

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. **ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ**
URIMAX
УРИМАКС

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
<i>Кратка характеристика на продукта - Приложение 1</i>
Към РУ... 11-2947, 15-09-08
Одобрено: 8 / 20.11.07

2. **КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**
Всяка капсула съдържа
Tamsulosine hydrochloride 0.400 mg

3. **ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**
Твърди капсули с изменено освобождаване

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

Симптоми на долните пикочни пътища, свързани с доброкачествена хиперплазия на простатата (ДХП)

4.2. Дозировка и начин на приложение

Препоръчва се 0.4 mg еднократна дневна доза. Дозата се приема по едно и също време 30 минути след хранене. Капсулата се приема цяла – да не се троши или дъвче. Това ще наруши измененото освобождаване на лекарственото вещество.

Ако пациентът не се повлиява от доза 0.4 mg след лечение от 2 до 4 седмици, дозата може да се повиши на 0.8 mg (две капсули) като еднократна дневна доза.

Ако терапията се прекрати за няколко дни, приемът на капсулите може да продължи, като започне отново с 0.4 mg еднократна дневна доза.

4.3. Противопоказания

-Свръхчувствителност към тамсулозин или други компоненти на продукта.

-Анамнеза за ортостатична хипотензия.

-Тежка чернодробна недостатъчност.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Подобно на другите алфа 1 блокери по време на лечение с Уримакс може да се наблюдава в отделни случаи понижение на кръвното налягане, в резултат на което рядко може да се появи синкоп. При поява на признаци на хипотензия, като виене на свят и прилошаване, пациентът трябва да седне или легне докато симптомите отзвучат.

Преди да започне лечение с Уримакс, пациентът трябва да бъде изследван, за да се изключат състояния, които дават подобни симптоми на доброкачествена хиперплазия на простатата.



Преди лечението се извършва дигитално изследване на простатата и се изследва, ако е необходимо специфичен простатен антиген (ПСА) на определени интервали. При болни с напреднала бъбречна недостатъчност (креатининов клирънс < 10 мл/мин) лечението трябва да бъде проведено с особено внимание поради липса на опит с такива пациенти. По време на операции за катаракта при пациенти на, или са били на лечение с тамсулозин, е наблюдаван "Интраоперативен Флопи Синдром"(ИФИС, вариант на синдрома на малката зеница). ИФИС може да доведе до повишаване на процедурните усложнения по време на операцията. Не се препоръчва започване на терапията с тамсулозин при пациенти, при които е планирана операция на катаракта. Счита се, че прекратяване на лечението с тамсулозин 1-2 седмици преди операция за катаракта би могло да помогне, но ползата и продължителността на спиране на терапията преди операция за катаракта все още не са установени. По време на предоперативната оценка хирурзите и офталмологичните екипи трябва да обсъдят дали пациентите, подлежащи на операция за катаракта, са или са били лекувани с тамсулозин, за да осигурят съответни мерки, които да се предприемат за справяне с ИФИС по време на операцията.

4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не са наблюдавани взаимодействия на тамсулозин с атенолол, еналаприл, нифедипин, дигоксин и теофилин. Едновременното приложение със симетидин показва промяна в клирънса на тамсулозина (26% намаляване) и промяна в AUC (44% увеличаване). Това изисква особено внимание при едновременно приложение особено при дози на тамсулозин по-високи от 0.4 mg.

Не се препоръчва едновременното приложение на тамсулозин с други алфа- адренергични блокери поради очаквано взаимодействие по отношение на засилен хипотензивен ефект. При едновременно приложение с фуросемид се намалява нивото на тамсулозин (10-12 %), но тази промяна е незначима и не изисква промяна в дозата.

В опити *in vitro* е доказано, че пропранолол, хлормадион, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не променят свободната фракция на тамсулозин. Самият тамсулозин не променя свободната фракция на диазепам, пропранолол и хлормадион.

В опити *in vitro* изследванията с чернодробна, микрозомална фракция (представляваща цитохром P-450-свързаната лекарствено- метаболизираща ензимна система) не са наблюдава взаимодействие на нивото на чернодробни



метаболизъм между тамсулозин и амитриптилин, салбутамол, глибенкламид и финастерид.

