

1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Tamictor 0,4 mg depotkapseli, kova

2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Yksi kapseli sisältää 0.4 mg tamsulosiinihydrokloridia vastaten 0.367 mg tamsulosiinia.

Apuaineet ks. kohta 6.1

3. LÄÄKEMUOTO

Depotkapseli, kova

Oranssi/oliivinvihreä liivatekapseli, jossa musta painatus TSL 0.4 ja jonka molemmissa päissä on musta raita. Kapselin sisältö on valkoisia tai kellertäviä rakeita.

4. KLIINISET TIEDOT

4.1 Käyttöaiheet

Eturauhasen hyvänlaatuisen liikakasvun (BPH) oireiden hoito.

4.2 Annostus ja antotapa

Yksi kapseli päivässä aamiaisen tai päivän ensimmäisen aterian jälkeen. Kapseli niellään kokonaisuutena vesilasillisen kera pystyasennossa tai istuen (ei makuuasennossa). Kapselia ei saa rikkoo eikä purra, koska se voi vaikuttaa pitkävaikutteisen aktiiviaineen vapautumiseen. Kapseli voidaan kuitenkin avata ja sisältö niellä pureskelematta.

4.3 Vasta-aiheet

Yliherkkyys tamsulosiinille tai valmisteeseen jollekin muulle aineosalle. Aikaisemmin havaittu ortostaattinen hypotensio.

Vaikea maksan vajaatoiminta.

4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Tamictor-valmisteen käyttö voi laskea verenpainetta, mikä harvoin voi aiheuttaa pyörtymisen. Ortostaattisen hypotension (pyörtyys, heikotus) ensioireiden alkaessa potilaan tulisi olla istuvassa tai makuuasennossa niin kauan kunnes oireet ovat hävinneet.

Ennen Tamictor-hoidon aloittamista potilas on tutkittava muiden samankaltaisia oireita kuin BPH aiheuttavien sairauksien poissulkemiseksi. Eturauhanen tulisi tutkia peräsuolen kautta sekä määrittää tarvittaessa PSA ennen hoidon aloittamista sekä säännöllisin väliajoin myöhemmin.

Tamsulosiinia tulee antaa varoen vaikean munuaisten vajaatoiminnan yhteydessä (kreatiniinipuhdistuma <10 ml/min), koska käytöstä näille potilaille ei ole kokemusta.

Harmaakaihileikkauksen yhteydessä on joillakin potilailla, jotka käyttävät tai ovat aiemmin käyttäneet tamsulosiinia, todettu IFIS-oireyhtymä (Intra-Operative Floppy Iris Syndrome, pienen pupillin syndrooman variantti). Oireyhtymä saattaa lisätä leikkaukskomplikaatioiden riskiä. Tamsulosiinin aloittamista potilailla, joille on suunniteltu kaihileikkausta ei suositella.

Tamsulosiinin käytön lopettamisesta 1-2 viikkoa ennen harmaakaihileikkausta on yksittäistapauksissa todettu olevan hyötyä, mutta vielä ei ole määritelty, kuinka kauan potilaan tulisi pidättäytyä tamsulosiinin käytöstä ennen operaatiota.

Harmaakaihileikkausta suunniteltaessa leikkaavan lääkärin ja hoitohenkilökunnan on selvitettävä, käyttääkö potilas parhaillaan tai onko hän aiemmin käyttänyt tamsulosiinia, ja huolehdittava asianmukaisista toimenpiteistä leikkauksessa ilmenevän IFIS-oireyhtymän varalta.

4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset

Yhteisvaikutuksia ei ole havaittu, kun tamsulosiinia on annettu samanaikaisesti atenololin, enalapriilin, nifedipiinin tai teofylliinin kanssa. Samanaikainen simetidiinilääkitys nostaa ja furosemidilääkitys laskee tamsulosiinin plasmapoitoisuutta mutta, koska tamsulosiininipitoisuus pysyy normaaliaalueella annostusta ei ole tarpeen muuttaa.

In vitro -tutkimuksissa maksan mikrosomaalifrakzioilla (edustavat sytokromi P₄₅₀-välitteistä metaboliaentsyymisysteemiä) tamsulosiinilla ei ole havaittu interaktioita amitriptyliinin, salbutamolin, glibenklamidin eikä finasteridin kanssa.

