ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

–

урИмак

(URIMAC)

Склад:

діюча речовина: тамсулозину гідрохлорид;

1 капсула містить тамсулозину гідрохлориду 0,4 мг;

допоміжні речовини: полісорбат 80, триацетин, метакрилатного сополімеру дисперсія, натрію лаурилсульфат, целюлоза мікрокристалічна, кальцію стеарат, капсула желатинова: желатин, індигокармін (Е 132), заліза оксид чорний (Е 172), заліза оксид червоний (Е 172), заліза оксид жовтий (Е 172), титану діоксид (Е 171), натрію лаурилсульфат.

Лікарська форма. Капсули пролонгованої дії тверді.

Основні фізико-хімічні властивості: тверді желатинові капсули № 2 з непрозорою кришечкою коричнево-зеленого кольору та непрозорим корпусом оранжевого кольору, з написами: «CL 23» – на кришечці та «0,4» – на корпусі капсул, що містять сипучі сферичні гранули від білого до майже білого кольору.

Фармакотерапевтична група.

Засоби, що застосовуються в урології. Засоби, що застосовуються при доброякісній гіперплазії передміхурової залози. Антагоністи альфа$_1$-адренергічних рецепторів.

Код АТХ G04C A02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Тамсулозину гідрохлорид вибірково і конкурентно блокує постсинаптичні

α_1-адренорецептори, зокрема $\alpha 1_A$ та $\alpha 1_D$, що знаходяться у гладкій мускулатурі передміхурової залози, шийки сечового міхура і простатичної частини уретри. Це знижує тонус гладкої мускулатури передміхурової залози, шийки сечового міхура і простатичної частини уретри та поліпшує виділення сечі. Одночасно зменшуються симптоми обструкції та

подразнення, пов’язані з доброякісною гіперплазією передміхурової залози (утруднення початку сечовипускання, послаблення струменя сечі, крапання після закінчення сечовипускання, відчуття неповного спорожнення сечового міхура, часті позиви до сечовипускання, позиви до сечовипускання в нічний час, невідкладність сечовипускання).

Як правило, терапевтичний ефект розвивається через 2 тижні від початку прийому препарату. Ці ефекти довгий час зберігаються при довгостроковому лікуванні і значною мірою стримують необхідність проведення хірургічної операції або катетеризації.

Антагоністи α_1-адренорецепторів мають здатність знижувати артеріальний тиск шляхом зниження периферичного тонусу судин. Під час проведення випробувань тамсулозину гідрохлориду не відзначалося клінічно вираженого зниження артеріального тиску.

Фармакокінетика.

Всмоктування. Тамсулозин добре всмоктується з травного тракту, а його біодоступність становить майже 100 %. Всмоктування тамсулозину відбувається дещо повільніше після прийому їжі. Однорідність всмоктування досягається в тому випадку, коли пацієнт приймає тамсулозину гідрохлорид в один і той самий час після прийому їжі. Фармакокінетика тамсулозину має лінійний характер.

Після прийому разової дози тамсулозину гідрохлориду після їжі пікова концентрація тамсулозину у плазмі крові досягається приблизно через 6 годин, а стабільна концентрація утворюється на 5-ту добу після щоденного прийому препарату. Максимальна концентрація при цьому є приблизно на дві третини вищою за ту, що утворюється після прийому разової дози.

Розподіл. У чоловіків тамсулозин приблизно на 99 % зв’язується з білками плазми крові. Об’єм розподілу препарату незначний (приблизно 0,2 л/кг).

Метаболізм. Тамсулозину гідрохлорид не піддається ефекту першого проходження і повільно метаболізується у печінці з утворенням фармакологічно активних метаболітів, що зберігають високу селективність до α_1-адренорецепторів. Більша частина активної речовини присутня в крові в незміненому вигляді.

Елімінація. Тамсулозин та його метаболіти виводяться з організму переважно із сечею. Приблизно 9 % від дози залишається у вигляді незміненої діючої речовини.

Після разового прийому дози тамсулозину гідрохлориду після їжі та при стабільній концентрації у плазмі крові періоди напіввиведення відповідно становлять приблизно 10 та 13 годин.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування функціональних розладів з боку нижніх сечовивідних шляхів при доброякісній гіперплазії простати.

Протипоказання.

