ИНСТРУКЦИЯПО ПРИМЕНЕНИЮ
ТАМСОЛ®
TAMSOL®

Торговое название препарата:Тамсол®(Tamsol®)
Действующее вещество (МНН):тамсулозин (tamsulosin)
Лекарственная форма: капсулы с модифицированным высвобождением
Состав:
Одна капсула с модифицированным высвобождением содержит:
*активное вещество:*тамсулозина гидрохлорид – 0,4 мг;
вспомогательные вещества:
*содержимое капсулы:*кальция стеарат, триэтилацетат, тальк, 30% дисперсия метакриловой кислоты– сополимерэтакрилата 1:1 (включая: полисорбат 80, натрия лаурилсульфат), целлюлоза микрокристаллическая.
*оболочка капсулы:*железа оксид жёлтый (Е172), железа оксид чёрный (Е172), железа оксид красный (Е172), титана диоксид (Е171), желатин.
Описание: Оболочка капсул: размер № 2; крышечка: стандартного коричневого цвета, непрозрачная С015 (код: 08.015), корпус: непрозрачный коричнево-желтого цвета С006 (код: 35.006).
Фармакотерапевтическая группа: Средства для лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Антагонистыальфа-адренорецепторов.
Код АТХ: G04CA02

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Механизм действия
Тамсулозин является селективным конкурентным ингибитором постсинаптических альфа1-адренорецепторов, препарат обладает сродством к альфа1А и альфа1D подтипам, связывание тамсулозина с этими рецепторами расслабляет гладкие мышцы предстательной железы и мочеиспускательного канала.
Фармакодинамические эффекты
Тамсулозин повышает максимальную скорость потока мочи. Ослабляя выраженность обструкции путем снижения тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы и мочеиспускательного канала, тамсулозин уменьшает «симптомы опорожнения».
Кроме того, препарат уменьшает выраженность «симптомов наполнения», в развитии которых важную роль играет нестабильность мочевого пузыря.
При долгосрочной терапии тамсулозином достигается стабильное уменьшение выраженности симптомов наполнения и опорожнения. Таким образом, при лечении препаратом можно отсрочить необходимость проведения операции или процедуры катетеризации мочевого пузыря.
Альфа1-адреноблокаторы могут снизить артериальное давление, уменьшая периферическое сосудистое сопротивление. Во времяпроведения клинических исследований тамсулозина значимого снижения артериального давления не отмечалось.
Исследования применения у детей и подростков до 18 лет
Эффективность тамсулозина изучена в ходе двойного слепого, рандомизированного, плацебо-контролируемого исследования по подбору дозы у детей и подростков с нейрогенной дисфункцией мочевого пузыря (n=161). Детей в возрасте от двух до шестнадцати лет случайным образом разделили на четыре группы: пациенты первой группы получали тамсулозин в низких дозах (0,001-0,002 мг/кг), пациенты второй группы – в средних дозах (0,002-0,004 мг/кг), пациенты третьей группы – в высоких дозах (0,004-0,008 мг/кг), а пациенты четвертой группы получали плацебо.Первичной конечной точкой оценки эффективности было количество пациентов, у которых достигнуто

уменьшение детрузорного давления в точке утечки (ДТУ) до < 40 см H_2O по данным двух измерений, выполненных в один и тот же день. Дополнительные критерии оценки эффективности включали изменения фактического значения ДТУ и процентное изменение детрузорного давления в точке утечки; уменьшение выраженности или отсутствие прогрессирования гидронефроза/гидроуретера, изменение объема мочи, полученной при катетеризации, а также количество случаев недержания мочи на фоне катетеризации (по дневнику катетеризации). Статистических различий между каждой из групп тамсулозина и плацебо по первичным и вторичным конечным точкам не получено. На всех уровнях дозирования зависимости эффекта от дозы не наблюдалось.

Фармакокинетика

Всасывание

Тамсулозин всасывается в тонкой кишке, биодоступность препарата близка к 100%.

Одновременный приём с пищей снижает биодоступность тамсулозина.

