МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ТАМЗЕЛИН®

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 000620-251016
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер

Торговое наименование

Тамзелин®

Международное непатентованное наименование

Тамсулозин

Лекарственная форма

Капсулы пролонгированного действия

Состав на одну капсулу

Действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид пеллеты 0,15 % 267 мг, содержащие тамсулозина гидрохлорид 0,4 мг.

Вспомогательные вещества пеллет: сахароза – 143,36 мг, крахмал – 95,58 мг, этилцеллюлоза – 3,74 мг, гипромеллоза – 2,56 мг, повидон К-30 – 1,5 мг, коповидон (пласдон S-630) – 2,54 мг, гипромеллозы фталат – 10,4 мг, цетиловый спирт – 1,0 мг, диэтилфталат – 0,35 мг, тальк – 5,47 мг.

Состав капсулы желатиновой:

Желатин – 62,306465 мг

Крышка:

Красители:

Бриллиантовый черный – 0,0065 мг

Синий патентованный – 0,00715 мг

Хинолиновый желтый – 0,00871 мг

Железа оксид желтый – 0,071175 мг

Титана диоксид – 1,3 мг

Основание:

Красители:

Титана диоксид – 1,3 мг

Описание

Желатиновые капсулы № 2 с белым корпусом, светло-зеленой крышкой. Содержимое капсул – белые или почти белые сферические пеллеты.

Фармакотерапевтическая группа

Альфа1-адреноблокатор.

Код АТХ: G04CA02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тамсулозин является специфическим блокатором постсинаптических α_1-адренорецепторов, находящихся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры. Блокада α_1-адренорецепторов приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и улучшению оттока мочи. Одновременно уменьшаются как симптомы опорожнения, так и симптомы наполнения мочевого пузыря, обусловленные повышенным тонусом гладкой мускулатуры и детрузорной гиперактивностью при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Способность тамсулозина воздействовать на α_{1A} подтип адренорецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с α_{1B} подтипом адренорецепторов, которые расположены в гладких мышцах сосудов.

Благодаря своей высокой селективности, тамсулозин не вызывает клинически значимого снижения системного артериального давления (АД) как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальными показателями АД.

Фармакокинетика

Всасывание

Тамсулозин практически полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта и обладает почте 100 % биодоступностью. Всасывание тамсулозина несколько уменьшается после приема пищи.

Одинаковый уровень всасывания может быть достигнут в том случае, если пациент каждый раз принимает препарат после обычного завтрака. Тамсулозин характеризуется линейной кинетикой. При приеме первичной дозы тамсулозина после еды максимальная концентрация (C_{max}) препарата в плазме крови достигается через 6 ч.

Распределение

Связь с белками плазмы крови – 99 %, объем распределения – 0,2 л/кг.

Метаболизм

Тамсулозин в незначительной степени и медленно подвергается первичному метаболизму в печени. Большая часть препарата присутствует в крови в неизмененном виде.

Результаты исследования *in vitro* показали, что изоферменты CYP3A4, а также CYP2D6 участвуют в метаболизме тамсулозина гидрохлорида, с возможным менее значительным воздействием со стороны других изоферментов. Ингибирование метаболизирующих препарат ферментов CYP3A4 и CYP2D6 может привести к повышению уровня воздействия тамсулозина гидрохлорида.

При незначительной и умеренной степени печеночной недостаточности не требуется коррекция режима дозирования препарата.

Выведение

Тамсулозин и его метаболиты экскретируются, главным образом, почками, около 9 % дозы выводится в неизмененном виде.

Период полувыведения ($T_{1/2}$) препарата составляет 10-13 ч.

При почечной недостаточности не требуется снижения дозы препарата, при наличии у пациента тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина (КК) менее 10 мл/мин) назначение тамсулозина необходимо проводить с осторожностью.

Показания к применению

Лечение дизурии, связанной с доброкачественной гиперплазией предстательной железы.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к тамсулозину или любому вспомогательному компоненту препарата.

Тяжелая печеночная недостаточность.

Ортостатическая гипотензия (в т.ч. в анамнезе).

Детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Тяжелая почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин).

Артериальная гипотензия.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Тамсулозин не показан для применения женщинам.

Способ применения и дозы.

Внутрь, после завтрака. Капсулу рекомендуется не разжевывать, запивать небольшим количеством воды.

Взрослые старше 18 лет, а также пожилые пациенты: по 1 капсуле (0,4 мг) 1 раз в сутки.

Пациенты с нарушением функции печени и почек:

При почечной и печеночной недостаточности легкой и умеренной степени тяжести не требуется коррекция дозы.

Побочное действие

По данным Всемирной Организации Здравоохранения (ВОЗ) нежелательные реакции классифицированы в соответствии с их частотой развития следующим образом: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10000, <1/1000), очень редко (<1/10000); частота неизвестна – по имеющимся данным установить частоту возникновения не представлялось возможным.

Со стороны нервной системы

часто: головокружение;

нечасто: головная боль;

редко: обморок, нарушение сна (сонливость или бессонница).

Со стороны органа зрения

частота неизвестна: неясное зрение, нарушение зрения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы

нечасто: постуральная гипотензия, тахикардия, ощущение сердцебиения;

редко: боль в грудной клетке, мерцательная аритмия.

Со стороны дыхательной системы

нечасто: ринит, одышка;

частота неизвестна: носовое кровотечение.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

нечасто: запор, диарея, тошнота, рвота.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки

нечасто: сыпь, зуд, крапивница;

редко: ангионевротический отек;

очень редко: синдром Стивенса-Джонсона;

частота неизвестна: полиморфная эритема, эксфолиативный дерматит.

