

Súhrn charakteristických vlastností lieku

1. NÁZOV LIEKU

Tamsulosin hydrochloride Kiron 0,4 mg

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedna kapsula obsahuje 0,4 mg tamsulozíniumchloridu.

Pomocné látky, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Tvrdá kapsula s riadeným uvoľňovaním

Oranžová/olivovozelená kapsula s čiernym vytlačeným označením TSL 0,4 a čiernym pruhom na oboch koncoch. Kapsula obsahuje biele až sivobiele pelety.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Príznaky dolných močových ciest (LUTS) spojené benígnou hyperpláziou prostaty (BPH).

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Jedna kapsula denne po raňajkách alebo po prvom dennom jedle. Kapsula sa prehĺta celá a zapíja pohárom vody postojacky alebo posediačky (nie poležiačky). Kapsula sa nesmie rozlamovať alebo rozoberať, pretože to môže mať vplyv na uvoľňovanie dlhodobo pôsobiaceho liečiva.

4.3 Kontraindikácie

Precitlivenosť na tamsulozín, vrátane liekov indukujúcich angioedém, alebo na niektorú z pomocných látok.

V minulosti pozorovaná ortostatická hypotenzia (ortostatická hypotenzia v anamnéze).
Závažná hepatálna insuficiencia.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Používanie tamsulozínu môže znižovať krvný tlak, čo môže v zriedkavých prípadoch spôsobiť mdloby. Ak sa začnú prejavovať začiatkové príznaky ortostatickej hypotenzie (závrat, slabosť), pacient si má sadnúť alebo ľahnúť, kým príznaky nevymiznú.

Pred začiatkom liečby tamsulozínom má byť pacient vyšetrený, aby sa vylúčila prítomnosť iných stavov, ktoré môžu vyvolať podobné príznaky, ako má BHP. Prostata sa má vyšetriť per rectum a v prípade potreby stanoviť hodnotu PSA pred začiatkom liečby a neskôr opakovať v pravidelných intervaloch.

K liečbe pacientov so závažným poškodením funkcie obličiek (klírens kreatinínu <10 ml/min) sa má pristupovať s opatrnosťou, pretože u týchto pacientov sa nevykonali žiadne štúdie.

Po použití tamsulozínu sa zriedkavo hlásil angioedém. Liečba sa má okamžite prerušiť, pacient má byť sledovaný až do vymiznutia edému a tamsulozín sa nesmie znovu podávať.

4.5 Liekové a iné interakcie

Nepozorovali sa nijaké interakcie pri podávaní tamsulozínu súbežne s atenololom, enalaprilom, nifedipínom alebo teofylínom. Súbežne podávaný cimetidín zvyšuje a súbežne podávaný furosemid znižuje plazmatické koncentrácie tamsulozínu, no keďže koncentrácia tamsulozínu zotráva v normálnom rozmedzí, nie je potrebné upravovať dávkovanie.

Nezistilo sa, že by tamsulozín vzájomne pôsobil s amitriptylínom, salbutamolom, glibenklamidom alebo finasteridom počas *in vitro* štúdií s pečenejovými mikrozómovými frakciami (reprezentujúcimi metabolizujúci enzýmový systém súvisiaci s cytochrómom P450). Diklofenak a warfarín môžu zvyšovať mieru vylučovania tamsulozínu.

Súbežné podávanie s inými antagonistami α_1 -adrenergných receptorov môže znižovať krvný tlak.

4.6 Gravidita a laktácia

Tamsulozín je určený iba pre mužov.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Neuskutočnili sa žiadne štúdie o účinkoch na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje. Pacienti si však majú uvedomiť skutočnosť, že sa môže objaviť závrat.

4.8 Nežiaduce účinky

	Časté (>1/100, <1/10)	Menej časté (>1/1000, <1/100)	Zriedkavé (>1/10 000, <1/1000)	Veľmi zriedkavé (<1/10 000)
Poruchy nervového systému	Závrat	Bolesť hlavy	Synkopa	
Poruchy srdca		Tachykardia		
Cievne poruchy		Ortostatická hypotenzia		
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína		Rinitída		
Gastrointestinálne poruchy		Zápcha, hnačka, nauzea, vracanie		
Poruchy kože a podkožného tkaniva		Vyrážka, svrbenie, urtikária	Angioedém	
Poruchy reprodukčného systému a prsníkov		Abnormálna ejakulácia		Priapizmus
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania		Asténia		

4.9 Predávkovanie

Neboli hlásené žiadne prípady akútneho predávkovania. Teoreticky sa však po predávkovaní môže vyskytnúť akútna hypotenzia, v takomto prípade sa má poskytnúť podpora kardiovaskulárnym funkciám. Krvný tlak možno upraviť a srdcovú frekvenciu vrátiť do normálu po uložení pacienta. Ak to nepomôže, možno použiť lieky na zväčšenie intravazálneho objemu a, ak je to nutné, možno nasadiť vazopresory. Má sa sledovať renálna funkcia a zaviesť celkové podporné opatrenia. Dialýza pravdepodobne nepomôže, pretože tamsulozín sa vo vysokej miere viaže na plazmatické proteíny.

Po požití veľkých dávok lieku možno vykonať výplach žalúdka a podať aktívne uhlie a osmotické laxatívum, ako je síran sodný.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina

Tamsulozín je antagonist α_{1A} -adrenergických receptorov. Liek sa používa iba na liečbu ochorení prostaty.