Обеспечить постоянство условий всасывания препарата можно, рекомендовав пациенту принимать тамсулозин после одного и того же приёма пищи.

Фармакокинетические показатели тамсулозина имеют линейный характер.

После однократного приёма тамсулозина натощак пиковая плазменная концентрация тамсулозина достигается приблизительно через 6 часов.Для достижения стабильной концентрации препарата (равновесного состояния) требуется приблизительно 5 дней многократного приёма препарата, при этом C_{max} у пациентов приблизительно на 2/3 выше, чем достигается при однократном приёме препарата. Несмотря на то, что эта закономерность отмечена у пожилых людей, ожидается, что приём препарата молодыми людьми будет сопровождаться сходными изменениями.

Для плазменной концентрации препарата после однократного и многократного приёма характерны выраженные индивидуальные различия.

Распределение и связывание с белками плазмы крови

В организме человека тамсулозин приблизительно на 99% связывается с белками плазмы. Объём распределения препарата невелик (около 0,2 л/кг).

Метаболизм

Тамсулозин имеет низкий эффект первого прохождения, метаболизируется медленно. Большая часть тамсулозина присутствует в плазме в виде неизмененного активного вещества. Препарат метаболизируется в печени.

В исследованиях на крысах тамсулозин вызывал индукцию ферментов печени.

По данным исследований в условиях *in vitro*, тамсулозин метаболизируется при участии CYP3A4 и CYP2D6 и, в гораздо меньшей степени, других изоферментов системы цитохрома P450. При ингибировании изоферментов CYP3A4 и CYP2D6 может повышаться концентрация тамсулозина гидрохлорида в сыворотке крови (см. разделы «Особые указания» и «Лекарственныевзаимодействие»). Ни один из метаболитов не обладает активностью, превышающей активность самого действующего вещества препарата.

Выведение

Тамсулозин и его метаболиты преимущественно выделяются с мочой, при этом доля неизмененного препарата составляет около 9%.

Было установлено, что после однократного приёма тамсулозина после приёма пищи и после достижения устойчивого (равновесного) состояния время полувыведения препарата составляет приблизительно 10 и 13 часов, соответственно.

Показания к применению

Лечение дизурических расстройств при доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ).

Способ применения и дозы
Капсулы для приема внутрь.
Капсулу глотают целиком, запивая водой. Нельзя разжевывать или разламыватькапсулу, так как это может повлиять на скорость высвобождения препарата.
Режим дозирования:
Одна капсула в сутки, после завтрака или первого приёма пищи.
Дети и подростки до 18 лет
Применение препарата в данной возрастной категории не обосновано.
Безопасность и эффективность применения тамсулозина у детей и подростков до 18 летне установлена.
Имеющиеся данные о применении препарата у детей и подростков представлены в разделе «Фармакодинамика».
Пациенты с нарушением функции почек
Коррекции дозы не требуется.
Пациенты с нарушением функции печени
При нарушениях функции печени легкой и средней степени тяжести коррекции дозы не требуется (см. также раздел «Противопоказания»).

Побочные действия

Группировочные названия	Часто (от ≥1/100 до<1/10)	Нечасто (от ≥1/1 000 до<1/100)	Редко От 1/10 000 до<1/1 000)	Очень редко (<1/10 000)	*Частота неизвестна (невозможно установить по имеющимся данным)*
Нарушения со стороны нервной системы	Головокружение(1,3 %)	Головная боль	Синкопе		
Нарушения со стороны органа зрения					Нечеткость зрения*, нарушения зрения*
Нарушения со стороны сердца		Ощущение сердцебиения			
Нарушения со стороны сосудистой системы		Ортостатическая гипотензия			
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения		Ринит			Носовые кровотечения*

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта		Запоры, диарея, тошнота, рвота			Сухость во рту*
Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки		Сыпь, кожный зуд, крапивница	Ангионевротический отёк	Синдром Стивенса-Джонсона	Многоформная эритема* Эксфолиативный дерматит*
Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочной железы	Нарушения эякуляции			Приапизм	Ретроградная эякуляция, отсутствие эякуляции
Общие расстройства и нарушения в месте введения		Астения			

*Случаи, о которых сообщалось в пострегистрационном периоде

Во время операции по поводу катаракты или глаукомы отмечалось развитие синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка), что было отмечено в постмаркетинговых наблюдениях (см. также раздел «Меры предосторожности»).