Samanaikainen toisen α -adrenoreseptorisalpaajan anto voi alentaa verenpainetta.

4.6 Raskaus ja imetys

Tamictor-valmiste on tarkoitettu vain miehille.

4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn

Tamictor-valmisteen vaikutuksesta autolla ajokykyyn tai koneiden käyttökykyyn ei ole tietoa. Kuitenkin potilaiden on syytä olla tietoisia, että tamsulosiini voi aiheuttaa huimausta.

4.8 Haittavaikutukset

	Yleinen (>1/100, <1/10)	Melko harvinainen (>1/1 000, <1/100)	Harvinainen (>1/10 000, <1/1 000)	Hyvin harvinainen (<1/10 000)
Hermostojärjestelmään liittyvät	Huimaus	Päänsärky	Pyörtyminen	

Sydämeen liittyvät	Sydämentykytys	
Verisuonistoon liittyvät	Posturaalinen hypotensio	
Hengitysteihin, keuhkoihin tai välikarsinaan liittyvät	Riniitti	
Ruoansulatukseen liittyvät	Ummetus, ripuli, pahoinvointi, oksentelu	
Ihohon tai ihonalaiskudokseen liittyvät	Ihottuma, kutina, urtikaria	Angioödeema
Lisääntymiselimistöön liittyvät	Epänormaali ejakulaatio	Priapismi
Yleiset elimistöön liittyvät	Astenia	

Tamsulosiinihoitoon liittyen on kaihi-leikkauksen aikana raportoitu pienen mustuaisen oireyhtymää (IFIS, Intraoperative Floppy Iris Syndrome) (ks. myös kohta 4.4)

4.9 Yliannostus

Akuutteja yliannostustapauksia ei ole raportoitu. Ortostaattista hypotensiota voi teoriassa kuitenkin ilmetä yliannostuksen jälkeen. Hoito on tällöin oireenmukaista. Jos lääkemäärät ovat suuria, voidaan suorittaa mahahuuhtelu ja antaa aktiivihäilyä ja osmoottista laksatiivia, kuten natriumsulfaattia.

5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen ryhmä

Tamsulosiini on α_{1A} -adrenoreseptoriantagonisti. Valmistetta käytetään yksinomaan eturauhaseen liittyvien sairauksien hoitoon.

ATC-koodi: G04CA02

Vaikutusmekanismi

Tamsulosiini sitoutuu selektiivisesti ja kompetitiivisesti niihin postsynaptisiin α_{1A} -adrenoreseptoreihin, jotka välittävät sileän lihaksen supistumista eturauhasessa ja virtsaputkessa relaksoimalla sileää lihasta.

Farmakodynaamiset vaikutukset

Tamsulosiini lisää virtsan maksimivirtausnopeutta relaksoimalla sileää lihasta eturauhasessa ja virtsaputkessa ja helpottaa siten obstruktiota.

Valmiste parantaa myös sellaisia ärsytys- ja obstruktio-oireita, joissa virtsarakon epästabiiliudella ja alempien virtsateiden sileän lihaksen supistumisella on tärkeä osuus.

Alfasalpaajat voivat alentaa verenpainetta alentamalla perifeeristä resistenssiä. Kliinisesti merkitsevää verenpaineen alenemista ei havaittu normotensiivisille potilaille tamsulosiinilla suoritetuissa tutkimuksissa.

Valmisteen vaikutus sekä kerääntymis- että tyhjennysoireisiin pysyy yllä myös pitkäaikaishoidossa, mistä johtuen kirurgisen hoidon tarve merkitsevästi siirtyy.

5.2 Farmakokinetiikka

Tamsulosiiniannosta ei ole tarpeen muuttaa lievässä munuaisten vajaatoiminnassa.

Imeytyminen

Tamsulosiini imeytyy nopeasti suolistosta ja sen biologinen hyötyosuus on lähes täydellinen. Ennen lääkkeen ottoa nautittu ateria hidastaa imeytymistä. Tasainen imeytyminen voidaan varmistaa ottamalla Tamictor-valmiste aina aamiaisen jälkeen.

Tamsulosiinilla on lineaarinen kinetiikka.