Диклофенак и варфарин могат да увеличат скоростта на елиминиране на тамсулозин.

Лабораторни тестове:

Не е установено взаимодействие между тамсулозин и резултатите от лабораторни изпитвания.

Лечението с тамсулозин в продължение на 12 месеца не променя нивото на простатния специфичен антиген (ПСА).

4.6. Бременност и лактация

Неприложимо, тъй като Уримакс е предназначен само за мъже.

4.7. Ефект върху способността за шофиране и работа с машини

Няма данни за неблагоприятен ефект на Уримакс върху способността за шофиране и работа с машини. Трябва да се има предвид възможността за поява на световъртеж.

4.8. Нежелани лекарствени реакции:

Чести (>1%, <10%)

От страна на нервната система: световъртеж

Нечести (>0.1%, < 1%)

От страна на нервната система: главоболие

От страна на сърдечно-съдовата система:

сърцебиене, постурална хипотензия

Респираторни, торакални и медиастинални:

ринит, фарингит, кашлица

От страна на храносмилателна система:

констипация, диария, повръщане

От страна на кожата и подкожните тъкани:

обрив, пруритус, уртикария, ангиоедема

От страна на половата система:

нарушена еякулация.

Редки (> 0.01%, < 0.1%)

От страна на нервната система : синкоп.

Много редки:(< 0.01%)

От страна на половата система : приапизъм

Нарушения в зрението: по време на операции за катаракта състоянието на малката зеница, известно като Интраоперативен Флопи Ирис Синдром (ИФИС) се е свързвало с терапия с тамсулозин по време на пост-маркетинговото наблюдение (виж раздел 4.4)

4.9. Предозиране

Няма съобщения за остро предозиране. Теоретично след предозиране може да се наблюдава хипотензия. В такъв случай е необходимо да се стабилизира сърдечно-съдовата система. Кръвното налягане и сърдечната честота се нормализират след поставяне на пациента в легнало положение. Ако това не помогне



се прилагат обемни заместители и при нужда вазопресори. Бъбречната функция трябва да се мониторира и да се приложат общоподдържащи мерки. Тамсулозин се свързва с плазмените протеини до 99%, което показва, че диализата не би могла да бъде полезна.

При предозиране, за да се намали резорбцията, могат да се вземат мерки за предизвикване на повръщане. При прием на големи количества тамсулозин се прилага стомашна промивка с активен въглен и осмотични слабителни средства.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

Фармакологична група

УРИМАКС е алфа 1-адренергичен антагонист.

АТС код G04 CA02

Фармакодинамика

Симптомите, съпътстващи ДХП са свързани с обструкция на отвора на пикочния мехур, която са състои от два компонента - статичен и динамичен. Статичният компонент е свързан с нарастване размера на простатата, предизвикано от пролиферацията на стромата на простатата. Тежестта на симптомите на ДХП и степента на обструкцията на уретрата не съответства с големината на простатата. Динамичният компонент е функция на повишаване на гладкомускулния тонус на простатата и шийката на пикочния мехур, водещи да стеснение на отвора на последния. Гладкомускулният тонус е медиран от стимулация на алфа адренорецепторите които се разполагат в капсулата на простатата, простатната част на уретрата и шийката на пикочния мехур.

Блокирането на тези рецептори може да предизвика релаксация на гладкомускулните влакна в шийката на мехура и простатата и води до подобряване на симптомите на изпразване и увеличаване на максималния уринарен поток

Тамсулозин се свързва избирателно и конкурентно с алфа 1-рецепторите постсинаптично, по-специално с алфа 1А и алфа 1D. В резултат на това свързване се наблюдава отпускане на гладката мускулатура на простатата и уретрата и подобряване на симптомите на ДХП.