Гіперчутливість до тамсулозину гідрохлориду, включаючи медикаментозно-індукований ангіоневротичний набряк, або до будь-якої з допоміжних речовин; наявність в анамнезі ортостатичної гіпотензії; тяжка печінкова недостатність.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При одночасному застосуванні тамсулозину гідрохлориду з атенололом, еналаприлом, ніфедипіном або теофіліном лікарської взаємодії не відзначалося. Одночасне застосування з циметидином підвищує, а з фуросемідом знижує концентрацію тамсулозину у плазмі крові, але оскільки ці рівні залишаються у межах норми, у спеціальній корекції дозування тамсулозину немає потреби.

У дослідженнях *in vitro* діазепам, пропранолол, трихлорметіазид, хлормадинон, амітриптилін, диклофенак, глібенкламід, симвастатин та варфарин не впливають на вільну фракцію тамсулозину у плазмі крові людини. Подібним чином тамсулозин не змінює рівень вільних фракцій діазепаму, пропранололу, трихлорметіазиду та хлормадинону у плазмі крові людини.

Диклофенак та варфарин можуть підвищувати швидкість елімінації тамсулозину.

Одночасне застосування тамсулозину гідрохлориду з сильними інгібіторами CYP3A4 може призвести до збільшення впливу тамсулозину гідрохлориду. Сумісне застосування з кетоконазолом (відомий сильний інгібітор CYP3A4) призводило до збільшення максимальної концентрації (C_{max}) та площі під кривою «концентрація-час» (AUC) до 2,2 і 2,8 відповідно.

Одночасне застосування тамсулозину гідрохлориду і пароксетину (сильний інгібітор CYP2D6) призводить до збільшення C_{max} і AUC до 1,3 і 1,6 відповідно, але це не є клінічно значущим.

Тамсулозину гідрохлорид не слід призначати у комбінації з сильними інгібіторами CYP3A4 пацієнтам з низьким метаболізмом CYP2D6.

Тамсулозину гідрохлорид слід застосовувати з обережністю у комбінації з сильними і помірними інгібіторами CYP3A4.

Одночасне застосування з іншими α_1-адреноблокаторами може посилювати гіпотензивний ефект.

Особливості застосування.

Як і при застосуванні інших α_1-адреноблокаторів, в окремих випадках при застосуванні препарату можливе зниження артеріального тиску, що може іноді призвести до втрати свідомості. При появі перших ознак ортостатичної гіпотензії (запаморочення, слабкість) пацієнт має прийняти горизонтальне положення до зникнення вищезгаданих симптомів.

Перед тим як розпочати лікування препаратом, слід пройти медичне обстеження з метою виявлення інших супутніх захворювань, що можуть спричиняти такі самі симптоми, як

доброякісна гіперплазія передміхурової залози. Перед початком лікування необхідно провести ректальне обстеження передміхурової залози. При необхідності також проводять тест на визначення рівня специфічного антигену передміхурової залози (PSA) до початку та через однакові проміжки часу під час лікування.

Призначати препарат пацієнтам із тяжкою формою ниркової недостатності (кліренс креатиніну < 10 мл/хв) необхідно з особливою обережністю, оскільки клінічних досліджень із застосуванням тамсулозину гідрохлориду таким пацієнтам не проводилося.

Тамсулозину гідрохлорид слід застосовувати з обережністю у комбінації з сильними і помірними інгібіторами CYP3A4 (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

У деяких пацієнтів, які приймали тамсулозин, під час хірургічного втручання з приводу видалення катаракти і глаукоми відзначався синдром атонічної зіниці (IFIS, варіант синдрому звуженої зіниці), що може стати причиною збільшення кількості ускладнень при проведенні такої операції.

Як правило, за 1-2 тижні перед проведенням операції з приводу видалення катаракти і глаукоми рекомендується припинити лікування тамсулозином. Проте доцільність та терміни припинення лікування тамсулозином на даний час точно не встановлені.

Про синдром атонічної зіниці повідомляли також у пацієнтів, яким припинили застосування тамсулозину протягом тривалого часу до проведення оперативного втручання з приводу катаракти.

Пацієнтам перед плановою операцією з приводу катаракти або глаукоми не рекомендується розпочинати прийом тамсулозину гідрохлориду. При підготовці до операції хірурги-офтальмологи мають дізнатися, чи приймав (або приймає) пацієнт тамсулозин, з метою попередження можливих ускладнень, пов’язаних з IFIS.

Тамсулозину гідрохлорид не слід призначати у комбінації з сильними інгібіторами CYP3A4 пацієнтам з низьким метаболізмом CYP2D6.