ATC kód: G04C A02

Mechanizmus účinku

Tamsulozín sa selektívne a kompetitívne viaže na postsynaptické α_{1A} -adrenoreceptory, čím zabraňuje kontrakcii hladkého svalu, čo vedie k uvoľneniu hladkého svalstva prostaty a uretry.

Farmakodynamické účinky

Tamsulozín zvyšuje maximálny prietok moču uvoľnením hladkého svalstva prostaty a uretry, a tým zmierňuje obštrukciu.

Liek tiež zlepšuje príznaky iritácie a obštrukcie, pri ktorých zohráva významnú úlohu kontrakcia hladkých svalov dolných močových ciest.

Alfablokátory môžu znižovať krvný tlak znižovaním periférnej rezistencie. Počas štúdií s tamsulozínom sa u normotenzných pacientov nepozorovalo žiadne klinicky významné zníženie krvného tlaku.

Účinky lieku na plniace a vyprázdňovacie symptómy tiež pretrvávajú počas dlhodobej terapie, čoho výsledkom je významné oddialenie nutnosti chirurgickej liečby.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia

Tamsulozín sa rýchlo vstrebáva z čriev a jeho biologická dostupnosť je takmer úplná. Absorpcia je znížená, ak sa pred užitím lieku požíja jedlo. Uniformitu vstrebávania tamsulozínu možno dosiahnuť užívaním tamsulozínu vždy po raňajkách.

Tamsulozín vykazuje lineárnu kinetiku.

Maximálne plazmatické hladiny sa dosahujú približne šesť hodín po jednorazovej dávke tamsulozínu užitej po hlavnom jedle. Pri opakovanom podávaní sa rovnovážny stav dosiahne na 5. deň, keď je C_{max} u pacientov približne o dve tretiny vyššia než koncentrácia dosiahnutá po jednorazovej dávke. Toto sa však pozorovalo iba u starších pacientov, no rovnaký výsledok sa očakáva aj u mladších pacientov.

Medzi pacientmi je obrovská variabilita plazmatických hladín tamsulozínu tak po jednorazovom, ako i po viacnásobnom podávaní.

Distribúcia

U ľudí sa viac ako 99% tamsulozínu viaže na plazmatické bielkoviny a distribučný objem je nízky (približne 0,2 l/kg).

Biotransformácia

Tamsulozín má malý účinok "first-pass" metabolizmu. Väčšina tamsulozínu sa v plazme zistila v nezmenenej forme. Liečivo sa metabolizuje v pečeni.

V štúdiách na potkanoch sa zistilo, že tamsulozín spôsobuje iba miernu indukciu mikrozómových pečenevých enzýmov.

Metabolity nie sú také účinné a toxické ako samotný účinný liek.

Exkrécia

Tamsulozín i jeho metabolity sa vylučujú prevažne močom a približne 9% dávky je prítomných v nezmenenej forme.

Polčas vylučovania tamsulosínu u pacientov je približne 10 hodín (keď sa užíva po jedle) a 13 hodín v rovnovážnom stave.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Toxicita po jednorazovej dávke a viacnásobnom dávkovaní sa skúmala u myší, potkanov a psov. Reprodukčná toxicita sa tiež skúmala u potkanov, karcinogenita u myší a potkanov a genotoxicita *in vivo* a *in vitro*.

Celkový toxický profil zistený pri veľkých dávkach tamsulosínu zodpovedá farmakologickému účinku súvisiacemu s alfa-adrenergými antagonistami.

Pri veľmi vysokých dávkach sa u psov pozorovali zmeny v EKG. Predpokladá sa však, že to nemá žiaden klinický význam. Nezistilo sa, že by mal tamsulozín nejaké významné genotoxické vlastnosti.

Po podaní tamsulosínu samiciam potkanov a myší sa odhalil zvýšený výskyt proliferatívnych zmien na mliečnych žľazách. Tieto nálezy, ktoré sa pravdepodobne nepriamo spájali so zvýšenými hladinami prolaktínu a vyskytli sa iba ako následok po užívaní vysokých dávkach, sa nepovažujú za klinicky významné.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

Obsah kapsuly

Mikrokryštalická celulóza
Kopolymér MA/EA 1:1
Polysorbát 80
Nátriumlaurylsulfát
Trietylcitrát
Mastenec

Telo kapsuly

Želatína
Indigokarmín (E132)
Oxid titaničitý (E171)
Žltý oxid železitý (E172)
Červený oxid železitý (E172)
Čierny oxid železitý (E172)

Atrament

Šelak
Čierny oxid železitý (E172)
Sójový lecitín
Dimetikón DC 1510

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

30 mesiacov.

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Blistrové balenia: Uchovávajú v pôvodnom obale.
Obaly na tablety: Obal udržiavajte dôkladne uzatvorený.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

PVC/PE/PVDC/hliníkové blistrové balenia v papierových škatuľkách a HDPE obaly na tablety s PP uzávermi bezpečnými pre deti obsahujúce 10, 14, 20, 28, 30, 50, 56, 60, 90 100 alebo 200 kapsúl s riadeným uvoľňovaním.

Nie všetky veľkosti balenia musia byť uvedené do obehu.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu

Žiadne zvláštne požiadavky.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

KIRON PHARMACEUTICA BV
Groesbeekseweg 11
Nijmegen
Holandsko

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/ PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

November 2005.