Уропек



Код АТХ:

- G04CA04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Силодозин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы 4 мг, в упаковке ячейковой контурной 10 шт, в картонной пачке 3 или 9 упаковок.

Капсулы 8 мг, в упаковке ячейковой контурной 10 шт, в картонной пачке 3 или 9 упаковок.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: силодозин 4 или 8 мг

Вспомогательные вещества (для таблетки 4 мг): маннитол - 132.4 мг, крахмал прежелатинизированный (крахмал 1500 - 9 мг, крахмал PCS PC-10 - 26 мг), натрия лаурилсульфат - 1.8 мг, магния стеарат - 1.8 мг.

Состав желатиновой капсулы (для таблетки 4 мг): желатин - 47.434 мг, титана диоксид - 0.48 мг, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.086 мг.

Вспомогательные вещества (для таблетки 8 мг): маннитол - 264.8 мг, крахмал прежелатинизированный (крахмал 1500 - 18 мг, крахмал PCS PC-10 - 52 мг), натрия лаурилсульфат - 3.6 мг, магния стеарат - 3.6 мг.

Состав желатиновой капсулы (для таблетки 8 мг): желатин - 98 мг, титана диоксид - 2 мг, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.086 мг.

Описание:

Капсулы твердые желатиновые, желтого цвета, размер №3; содержимое капсул - аморфный или мелкокриталлический порошок от белого до светло-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Высокоселективный конкурентный антагонист α_{1A}-адренорецепторов, блокирует постсинаптические α_{1A}-адренорецепторы, находящиеся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейке мочевого пузыря и простатической части мочеиспускательного канала. Снижает тонус гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части мочеиспускательного канала, улучшая отток мочи. Одновременно уменьшаются симптомы обструкции и раздражения, связанные с доброкачественной гиперплазией предстательной железы.

Сродство к α_{1A}-адренорецепторам, расположенным в мочевом пузыре, в 162 раза превосходит его способность взаимодействовать с α_{1B}-адренорецепторами, которые расположены в гладких мышцах сосудов. Благодаря высокой селективности не вызывает клинически значимого снижения АД у пациентов с исходно нормальным АД.
Фармакокинетика

Всасывание и распределение

При приеме внутрь силодозин хорошо абсорбируется. Абсолютная биодоступность составляет 32%. Прием пищи снижает C_{max} примерно на 30%, увеличивая время достижения C_{max} примерно до 1 ч и оказывает минимальное влияние на AUC. C_{max} 87±51 мг/мл, T_{max} - 2.5 ч, средняя концентрация в моче 433±286 нг×ч/мл.

V_d силодозина составляет 0.81 л/кг. Силодозин связывается с белками плазмы на 96.6%.

Метаболизм и выведение

Силодозин метаболизируется посредством глюкуронирования (с участием UGT2B7), с участием алкогольдегидрогеназы и альдегиддегидрогеназы, окислительных путей, в основном с участием CYP 3A4. Основной активный метаболит в плазме карбамоилглюкуронид (KMD-3213G) достигает плазменной концентрации в 4 раза большей, чем сам силодозин. Силодозин не обладает потенциалом индукции или ингибирования изоферментов цитохрома P450.

33.5% силодозина выводится через почки и 54.9% через кишечник. Клиренс силодозина составляет около 23.1 л/ч. Силодозин экскретируется в основном в виде метаболитов и в очень малом количестве в неизмененном виде с мочой. $T_{1/2}$ силодозина и карбамоилглюкуронида составляет 11 ч и 18 ч соответственно.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетика силодозина и метаболитов существенно не зависела от возраста. Клиренс силодозина не изменялся у пациентов старше 75 лет.

У больных с умеренным нарушением функции печени (7-9 баллов по шкале Чайлд-Пью), фармакокинетика силодозина значимо не меняется. У пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью фармакокинетику силодозина не изучали.

Показания к применению:

Доброкачественная гиперплазия предстательной железы.

Относится к болезням:

- Гиперплазия предстательной железы

Противопоказания:

Препарат не должен применяться при наличии какого-либо из состояний, перечисленных ниже:

— почечная недостаточность тяжелой степени (КК < 30 мл/мин);

— тяжелая печеночная недостаточность (недостаточно клинических данных);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к активному веществу или любому из вспомогательных компонентов или их непереносимость.