Tamictor kerta-annos ruokailun jälkeen otettuna saa aikaan tamsulosiinin huippupitoisuuden plasmassa noin 6 tunnin kuluttua ja toistuvassa lääkityksessä steady state -taso saavutetaan viidenteen päivään mennessä, toistuvasti lääkettä otettaessa C_{max} on potilailla noin 2/3 korkeampi kuin kerta-annoksen jälkeen. Vaikka tämä on todettu vain vanhuksista, sama tulos on odotettavissa myös nuoremmilla potilailla.

Plasman tamsulosiinipitoisuuksissa on suuria potilaiden välisiä vaihteluja sekä kerta-annon että toistuvan annon jälkeen.

Jakautuminen

Ihmisessä tamsulosiini sitoutuu plasman proteiineihin yli 99 %:sti ja jakautumistilavuus on pieni (n. 0,2 l/kg).

Metabolia

Tamsulosiinilla on vähäinen ensikierron-metabolia. Suurin osa tamsulosiinista on plasmassa muuttumattomana. Aine metaboloituu maksassa.

Rotilla tehdyissä tutkimuksissa tamsulosiinin todettiin aiheuttavan vain vähän maksan mikrosomaalisten entsyymien induktiota.

Metaboliitit eivät ole niin tehokkaita tai toksisia kuin aktiivi lääkeaine.

Erittyminen

Tamsulosiini ja sen metaboliitit erittyvät pääasiassa virtsaan, noin 9 % annoksesta muuttumattomassa muodossa.

Potilailla tamsulosiinin eliminaation puoliintumisaika on noin 10 tuntia (ruuan jälkeen otettuna) kerta-annoksen jälkeen ja vastaavasti 13 tuntia steady state -tasolla.

Munuaisten toiminnanvajausta ei vaadi annoksen pienentämistä.

5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta

Toksisuutta kerta-annoksen ja toistuvan annon jälkeen on tutkittu hiirillä, rotilla ja koirilla. Lisäksi on tutkittu lisääntymistoksisuutta rotilla, karsinogeenisyyttä hiirillä ja rotilla sekä genotoksisuutta *in vivo* ja *in vitro*.

Suurten tamsulosiiniannosten todettu yleinen toksisuusprofiili vastaa alfa-adrenergisten salpaajien tunnettua farmakologista vaikutusta.

Erittäin suuria annoksia annettaessa koirista todettiin EKG-muutoksia. Tällä ei kuitenkaan oleteta olevan kliinistä merkitystä. Tamsulosiinilla ei todettu olevan merkittäviä genotoksisia ominaisuuksia.

Naarasrotilla ja -hiirillä on todettu esiintyvän enemmän rintarauhasten proliferatiivisia muutoksia tamsulosiinialtistuksen yhteydessä. Näitä löydöksiä, jotka todennäköisesti liittyvät epäsuorasti hyperprolaktinemiaan ja esiintyvät vain suurten annosten seurauksena, pidetään merkityksettöminä.

6. FARMASEUTTISET TIEDOT

6.1 Apuaineet

Kapselin sisältö: mikrokiteinen selluloosa, metakryylihapo-etyyliakrylaattikopolymeeri (1:1), polysorbaatti 80, natriumlauryylisulfaatti, trietyylisitraatti, talkki.

Kapselikuori: Liivate, indigokarmiini (E 132) titaanidioksidi (E 171), keltainen rautaoksidi (E 172), punainen rautaoksidi (E 172).

Muste: shellakka, musta rautaoksidi (E 172), propyleeniglykoli.

6.2 Yhteensopimattomuudet

Ei oleellinen.

6.3 Kesto aika

36 kuukautta.

6.4 Säilytys

Säilytä alkuperäispakkauksessa.

6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoot

Pahvikotelot, joissa on 10, 20, 30, 50, 60, 90, 100 tai 200 depotkapselia PVC/PE/PVDC/Al-läpipainopakkauksessa.

HDPE-purkit, joissa on 10, 20, 30, 50, 60, 90, 100 tai 200 depotkapselia ja PP-turvasuljin.

Kaikkia pakkauksia ei välttämättä ole myynnissä.

6.6 Käyttö- ja käsittelyohjeet

Ei erityisohjeita.

7. MYYNTILUVAN HALTIJA

Avansor Pharma Oy
Tekniikantie 14
02150 Espoo

8. MYYNTILUVAN NUMERO

19293

**9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ /
UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

[Päivämäärä]

10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

21.11.2006