Опыт пострегистрационного применения препарата

Помимо вышеперечисленных нежелательных явлений, при пострегистрационном применении тамсулозина зафиксированы следующие реакции: мерцание предсердий, аритмия, тахикардия и одышка. Поскольку эти случаи описаны в спонтанных сообщениях, поступивших из различных стран, частоту таких НПР и причинно-следственную связь с приемом тамсулозина точно установить невозможно.

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу, включая развитие лекарственного ангионевротического отёка, или к какому-либо из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе «Состав».

Ортостатическая гипотензия в анамнезе.

Тяжелая печёночная недостаточность.

Лекарственныевзаимодействия

Исследования по взаимодействию с другими лекарственными препаратами проводились только у взрослых.

Не было отмечено неблагоприятных лекарственных взаимодействий при назначении тамсулозина одновременно с атенололом, эналаприлом или теофиллином.

Одновременный приём препарата с циметидином приводит к повышению концентрации тамсулозина в плазме крови, а приём с фуросемидом – к снижению плазменной концентрации препарата, однако при этом концентрации остаются в пределах допустимого уровня. Таким образом, коррекции дозы в таких случаях не требуется.

В условиях*invitro*диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадинон, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не влияют на уровень свободной фракции тамсулозина в плазме крови человека. Тамсулозин, в свою очередь, не влияет на свободную фракцию диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона.
Однако диклофенак и варфарин могут повышать скорость выведения тамсулозина.
При одновременном применении тамсулозина гидрохлорида с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 может повышаться концентрация тамсулозина гидрохлорида в плазме крови.
При одновременном применениитамсулозина с кетоконазолом (сильный ингибитор изофермента CYP3A4) показатели AUC и C_{max}тамсулозинавозрастали в 2,8 раза и 2,2 раза, соответственно.
Рекомендуется избегать совместного применения тамсулозина гидрохлорида и сильных ингибиторов изофермента CYP3A4 у пациентов с замедленным метаболизмом субстратов CYP2D6. Тамсулозина гидрохлорид с осторожностью назначают совместно с сильными (например, кетоконазол) и умеренными (например, эритромицмин) ингибиторами изофермента CYP3A4.
При одновременном назначениитамсулозинаспароксетином (сильный ингибитор CYP2D6) показателиC_{max} и AUC тамсулозинавозрастали в 1,3 и 1,6 раза соответственно, однако данное увеличение признано клинически незначимым.
Одновременное назначение других антагонистов α1-адренорецепторов может привести к снижению артериального давления.

Особые указания
Как и при приёме других альфа1-адреноблокаторов, приём тамсулозина у отдельных лиц может сопровождаться снижением артериального давления и, в редких случаях, развитием коллапса, что вызвано кратковременным снижением артериального давления. При появлении первых признаков ортостатической гипотензии (головокружение, общая слабость) рекомендуется сесть или перейти в горизонтальное положение, пока не исчезнут эти симптомы.
До начала лечения тамсулозином пациент должен быть обследован для исключения состояний, которые могут вызывать симптомы, имитирующие симптомы гиперплазии предстательной железы.
До начала лечения, а также регулярно во время терапии препаратом, показано проведение пальцевого ректального обследования, а также определение уровня простатспецифического антигена (ПСА) по необходимости.
При лечении пациентов с тяжёлой почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) необходимо соблюдать осторожность, т.к. применение препарата у этой группы пациентов не изучалось.
У отдельных пациентов, получавших тамсулозин до операции или на момент оперативного вмешательства по поводу катаракты или глаукомы, отмечался синдром интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка (IFIS)). IFIS может привести к повышению частоты интра- и послеоперационных осложнений со стороны органа зрения.
Получены отдельные данные о благоприятном эффекте предварительной отмены тамсулозина за 1-2 недели до проведения операций по поводу катаракты или глаукомы, однако доказательств положительного влияния отмены препарата в этих случаях пока не получено. Кроме того, у некоторых пациентов IFIS развивался, даже если тамсулозин отменяли раньше, чем за 1-2 недели до операции по поводу катаракты.
Перед планируемым оперативным лечением катаракты или глаукомы терапию тамсулозином начинать не следует. Офтальмологи и офтальмохирурги должны выяснять у пациентов, которым планируется хирургическое лечение катаракты или глаукомы, не принимают ли они и не принимали ли они ранее тамсулозин, для того, чтобы принять

