Тулозин



Код АТХ:

- G04CA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Тамсулозин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Капсулы с модифицированным высвобождением твердые желатиновые, самозакрывающиеся, с прозрачным корпусом зеленого цвета и непрозрачной крышечкой зеленого цвета; содержимое капсул - пеллеты белого цвета, без запаха или почти без запаха.

	1 капс.
тамсулозина гидрохлорид	400 мкг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата (1:1) (в форме 30% водного дисперсионного раствора), кальция стеарат.

Состав оболочки пеллет: сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата (1:1) (в форме 30% водного дисперсионного раствора), тальк, триэтилцитрат, твин 80 (полисорбат 80).

Состав оболочки капсул: корпус - индигокармин, хинолиновый желтый, титана диоксид, желатин; крышечка - индигокармин, хинолиновый желтый, желатин.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Альфа$_1$-адреноблокатор. Тулозин избирательно и конкурентно блокирует постсинаптические α_{1A}-адренорецепторы, находящиеся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры, а также α_{1D}-адренорецепторы, преимущественно находящиеся в теле мочевого пузыря. Это приводит к

снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и улучшению функции детрузора. За счет этого уменьшаются симптомы обструкции и раздражения, связанные с доброкачественной гиперплазией предстательной железы. Как правило, терапевтический эффект развивается через 2 недели после начала приема препарата, хотя у ряда пациентов уменьшение выраженности симптомов отмечается после приема первой дозы.

Способность Тулозина воздействовать на α_{1A}-адренорецепторы в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с α_{1B}-адренорецепторами, которые расположены в гладких мышцах сосудов. Благодаря такой высокой селективности препарат не вызывает какого-либо клинически значимого снижения системного АД как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальным исходным АД.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь тамсулозин быстро и практически полностью абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность препарата - около 100%. После однократного приема препарата внутрь C_{max} активного вещества в плазме достигается через 6 ч.

Сразу после приема пищи всасывание тамсулозина снижается. Равномерность всасывания возрастает, если пациент принимает препарат каждый день после одного и того же приема пищи.

В равновесном состоянии (через 5 дней курсового приема) значения C_{max} активного вещества в плазме крови на 60-70% выше, чем C_{max} после однократного приема препарата.

Распределение

Связывание с белками плазмы - 99%. Тамсулозин имеет незначительный V_d -приблизительно 0.2 л/кг.

Метаболизм

Тамсулозин практически не подвергается эффекту "первого прохождения" и медленно биотрансформируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов, сохраняющих высокую селективность к α_{1A}-адренорецепторам. Ни один из метаболитов не является более активным, чем исходное вещество. Большая часть активного вещества присутствует в крови в неизмененном виде.

Выведение

Тамсулозин и его метаболиты в основном выводятся почками, причем примерно 9% дозы выводится в неизмененном виде.

$T_{1/2}$ тамсулозина при однократном приеме - 10 ч, после многократного приема - 13 ч, конечный $T_{1/2}$ - 22 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При печеночной недостаточности уточнение дозы не требуется.

При нарушении функции почек дозу препарата уточнять не требуется.

Показания к применению:

— лечение функциональных симптомов доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Относится к болезням:

- Гиперплазия предстательной железы

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять при хронической почечной недостаточности (КК < 10 мл/мин), артериальной гипотензии (в т.ч. ортостатической), тяжелой печеночной недостаточности.

Способ применения и дозы:

Тулозин принимают внутрь в дозе 400 мкг (1 капс./сут).

Капсулы принимают после первого приема пищи, запивая достаточным количеством воды. Капсулу не следует разламывать и разжевывать.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: 1-10% - головокружение, сонливость или бессонница; 0.1-1% - головная боль.

Со стороны пищеварительной системы: 0.1-1% - тошнота, рвота, диарея или запор.

Со стороны половой системы: 0.1-1% - ретроградная эякуляция, снижение либидо; < 0.01% - приапизм.

Со стороны сердечно сосудистой системы: 0.01-0.1% - ортостатическая гипотензия, тахикардия, усиленное сердцебиение, боль в грудной клетке, обмороки.

Аллергические реакции: 0.01-0.1% - кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек.

Прочие: 0.1-1% - снижение остроты зрения, ринит, астения, боль в спине.

Передозировка:

Случаи острой передозировки не описаны.

Симптомы: теоретически возможно возникновение острой артериальной гипотензии.

Лечение: пациента следует уложить, чтобы восстановить АД и нормализовать ЧСС. Проводят кардиотропную терапию. Следует следить за функцией почек и применять общую поддерживающую терапию.

Если симптомы сохраняются, следует ввести объемозамещающие растворы или сосудосуживающие препараты. Для предотвращения дальнейшей абсорбции тамсулозина возможно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного. Диализ не эффективен, поскольку тамсулозин прочно связывается с белками плазмы крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение циметидина повышает концентрацию тамсулозина в плазме крови, фуросемид уменьшает его концентрацию в плазме крови. Однако в обоих случаях содержание тамсулозина остается в пределах терапевтически активных концентраций и коррекция дозы не требуется.

Диклофенак и непрямые антикоагулянты несколько увеличивают скорость выведения тамсулозина.

Одновременное применение тамсулозина с другими альфа$_1$-адреноблокаторами и другими препаратами, снижающими АД, может привести к выраженному усилению гипотензивного эффекта.

Не обнаружено взаимодействия при одновременном применении тамсулозина с атенололом, эналаприлом, нифедипином или теофиллином.

Концентрация тамсулозина в плазме крови не изменялась в присутствии диазепама, трихлорметиазида, амитриптилина, диклофенака, глибенкламида, симвастатина или варфарина.

Тамсулозин не изменял концентрации диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона.

Особые указания и меры предосторожности:

Тамсулозин следует применять с осторожностью у пациентов, предрасположенных к ортостатической гипотензии, т.к. и в случае приема других альфа$_1$-адреноблокаторов, у некоторых больных во время курса лечения может снизиться АД, что иногда приводит к обморочному состоянию. При появлении первых признаков ортостатической гипотензии (головокружение или слабость) пациента следует усадить или уложить до исчезновения симптомов.

Прежде чем начать терапию препаратом, пациент должен быть обследован с целью исключения наличия других заболеваний, которые могут вызывать такие же симптомы, как и доброкачественная гиперплазия предстательной железы. Перед началом лечения и регулярно во время терапии следует проводить пальцевое ректальное обследование и, если требуется, определение специфического антигена простаты (PSA).

У больных с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК < 10 мл/мин) Тулозин следует применять с

осторожностью, т.к. безопасность применения препарата у этой категории пациентов не исследована.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует применять при хронической почечной недостаточности (КК менее 10 мл/мин).

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять при тяжелой печеночной недостаточности.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре ниже 25°С.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Tulozin