С осторожностью следует применять при почечной недостаточности средней степени тяжести (КК от 30 до 50 мл/мин).

Способ применения и дозы:

Рекомендуемая доза - 8 мг 1 раз/сут, одновременно с приемом пищи, предпочтительно в одно и то же время суток. Необходимо проглатывать капсулу целиком, желательно запивая стаканом воды.

При лечении пациентов с почечной недостаточностью средней степени (КК от 30 до 50 мл/мин) рекомендуется в течение первой недели принимать препарат в дозе 4 мг/сут, при хорошей индивидуальной переносимости затем можно увеличить дозу до 8 мг/сут.

При почечной недостаточности тяжелой степени назначение силодозина не рекомендуется.

Побочное действие:

Нежелательные реакции с указанием частоты приведены ниже: очень часто (≥ 1/10), часто (от ≥1/100 до < 1/10), нечасто (от ≥ 1/1000 до < 1/100), редко (от ≥ 1/10 000 до < 1/1000), частота неизвестна (имеющиеся данные не позволяют определить частоту).

Со стороны ЦНС: часто - головокружение; частота неизвестна - синкопе.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ортостатическая гипотензия.

Со стороны дыхательной системы: часто - заложенность носа.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея; нечасто - тошнота, сухость во рту.

Со стороны половой системы: очень часто - ретроградная эякуляция, анэякуляция; нечасто - снижение либидо, эректильная дисфункция.

Прочие: частота неизвестна - интраоперационный синдром "дряблой" радужки во время операций по поводу катаракты.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, компенсаторная тахикардия.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного, симптоматическая терапия, направленная на увеличение ОЦК, сосудосуживающие лекарственные средства. Контроль функции почек. Диализ малоэффективен из-за интенсивного связывания препарата с белками плазмы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Силодозин предназначен только для мужчин.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуется сочетание с другими альфа-адреноблокаторами из-за возможного потенцирования действия.

Совместное применение ингибиторов изофермента CYP3A4 (кетоконазола, кларитромицина, итраконазола, ритонавира) не рекомендуется, т.к. увеличивает концентрацию силодозина в плазме.

Ингибиторы ФДЭ5 (силденафил, тадалафил) при совместном применении могут повышать риск развития головокружения.

Гипотензивные препараты (бета-адреноблокаторы, антагонисты кальция, препараты, действующие на РААС, диуретики) при совместном применении усиливают ортостатическую гипотензию.

Особые указания и меры предосторожности:

Как и при использовании других альфа$_1$-адреноблокаторов при лечении силодозином может наблюдаться снижение АД, ортостатическая гипотензия. При первых признаках ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) пациент должен сесть или лечь и оставаться в этом положении до тех пор, пока симптомы ортостатической гипотензии не исчезнут.

Поскольку доброкачественная гиперплазия предстательной железы и опухоли предстательной железы имеют сходные симптомы и могут развиваться вместе, пациентам с подозрением на доброкачественную гиперплазию предстательной железы перед назначением препарата необходимо обследование для исключения опухолей предстательной железы.

У пациентов, принимающих или принимавших альфа$_1$-адреноблокаторы, во время операции по поводу катаракты может возникать синдром "дряблой" радужки, что может привести к осложнениям во время операции. Необходимо прекращение лечения альфа$_1$-адреноблокаторами за 1-2 недели до такой операции. Пациентам, которым назначена операция по поводу катаракты, не рекомендуется начинать лечение препаратом Урорек.

Не проводилось исследований влияния на способность управлять транспортными средствами и оборудованием. Однако пациентов следует информировать о возможных проявлениях симптомов, связанных с ортостатической гипотензией (например, головокружения), а также предупредить о том, что следует воздержаться от управления транспортными средствами и оборудованием до выяснения индивидуальной переносимости препарата Урорек пациентом.
При лечении пациентов с почечной недостаточностью средней степени (КК от 30 до 50 мл/мин) рекомендуется в течение первой недели принимать препарат в дозе 4 мг/сут, при хорошей индивидуальной переносимости затем можно увеличить дозу до 8 мг/сут.

При почечной недостаточности тяжелой степени назначение силодозина не рекомендуется.
В случае применения при нарушении функции печени, препарат противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности (недостаточно клинических данных).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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