Идентифицирани са най-малко три алфа 1 подтипа: алфа-1А; алфа-1В и алфа-1D. Тяхното разпределение се различава в човешките органи и тъкани. Приблизително 70% от алфа рецепторите в простатата на човека са от алфа 1А подтип. Ефектът върху симптомите на ДХП се поддържа при дългосрочна терапия с тамсулозин. Необходимостта от хирургична намеса или катетиризация се отлага.

Алфа 1 блокерите могат да понижат кръвното налягане чрез намаляване на периферното съпротивление. При проведените клинични изпитвания с тамсулозин 0.4 мг. не е наблюдавано понижаване на кръвното налягане с клинично значение. Уримакс не е предназначен за лечение на хипертония.



5.2. Фармакокинетика

Резорбция:

Тамсулозин се резорбира в тънките черва при запазена биологична активност. Резорбцията се намалява когато се приема след ядене.

Резорбцията е еднаква при прием на тамсулозин по едно и също време след хранене.

Тамсулозин показва линейна кинетика. След прием на единична доза тамсулозин 0.4 mg след ядене, максималната плазмена концентрация се достига за 6 ч., равновесната плазмена концентрация се постига на 5-ия ден. Максималната плазмена концентрация (C_{max}) при пациентите е около две трети по-висока от достигнатата след единичен прием. Независимо че това се наблюдава при възрастни пациенти, може да се очаква същия ефект и при по-млади индивиди.

Има значителни индивидуални различия в плазмените нива след еднократен и след многократен прием.

Разпределение:

Тамсулозин се свързва с плазмените протеини до 99%. Обемът на разпределение е около 0.2l/kg.

Биотрансформация:

Тамсулозин има слаб ефект на първо преминаване, тъй като слабо се метаболизира. В плазмата се представя като непроменено лекарствено вещество. Бавно се метаболизира в черния дроб. След многократно приложение на тамсулозин при плъхове не се установява индукция на микрозомални чернодробни ензими.

Метаболитите на тамсулозин запазват селективната алфа 1A и алфа 1D активност, но са много по-слабо ефективни в сравнение с изходното съединение. Тези метаболити претърпяват конюгиране до глюкорониди или сулфати преди ренална екскреция.

При чернодробно увреждане не се налага корекция на дозата.

Излъчване

След единична доза на тамсулозин 0.4 mg във фазата на насищане и в равновесно състояние, времето за полуелиминиране е около 10 часа, или съответно 13 часа.

Тамсулозин се екскретира главно с урината (76%) и по-малко с изпражненията (21%) за 168 часа.

Наличието на бъбречно увреждане не налага промяна в дозата.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Извършени са изследвания за токсичност с единични и повтарящи дози на мишки, плъхове и кучета.

Проучена е репродуктивната токсичност при плъхове, карциногенност при мишки и плъхове и *in vivo* и *in vitro* генотоксичност.

Общият профил на безопасност, наблюдаван при високи дози тамсулозин, съвпада с познатото фармакологично действие на алфа-адренергичните блокиращи средства.



При високи дози тамсулозин на кучета не е наблюдавана промяна в ЕКГ.

Тамсулозин не показва генотоксични свойства. Съобщава се за увеличена поява на пролиферативни изменения в млечните жлези на женски плъхове и мишки. Тези данни са свързани вероятно с хиперпролактинемия и са възникнали при високи дози. Счита се че тези резултати нямат клинично значение.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Захарни сфери (710 micron)
Талк
Хидроксипропилметилцелулоза Е -15
Пропиленгликол
Полисорбат 80
Силициев диоксид, колоиден безводен
Шурилийз Е -77050
Хидроксипропилметилцелулоза бсрс
Еудражит L30 D 55
Триетилцитрат

6.2. Несъвместимости

Не са известни

6.3. Срок на годност

Две години

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява на места при температура под 25° С
Да се пази на място, недостъпно за деца!

6.5. Данни за опаковката

Три блистера по 10 капсули в картонена кутия.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Медика АД,
СОФИЯ 1504, Бул. "Княз Ал. Дондуков" N 82
Телефон 96 00 330
Факс 96 00 324
E-mail: sofia@medica.bg

8. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ.

9. ДАТА НА ПОСЛЕДНА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

22.10.07.

