

## ИНСТРУКЦИЯ

**по медицинскому применению лекарственного препарата**

## ТАМСУЛОЗИН

**Регистрационный номер:** ЛП-007900

**Торговое наименование:** Тамсулозин

**Международное непатентованное наименование:** тамсулозин

**Лекарственная форма:** капсулы с пролонгированным высвобождением

**Состав:**

1 капсула содержит:

тамсулозин пеллеты 0,2 % - 200,0 мг.

*Состав пеллет:*

*Действующее вещество:* тамсулозина гидрохлорид – 0,4 мг.

*Вспомогательные вещества:* сахарные сферы (сахароза – 99 %, гипромеллоза – 1 %) – 190,0 мг; метакриловой кислоты и метакрилата сополимер [1:1] (метакриловой кислоты сополимер) – 4,8 мг; этил-целлюлоза – 4,0 мг; макрогол (полиэтиленгликоль) – 0,8 мг.

*Состав корпуса капсулы:* краситель железа оксид черный – 0,0500 %; титана диоксид – 2,0000 %; желатин – до 100 %.

*Состав крышечки капсулы:* краситель железа оксид желтый – 0,1000 %; титана диоксид – 2,0000 %; желатин – до 100 %.

**Описание**

Капсулы твердые желатиновые № 2. Корпус капсулы светло-серого цвета, крышечка светло-желтого со светло-коричневым оттенком цвета, непрозрачные. Содержимое капсул – пеллеты белого или почти белого цвета.

**Фармакотерапевтическая группа:** α<sub>1</sub>-адреноблокатор.

**Код АТХ:** G04CA02

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Тамсулозин является специфическим блокатором постсинаптических α<sub>1</sub>-адренорецепторов, находящихся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры. Блокада α<sub>1</sub>-адренорецепторов тамсулозином приводит к снижению тонуса гладких мышц 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<sub>1А</sub> подтип адренорецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с α<sub>1В</sub> 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 хорошо всасывается в кишечнике и обладает почти 100 % биодоступностью. Всасывание тамсулозина несколько замедляется после приема пищи. Равномерность абсорбции может быть достигнута в том случае, если пациент каждый раз принимает препарат после обычного завтрака. Тамсулозин характеризуется линейной кинетикой. После однократного приема внутрь 0,4 мг препарата его максимальная концентрация в плазме достигается через 6 часов. После многократного приема внутрь 0,4 мг в день равновесная концентрация достигается к 5-му дню, при этом ее значение примерно на 2/3 выше значения этого параметра после приема однократной дозы.

*Распределение*

Связь с белками плазмы – 99 %, объем распределе­ния небольшой (около 0,2 л/кг).

*Метабализм*

Тамсулозин не подвергается эффекту "первого прохождения" и медленно метаболизируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов. Большая часть тамсулозина представлена в плазме крови в неизменной форме. В эксперименте выявлена способность тамсулозина незначительно индуцировать активность микросомальных ферментов печени.

*Выведение*

Тамсулозин и его метаболиты главным образом выводятся почками, при этом приблизительно около 9 % тамсулозина выделяется в неизменном виде. Период полувыведения препарата при однократном приеме 0,4 мг после еды составляет 10 часов, при многократном -13 часов.

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

**Показания к применению**

Лечение дизурических расстройств, связанных с доброкачественной гиперплазией предстательной железы (ДГПЖ).

**Противопоказания**

- Гиперчувствительность к тамсулозину и/или к любому из вспомогательных веществ в составе препарата, в том числе, наличие лекарственного ангионевротического отека в анамнезе.
- Ортостатическая гипотензия (в т.ч. в анамнезе).
- Печеночная недостаточность тяжелой степени.
- Непереносимость фруктозы, дефицит сахаразы/ изомальтазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции.
- Возраст до 18 лет.

**С осторожностью**

У пациентов с почечной недостаточностью в терминальной стадии (клиренс креатинина менее 10 мл/мин), артериальной гипотензией.

**Применение во время беременности и в период грудного вскармливания**

Тамсулозин не показан к применению у женщин.

**Способ применения и дозы**

Внутрь. Принимают по 1 капсуле (0,4 мг) 1 раз в сутки после завтрака, запивая водой. Капсулу не разжевывать, так как это может повлиять на скорость высвобождения тамсулозина.