адекватные меры в предоперационной подготовке пациента и во время оперативного вмешательства.
Рекомендуется избегать совместного применения тамсулозина гидрохлорида и сильных ингибиторов изофермента CYP3A4 у пациентов с замедленным метаболизмом субстратов CYP2D6.
Тамсулозина гидрохлорид с осторожностью назначают совместно с сильными (например, кетоконазол) и умеренными (например, эритромицин) ингибиторами изофермента CYP3A4 (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).
Применение при беременности и в период грудного вскармливания
Тамсулозин не назначают женщинам.
В ходе краткосрочных и долгосрочных клинических исследований сообщалось о нарушениях эякуляции при приеме тамсулозина. Кроме того, в период пострегистрационного применения зафиксированы случаи ретроградной эякуляции или отсутствия эякуляции.
Влияние на способность к управлению транспортными средствами и на работу с механизмами:
Исследования влияния на способность к управлению транспортными средствами и механизмами не проводились. Однако пациенты должны проявлять осторожность в связи с возможностью развития головокружения.
Препарат следует хранить в не доступном для детей месте и не применять после истечения срока годности.

Передозировка
Симптомы:
При передозировке тамсулозина гидрохлорида возможно выраженное снижение артериального давления. Подобный эффект наблюдали при передозировке различной степени тяжести.
Максимальная доза тамсулозина гидрохлорида, принятая при непреднамеренной передозировке, составила 12 мг. При этом у пациента развилась выраженная головная боль, не потребовавшая госпитализации.
Лечение:
При острой артериальной гипотензии следует обеспечитьподдержкуфункциисердечно-сосудистойсистемы. Перевод пациента в горизонтальное положение может восстановить нормальное артериальное давление и частоту сердечных сокращений. При неэффективности этих мероприятий возможно проведение мер, направленных на увеличение объёма циркулирующей крови, а также введение вазопрессоров. Необходимы оценка функции почек в динамике и проведение поддерживающей терапии.
В связи с тем, что тамсулозин активно связывается с белками, гемодиализ, вероятно, неэффективен. Целесообразно проведение мероприятий, направленных на уменьшение абсорбции препарата из ЖКТ, в частности, инициация рвоты. Для лечения отравлений большими дозами препарата целесообразно проведение промывания желудка, приём активированного угля или осмотических слабительных, таких как натрия сульфат.

Форма выпуска
10 капсул в блистере из ПВХ/ПВДХ-алюминиевой фольги.
Один или три блистера в картонной коробке с инструкцией по применению.

Условия хранения
Хранить при температуре не выше 30°С, в оригинальной упаковке для защиты от воздействия света.

Срок годности
3 года.

Условия отпуска из аптек
По рецепту.

Информация о производителе
Гедеон Рихтер Румыния А.О., Тыргу Муреш, Румыния, для
ОАО «Гедеон Рихтер», Будапешт, Венгрия

Компания, представляющая интересы производителя и заявителя:
ОАО «Гедеон Рихтер»
1103 Будапешт, ул. Дёмрёи, 19-21, Венгрия
Телефон горячей линии (звонок бесплатный): 7-800-555-00777
Электронный адрес: drugsafety@g-richter.ru

Наименование и адрес организации, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан
Представительство ОАО «Гедеон Рихтер»
100015, г.Ташкент, ул.Нукус, 71, 5-й этаж
Тел.: (99871) 1479042
E-mail: gedeon@gr.uz