Тамсулозин слід застосовувати з обережністю у комбінації з сильними і помірними інгібіторами CYP3A4.

Іноді можна виявити залишки таблетки у фекаліях.

Повідомляли про випадки алергічних реакцій на тамсулозин у пацієнтів з наявністю в анамнезі алергії на сульфаніламіди. Слід дотримуватись обережності при застосуванні тамсулозину пацієнтам, у яких раніше відзначалася алергія на сульфаніламіди.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Препарат не застосовувати жінкам.

Фертильність

Під час клінічних досліджень тамсулозину протягом короткого та тривалого часу відзначалися порушення еякуляції. Випадки порушення еякуляції, ретроградної еякуляції і недостатньої

еякуляції відзначалися у післяреєстраціному періоді.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Дослідження впливу препарату на здатність керувати автотранспортом або механізмами не проводили. Однак пацієнтів потрібно попередити про можливість виникнення запаморочення, непритомності.

Спосіб застосування та дози.

Рекомендована доза для дорослих – 1 капсула щоденно, після сніданку; капсулу слід ковтати цілою, не розжовувати, оскільки це буде перешкоджати модифікованому вивільненню активного компонента, запивати молоком або водою (приблизно 150 мл), стоячи або сидячи.

Тривалість лікування встановлюється індивідуально.

Пацієнтам із нирковою недостатністю не потрібна корекція дози. Пацієнтам із помірною та середнього ступеня тяжкості печінковою недостатністю не потрібна корекція дози (див. також розділ «Протипоказання»).

Діти.

Препарат не застосовувати дітям.

Безпеку та ефективність застосування тамсулозину дітям віком до 18 років не оцінювали.

Передозування.

Симптоми.

Передозування тамсулозином гідрохлоридом може потенційно спричинити тяжку гіпотензивну дію. Тяжка гіпотензивна дія відзначалася при різних ступенях передозування.

Лікування.

У випадку різкого зниження артеріального тиску внаслідок передозування слід проводити підтримуючу терапію, спрямовану на відновлення нормальної функції серцево-судинної системи. Для нормалізації артеріального тиску та частоти серцевих скорочень пацієнта слід покласти в горизонтальне положення. Якщо цей захід не допомагає, рекомендується використовувати плазмозамінники і, при необхідності, судинозвужувальні препарати. Слід контролювати функцію нирок та проводити підтримуючу терапію. Проведення гемодіалізу є навряд чи доцільним, оскільки тамсулозин значною мірою зв'язується з білками плазми крові.

Допоможуть заходи, спрямовані на запобігання всмоктування, наприклад викликати блювання. При значному передозуванні необхідно провести промивання шлунка, а також застосувати активоване вугілля та осмотичний проносний засіб, наприклад сульфат натрію.

Побічні реакції.

З боку центральної нервової системи: запаморочення, головний біль, непритомність.

З боку серцево-судинної системи: відчуття серцебиття, постуральна гіпотензія.

З боку дихальної системи: риніт, носова кровотеча.

З боку травного тракту: запор, діарея, нудота, блювання, сухість у роті.

З боку шкіри: висип, кропив'янка, свербіж, ангіоневротичний набряк Квінке, синдром Стівенса-Джонсона, мультиформна еритема, ексфоліативний дерматит, реакція фоточутливості.

З боку статевої системи: пріапізм; розлади еякуляції, включаючи ретроградну еякуляцію і недостатність еякуляції.

З боку органів зору: затуманення зору, порушення зору.

Загальні порушення: астенія.

Описані випадки інтраопераційної нестабільності райдужної оболонки ока (синдром звуженої зіниці) при операції з приводу катаракти і глаукоми у пацієнтів, які тривалий час приймали тамсулозин (див. розділ «Особливості застосування»).

Післяреєстраційний досвід: окрім вищевказаних побічних реакцій повідомляли про випадки фібриляції передсердь, аритмії, тахікардії та задишки. Оскільки світовий післяреєстраційний досвід є джерелом вказаних вище спонтанних випадків, частоту повідомлень та роль тамсулозину у цих випадках не може бути достовірно встановлена.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30 °С в оригінальній упаковці.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 капсул у блістері, по 3 блістери у картонній упаковці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

МАКЛЕОДС ФАРМАСЬЮТИКАЛС ЛІМІТЕД.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Віледж Тхеда, ПО Лодхімайра, Техсіл Бадді, Дістрікт Солан, Хімачал Прадеш, 174101, Індія.