества:* сахарные сферы (сахароза – 99 %, гипромеллоза – 1 %) – 190,0 мг, метакриловой кислоты сополимер – 4,8 мг, этилцеллюлоза – 4,0 мг, полиэтиленгликоль – 0,8 мг].

*Капсулы твердые желатиновые:* титана диоксид – 1,0 %, железа оксид желтый (железа оксид) – 0,27 %, краситель синий патентованный – 0,015 %, желатин – до 100 %.

**Описание**

Капсулы твердые желатиновые № 3 зеленого цвета. Содержимое капсул – пеллеты белого или почти белого цвета.

**Фармакотерапевтическая группа**

$\alpha_1$ -адреноблокатор.

**Код АТХ**

G04CA02

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Тамсулозин является специфическим блокатором постсинаптических  $\alpha_1$ -адренорецепторов, находящихся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры. Блокада  $\alpha_1$ -адренорецепторов тамсулозином приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и улучшению оттока мочи. Одновременно уменьшается выраженность симптомов наполнения и опорожнения, обусловленных повышенным тонусом гладкой мускулатуры и детрузорной гиперактивностью при доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Способность тамсулозина воздействовать на  $\alpha_{1A}$  подтип адренорецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с  $\alpha_{1B}$  подтипом адренорецепторов, которые расположены в гладких мышцах сосудов. Благодаря своей высокой селективности тамсулозин не вызывает клинически значимого снижения системного артериального давления (АД) как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальным исходным АД.

## **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 кинетикой. После однократного приема препарата внутрь в дозе 0,4 мг его максимальная концентрация в плазме крови достигается через 6 часов. После многократного приема внутрь препарата в суточной дозе 0,4 мг равновесная концентрация достигается к 5-му дню, при этом ее значение на 2/3 выше значения этого параметра после однократного приема препарата.

### *Распределение*

Связывание с белками плазмы крови – 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 неизменной форме.

В экспериментальных исследованиях выявлена способность тамсулозина незначительно индуцировать активность микросомальных ферментов печени. При незначительной и умеренной степени печеночной недостаточности не требуется коррекции режима дозирования.

### *Выведение*

Тамсулозин и его метаболиты выводятся в основном почками, при этом приблизительно 9 % дозы препарата выделяется в неизменном виде.

Период полувыведения при однократном приеме 0,4 мг тамсулозина после еды составляет 10 часов, после многократного приема – 13 часов.

При почечной недостаточности не требуется снижения дозы. При наличии у пациента тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) назначение тамсулозина необходимо проводить с осторожностью.

## **Показания к применению**

Лечение дизурических расстройств при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

## **Противопоказания**

- повышенная чувствительность к тамсулозину или другим компонентам препарата;
- ортостатическая гипотензия (в т.ч. в анамнезе);
- выраженная печеночная недостаточность;
- глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- дефицит сахаразы/изомальтазы;
- непереносимость фруктозы;
- детский возраст до 18 лет.

## **С осторожностью**

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

## **Применение при беременности и в период грудного вскармливания**

Препарат предназначен для применения только у лиц мужского пола.

## **Способ применения и дозы**

Внутрь.

Капсулы тамсулозина следует принимать после завтрака, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды. Препарат принимают по 1 капсуле (0,4 мг) 1 раз в сутки.

*Пациенты с нарушением функции печени и почек*

При почечной недостаточности, а также при легкой и умеренной печеночной недостаточности не требуется коррекции режима дозирования.

## **Побочное действие**

Частота развития побочных эффектов классифицирована согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения:

очень часто  $\geq 1/10$ ;

часто от  $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ;

нечасто от  $\geq 1/1000$  до  $< 1/100$ ;

редко от  $\geq 1/10000$  до  $< 1/1000$ ;

очень редко  $< 1/10000$ , включая отдельные сообщения;

частота неизвестна – по имеющимся данным установить частоту возникновения не представляется возможным.

*Нарушения со стороны нервной системы:*

часто – головокружение;

нечасто – головная боль;

редко – обморок.

*Нарушения со стороны сердца:*

нечасто – ощущение сердцебиения;

частота неизвестна – фибрилляция предсердий, аритмия, тахикардия, одышка.

*Нарушения со стороны сосудов:*

нечасто – ортостатическая гипотензия.

*Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:*

нечасто – ринит.

*Желудочно-кишечные нарушения:*

нечасто – запор, диарея, тошнота, рвота.

*Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:*

нечасто – кожная сыпь, кожный зуд, крапивница;

редко – ангионевротический отек;

очень редко – синдром Стивенса-Джонсона;

частота неизвестна – мультиформная эритема, эксфолиативный дерматит.

*Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез:*

часто – нарушения эякуляции;

очень редко – приапизм.

*Общие нарушения и реакции в месте введения:*

нечасто – астения;

частота неизвестна – интраоперационная нестабильность радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка) во время операции по поводу катаракты и глаукомы, носовое кровотечение.

## **Передозировка**

Нет сообщений о случаях острой передозировки препарата.

*Наиболее вероятные симптомы*

Выраженное снижение артериального давления и компенсаторная тахикардия.

*Лечение*

Симптоматическое. Артериальное давление 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 активированного угля или осмотического слабительного, например, натрия сульфата.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

При назначении тамсулозина вместе с атенололом, эналаприлом, нифедипином и теofilлином 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, хлормадион, 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, трихлорметиазид и хлормадинона.

Диклофенак и варфарин могут увеличивать скорость выведения тамсулозина.

В исследованиях *in vitro* не было обнаружено взаимодействия на уровне печеночного метаболизма с амитриптилином, сальбутамолом, глибенкламидом и финастеридом.

Одновременное назначение тамсулозина с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 может привести к увеличению концентрации тамсулозина. Одновременное назначение с кетоконазолом (мощный ингибитор изофермента CYP3A4) приводило к увеличению площади под фармакокинетической кривой (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. Препарат следует применять с осторожностью в комбинации с мощными и умеренными 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 применение тамсулозина с другими  $\alpha_1$ -адреноблокаторами может привести к снижению артериального давления.

### **Особые указания**

Как и при применении других  $\alpha_1$ -адреноблокаторов, при лечении тамсулозином в отдельных случаях может наблюдаться снижение артериального давления, 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.

Перед назначением терапии тамсулозином необходимо исключить наличие у пациента других заболеваний, которые могут вызвать такие же симптомы, как доброкачественная гиперплазия простаты.

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  $\alpha_1$ -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.

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

У некоторых пациентов, принимающих или ранее принимавших тамсулозин, во время проведения оперативных вмешательств по поводу катаракты или глаукомы 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 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.

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

При почечной недостаточности, а также при легкой и умеренной печеночной недостаточности не требуется коррекции режима дозирования.

#### **Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами**

Исследований по влиянию тамсулозина на способность к управлению транспортными средствами и механизмами не проводилось. Но, учитывая возможность возникновения головокружения, необходимо соблюдать осторожность при вождении автомобиля и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

#### **Форма выпуска**

Капсулы с пролонгированным высвобождением 0,4 мг.

10, 15, 18 или 20 капсул в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

30, 60 или 90 капсул в банке из полиэтилена высокой плотности.

1, 3 или 6 контурных ячейковых упаковок по 10 капсул, 2, 4 или 6 контурных ячейковых упаковок по 15 капсул, 5 контурных ячейковых упаковок по 18 капсул, 3 контурные ячейковые упаковки по 20 капсул или одна банка вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачке из картона.

#### **Условия хранения**

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **Срок годности**

3 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: (812) 322-76-38