*Применение препарата в особых клинических группах пациентов*

*У детей и подростков до 18 лет*

Тамсулозин не показан к применению у детей и подростков до 18 лет.

*У пожилых пациентов*

Коррекции дозы тамсулозина не требуется.

*У пациентов с нарушением функции почек*

У пациентов с почечной недостаточностью коррекция дозы не требуется. При применении тамсулозина у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности (клиренс креатинина < 10 мл/мин) следует соблюдать меры предосторожности.

*У пациентов с нарушением функции печени*

У пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести коррекции дозы не требуется. Применение тамсулозина у пациентов с печеночной недостаточностью тяжелой степени противопоказано.

**Побочное действие**

Представленные ниже нежелательные реакции, возможные на фоне терапии тамсулозином, распределены по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения: *очень часто* (≥1/10), *часто* (≥1/100, <1/10), *нечасто* (≥1/1000, <1/100), *редко* (≥1/10000, <1/1000), *очень редко* (<1/10000, включая единичные случаи), *частота неизвестна* (недостаточно данных для оценки частоты развития).

Системно-органный класс	Частота				
	Часто	Нечасто	Редко	Очень редко	Частота неизвестна
Нарушения со стороны нервной системы	голово­кружение (1,3%)	головная боль	обморок	–	–
Нарушения со стороны сердца	–	ощуще­ние сердцебиения	–	–	–
Нарушения со стороны сосудов	–	ортоста­тическая гипотензия	–	–	–
Нарушения со стороны дыха­тельной системы, органов грудной клетки и средо­стения	–	ринит	–	–	носовое крово­течение
Нарушения со стороны желу­дочно-кишечного тракта	–	запор, диарея, тошнота, рвота	–	–	сухость во рту
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	–	кожная сыпь, кожный зуд, крапив­ница	ангио­невротический отек	синдром Стивен­са-Джонсо­на	много­формная эритема, эксфолиа­тивный отек
Нарушения со стороны половых органов и грудной железы	нарушение эякуляции, включая ретроград­ную	–	–	приапизм	–

	эякуляцию и анэяку­ляцию				
Нарушение со стороны органа зрения	–	–	–	–	нечеткое зрение, ухудшение зрения
Общие наруше­ния и реакции в месте введения	–	астения	–	–	–

Описаны случаи интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром «узкого зрачка») при операции по поводу катаракты и глаукомы у пациентов, принимавших тамсулозин.

*Пострегистрационное применение*

Помимо нежелательных реакций, описанных выше, при применении тамсулозина наблюдались фибрилляция предсердий, аритмия, тахикардия и одышка. В связи с тем, что данные были получены методом спонтанных сообщений в пострегистрационном периоде применения тамсулозина, определения частоты и причинно-следственной связи данных нежелательных реакций с приемом тамсулозина представляется затруднительным.

**Передозировка**

*Симптомы*

Передозировка тамсулозина может вызвать серьезное снижение артериального давления и компенсаторную тахикардию.

*Лечение*

Симптоматическое. АД и частота сердечных сокра­щений могут восстановиться при принятии пациен­том горизонтального положения. При отсутствии эффекта можно применить средства, увеличиваю­щие объем циркулирующей крови, и, если необ­ходимо, сосудосуживающие средства. Необходимо контролировать функцию почек. Проведение гемо­диализа нецелесообразно, так как тамсулозин в значительной степени связывается с белками плазмы крови. Для предотвращения дальнейшего всасы­вания препарата целесообразно промывание желу­дка, применение сорбентов (активированного угля) и осмотических слабительных.

**Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

При применении тамсулозина вместе с атенололом, эналаприлом, нифедипином и теофилином лекар­ственного взаимодействия обнаружено не было.

При одновременном применении тамсулозина с ци­метидином отмечено некоторое повышение концен­трации тамсулозина в плазме крови, с фуросемидом - снижение концентрации, однако это не требует коррекции дозы, так как концентрация тамсулозина остается в пределах нормального диапазона.

Диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлорма­динон, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не изменяют свободную фракцию тамсулозина в плазме крови человека in vitro. В свою очередь, тамсулозин также не изменяет свободные фракции диазепама, пропра­нолола, трихлорметиазида и хлормадинона.