Прочее:

часто: нарушения эякуляции, включая ретроградную эякуляцию и эякуляторную недостаточность;

нечасто: астения, боль в спине, синдром узкого зрачка во время операции по поводу катаракты;

очень редко: приапизм, снижение либидо.

В ходе пострегистрационных наблюдений были выявлены случаи синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка) при операции по поводу катаракты и глаукомы глаза у пациентов, принимавших тамсулозин.

В ходе пострегистрационных наблюдений помимо нежелательных явлений, описанных выше, были описаны случаи фибрилляции предсердий, аритмии, тахикардии и диспноэ, связанные с применением тамсулозина. Поскольку данные спонтанные сообщения поступали в рамках исследования после выхода препарата на рынок по всему миру, не представляется возможным с достаточной степенью надежности оценить частоту развития данных явлений и их связь с применением тамсулозина.

Передозировка

Симптомы

Передозировка тамсулозина гидрохлоридом потенциально может привести к острым гипотензивным эффектам. Сообщения о таких эффектах поступали при различных условиях передозировки.

Лечение

В случае передозировки и развития гипотензии рекомендуется перевести больного в горизонтальное положение и провести мероприятия, направленные на поддержание деятельности сердечно-сосудистой системы (восстановление артериального давления и частоты сердечных сокращений); промывание желудка, введение активированного угля и осмотических слабительных средств, таких как натрия сульфат. При отсутствии эффекта следует ввести вещества, увеличивающие объем циркулирующей крови и, при необходимости, сосудосуживающие средства. Следует контролировать функцию почек и

проводить общие поддерживающие меры. Эффективность диализа маловероятна, поскольку тамсулозин в значительной степени связывается с белками плазмы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При одновременном применении с атенололом, эналаприлом и нифедипином не было выявлено лекарственных взаимодействий.

При одновременном применении с циметидином повышается концентрация тамсулозина в сыворотке крови, при назначении фуросемида – снижается. Однако коррекция дозы препарата не требуется, поскольку концентрация тамсулозина остается в терапевтическом диапазоне.

Диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадинон, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не изменяют уровень свободной фракции тамсулозина в плазме крови *in vitro*.

В свою очередь тамсулозин также не изменяет содержание свободных фракций диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона.

Диклофенак и варфарин могут увеличивать скорость выведения тамсулозина.

Одновременное применение с сильными ингибиторами изофермента CYP34A может привести к увеличению концентрации тамсулозина.

Одновременное применение с кетоконазолом приводило к увеличению площади под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) и максимальной концентрации (C_{max}) в 2,8 и 2,2 раза, соответственно.

Тамсулозина гидрохлорид не следует использовать в комбинации с сильными ингибиторами изофермента CYP34A у пациентов с нарушением метаболизма изофермента CYP2D6. Препарат следует использовать с осторожностью в комбинации с сильными умеренными ингибиторами изофермента CYP34A.

Одновременный прием тамсулозина и пароксетина приводит к увеличению площади под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) и максимальной концентрации (C_{max}) в 1,3 и 1,6 раза, соответственно.

Одновременное назначение других антагонистов α_1-адренорецепторов может приводить к усилению гипотензивного эффекта.

Особые указания

Как при использовании других α_1-адреноблокаторов, при лечении тамсулозином в отдельных случаях может наблюдаться снижение артериального давления (АД), которое иногда может привести к обморочному состоянию. При первых признаках

ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) пациент должен сесть или лечь и оставаться в этом положении до тех пор, пока признаки не исчезнут.

При оперативных вмешательствах по поводу катаракты на фоне приема препарата возможно развитие синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка), что необходимо учитывать хирургу при предоперационной подготовке пациента и при проведении операции.

Не рекомендуется начинать терапию тамсулозином у пациентов, которым запланирована операция по поводу катаракты или глаукомы. Во время оперативного обследования перед операцией пациентов хирург или врач-офтальмолог должны учитывать, принимает ли пациент тамсулозин.

Прежде чем начинать терапию препаратом, пациент должен быть обследован с целью исключить наличие других заболеваний, которые могут вызвать такие же симптомы, как и доброкачественная гиперплазия простаты. Пальцевое ректальное обследование и, в случае необходимости, определение содержание специфического антигена простаты следует выполнять перед началом лечения и с регулярными интервалами впоследствии.

Имеются сообщения о случаях развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии α_1-адреноблокаторами. В случае сохранения эрекции в течение четырех часов следует немедленно обратиться за медицинской помощью. Если терапия приапизма не была проведена незамедлительно, это может привести к повреждению тканей полового члена и необратимой утрате потенции.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и выполнении потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Капсулы пролонгированного действия 0,4 мг.

По 10 или 20 капсул в контурную ячейковую упаковку.

1, 3, 6 контурных ячейковых упаковок по 10 капсул или 3, 5 контурных ячейковых упаковок по 20 капсул с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

По 60, 100 капсул в банки полимерные. Каждую банку с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять после срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии:

ООО «Велфарм»

125373, Россия, г. Москва, б-р Яна Райниса, д. 43, корп. 1, пом. II, комн. 4, этаж 2

Тел.: (495) 999-82-78

E-mail: info@velfarm.ru

Производитель

Открытое акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»)

640008, Россия, г. Курган, пр. Конституции, д. 7.

Тел./факс: (3522) 48-16-89.

E-mail: real@kurgansintez.ru

Интернет-сайт: http://www.kurgansintez.ru

Генеральный директор
ООО «Велфарм» Е.А. Соцкова