ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ТУЛОЗИН

Регистрационный номер
Торговое название препарата: ТУЛОЗИН
Международное непатентованное название: тамсулозин
Лекарственная форма : капсулы с модифицированным высвобождением
Состав: 0,4 мг активного вещества тамсулозина гидрохлорида, вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция стеарат, сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата (в форме 30% водного дисперсионного раствора), Твин 80 (Полисорбат 80), триэтилцитрат, тальк
Оболочка капсулы: индигокармин, хинолиновый желтый, титана диоксид, желатин

Описание: Твердые желатиновые капсулы самозакрывающиеся, с прозрачным основанием зеленого цвета (код цвета: 13009) и непрозрачной крышкой зеленого цвета (код цвета: 17026). Пеллеты почти белого цвета, без запаха или почти без запаха.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА
Фармакотерапевтическая группа: альфа 1-адреноблокатор
Код АТХ : G04 CA02

Фармакодинамика
Тамсулозин избирательно и конкурентно блокирует постсинаптические a_{1A}-адренорецепторы, находящиеся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры, а также a_{1D}-адренорецепторы, преимущественно находящиеся в теле мочевого пузыря. Это приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и улучшению функции детрузора. За счет этого уменьшаются симптомы обструкции и раздражения, связанные с доброкачественной гиперплазией предстательной железы. Как правило, терапевтический эффект развивается через 2 недели после начала приема препарата, хотя у ряда пациентов уменьшение выраженности симптомов отмечается после приема первой дозы. Способность тамсулозина воздействовать на a_{1A}-адренорецепторы в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с a_{1B}-адренорецепторами, которые расположены в гладких мышцах сосудов. Благодаря такой высокой селективности препарат не вызывает какого-либо клинически значимого снижения системного артериального давления (АД) как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальным исходным АД.

Фармакокинетика
Всасывание:
После приема внутрь тамсулозин быстро и практически полностью абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность препарата - около 100%.
После однократного приема препарата внутрь C_{max} активного вещества в плазме достигается через 6 ч.
Сразу после приема пищи всасывание тамсулозина снижается. Равномерность всасывания возрастает, если пациент принимает препарат каждый день после одного и того же приема пищи.

Передозировка
Случаи острой передозировки не описаны.
Симптомы: теоретически возможно возникновение острой гипотензии.
Лечение: пациента следует уложить, чтобы восстановить артериальное давление и нормализовать частоту сердечных сокращений. Проводят кардиотропную терапию. Следует следить за функцией почек и применять общую поддерживающую терапию..
Если симптомы остаются, следует ввести объемозамещающие растворы или сосудосуживающие препараты. Для предотвращения дальнейшей абсорбции тамсулозина возможно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного. Диализ не эффективен, поскольку тамсулозин прочно связывается с белками плазмы крови

Взаимодействие с другими лекарственными средствами
Одновременное применение циметидина повышает уровень тамсулозина в плазме крови; фуросемид снижает его уровень в плазме крови. Однако в обоих случаях эти уровни остаются в пределах терапевтически активных уровней и дозировку изменять не следует.
Диклофенак и непрямые антикоагулянты несколько увеличивают скорость выведения тамсулозина.
Одновременное применение тамсулозина с другими альфа$_1$-адреноблокаторами и другими препаратами, снижающими артериальное давление, может привести к выраженному усилению гипотензивного эффекта.

Не обнаружено взаимодействия при одновременном применении тамсулозина с атенололом, эналаприлом, нифедипином или теофиллином.
Концентрация тамсулозина в плазме крови не изменялась в присутствии диазепама, трихлорметиазида, амитриптилина, диклофенака, глибенкламида, симвастатина или варфарина. Также тамсулозин не изменял концентрации диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона.

Особые указания
Тамсулозин следует применять с осторожностью у больных с предрасположенностью к ортостатической гипотензии, так как и в случае приема других альфа-1 блокаторов, у некоторых больных во время курса лечения может снизиться артериальное давление, что иногда может привести к обморочному состоянию. При появлении первых признаков ортостатической гипотензии (головокружение или слабость) пациента следует усадить или уложить до исчезновения симптомов.
Прежде чем начать терапию препаратом, пациент должен быть обследован, с тем чтобы исключить наличие др. заболеваний, которые могут вызывать такие же симптомы, как и доброкачественная гиперплазия простаты. Перед началом лечения и регулярно во время терапии должно выполняться пальцевое ректальное обследование и, если требуется, определение специфического антигена простаты (PSA).
У больных с выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) препарат следует применять с осторожностью, т.к. эта группа пациентов не была исследована.

В равновесном состоянии (через 5 дней курсового приема) значения Cmax активного вещества в плазме крови на 60-70% выше, чем Cmax после однократного приема препарата.

Распределение:
Связывание с белками плазмы - 99%. Тамсулозин имеет незначительный объем распределения (приблизительно 0.2 л/кг).
Метаболизм:
Тамсулозин практически не подвергается эффекту "первого прохождения" и медленно биотрансформируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов, сохраняющих высокую селективность к a1A-адренорецепторам. Ни один из метаболитов не является более активным, чем исходное вещество. Большая часть активного вещества присутствует в крови в неизмененном виде.
При печеночной недостаточности уточнение дозы не требуется.
Выведение:
Тамсулозин и его метаболиты в основном выводятся почками, причем примерно 9% дозы выводится в неизмененном виде.
$T_{1/2}$ тамсулозина при однократном приеме - 10 ч, после многократного приема - 13 ч, конечное время полувыведения - 22 ч.
При нарушении функции почек дозу препарата уточнять не требуется.

Показания
Лечение функциональных симптомов доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ).

Противопоказания
Гиперчувствительность к тамсулозину гидрохлориду или любому другому компоненту препарата.
С осторожностью: хроническая почечная недостаточность (снижение клиренса креатинина ниже 10 мл/мин), артериальная гипотензия (в т. ч. ортостатическая), тяжёлая печёночная недостаточность.

Способ применения и дозы
Внутрь, после еды.
По 400 мкг (1 капсула) в сутки.
Капсулы принимают после первого приема пищи, запивая достаточным количеством воды. Капсулу не следует разламывать и разжевывать.

Побочные эффекты
Наиболее часто встречающиеся побочные эффекты (1-10%): головокружение, сонливость или бессонница
Редкие (0,1-1%): головная боль, снижение остроты зрения, ринит, тошнота, рвота, диарея или запор, ретроградная эякуляция, астения, снижение либидо, боль в спине.
Крайне редкие (0,01-0,1%): ортостатическая гипотензия, тахикардия, усиленное сердцебиение, боль в грудной клетке, обмороки, реакции гиперчувствительности (кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек).
Единичные (< 0,01%): приапизм.

Влияние на способность вождения транспортных средств и управления механизмами
В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска
Капсулы с модифицированным высвобождением 0,4 мг. По 10 капсул в блистере из ПВХ/ПВДХ/ал.фольга. 1 или 3 блистера вместе с инструкцией по медицинскому применению в картонной пачке.

Срок хранения
15 месяцев. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения
Хранить при температуре ниже 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска из аптек
По рецепту

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ ОАО Фармацевтический завод ЭГИС
1106 Будапешт, ул. Керестури, 30-38 ВЕНГРИЯ
Телефон: (36-1)265-5555 Факс: (36-1)265-5529
Представительство ОАО "Фармацевтический завод ЭГИС" (Венгрия) г.Москва
123242, г. Москва, ул. Красная Пресня 1-7, телефон: (495) 363-39-66

И.О. Директора ИДКЭЛС, профессор С.В.БУДАНОВ

Представитель фирмы: Е.В. Творогова