Диклофенак и варфарин могут увеличивать скорость выведения тамсулозина.

В исследованиях in vitro не было обнаружено взаимодействия на уровне печеночного метабо­лизма с амитриптилином, салбутамолом, глибен­кламидом и финастеридом. Одновременное назна­чение тамсулозина с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 может привести к увеличению концентрации тамсулозина. Одновременное приме­нение с кетоконазолом (сильный ингибитор изофермента CYP3A4) приводило к увеличению площади под фармакокинетической кривой «концен­трация-время» (AUC) и максимальной концентрации (C<sub>max</sub>) тамсулозина в 2,8 и 2,2 раза, соответственно. Тамсулозин не следует применять в комбинации с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 у пациентов с нарушением метаболизма изофер­мента CYP2D6. Препарат следует использовать с осторожностью в комбинации с сильными и средней активности ингибиторами изофермента CYP3A4. Одновременное назначение тамсулозина и пароксе­тина, сильного ингибитора изофермента CYP2D6, приводило к увеличению C<sub>max</sub> и AUC тамсулозина в 1,3 и 1,6 раза, соответственно, однако данное увеличение признано клинически незначимым. Одно­временное применение тамсулозина с другими блокаторами α<sub>1</sub>-адренорецепторов может привести к снижению артериального давления.

**Особые указания**

Как и при применении других α<sub>1</sub>-адреноблокаторов, на фоне терапии тамсулозином в отдельных случаях может наблюдаться снижение артериального дав­ления, которое иногда может приводить 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.

Перед началом терапии тамсулозином пациент должен быть обследован с целью исключения других заболеваний, которые могут вызывать такие же симптомы, как и ДГПЖ.

Перед началом лечения и регулярно во время терапии должно выполняться пальцевое ректальное обследование и, при необходимости, определение простатического специфического антигена (ПСА).

Так как клинических исследований тамсулозина у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени не проводилось, применение препарата у пациентов с клиренсом креатинина менее 10 мл/мин требует соблюдения мер предосторожности.

У некоторых пациентов, принимающих или ранее принимавших тамсулозин, во время проведения оперативных вмешательств по поводу катаракты или глаукомы возможно развитие синдрома интра­операционной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром «узкого зрачка»), который может привести к осложнениям во время операции или в послеоперационном периоде. Целесообразность отмены терапии тамсулозином за 1-2 недели до операции по поводу катаракты или глаукомы не доказана. Случаи интраоперационной нестабиль­ности радужной оболочки глаза имели место у пациен­тов, прекративших прием препарата и в более ранние сроки перед операцией. Не рекомен­дуется начинать терапию тамсулозином у паци­ентов, которым запланирована операция по поводу катаракты или глаукомы. Во время предопера­ционного обследования пациентов хирург и врач-офтальмолог должны учитывать, принимает или принимал ли данный пациент тамсулозин. Это необходимо для подготовки к возможности развития во время операции синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза.

В случае развития ангионевротического отека на фоне терапии тамсулозином следует немедленно прекратить прием препарата. Повторное приме­нение тамсулозина противопоказано.

При почечной недостаточности, а также при пече­ночной недостаточности легкой и средней степени тяжести, не требуется коррекции режима дозирования. Имеются сообщения о случаях развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии α<sub>1</sub>-адрено­блокаторами. В случае сохранения эрекции до 4-х 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**

Исследований по влиянию тамсулозина на способ­ность к управлению транспортными средствами и механизмами не проводилось. Тем не менее, учитывая возможность возникновения головокруже­ния, необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами, механиз­мами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

**Форма выпуска**

Капсулы с пролонгированным высвобождением, 0,4 мг. По 7, 10 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной, либо пленки поливи­нилхлоридной/поливинилиденхлоридной и фольги алюминивевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 5, 6, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную упаковку (пачку).

**Условия хранения**

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

**Срок годности**

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

**Условия отпуска**

Отпускают по рецепту.

**Держатель регистрационного удостоверения: ООО «Атолл»**

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

**Производитель: ООО «Озон»**

Россия, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

**Организация, принимающая претензии: ООО «Озон»**

Россия, 445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6. Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru