

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ТАМСІН ФОРТЕ

(TAMSIN FORTE)

Склад:

діюча речовина: тамсулозину гідрохлорид;

1 таблетка пролонгованої дії містить тамсулозину гідрохлориду 0,4 мг;

допоміжні речовини: гіпромелоза (гідроксипропілметилцелюлоза), целюлоза мікрокристалічна, карбомер, кремнію діоксид колоїдний безводний, заліза оксид червоний (Е 172), магнію стеарат.

Лікарська форма.

Таблетки пролонгованої дії.

Основні фізико-хімічні властивості: білі, з гладкою поверхнею, круглі, двоопуклі таблетки з гравіюванням «T9SL» на одному боці і «0.4» на другому боці.

Фармакотерапевтична група.

Засоби, що застосовуються при доброякісній гіперплазії передміхурової залози. Антагоністи $\alpha 1$ -адренергічних рецепторів. Код АТХ G04C A02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Тамсулозин селективно і конкурентно блокує постсинаптичні $\alpha 1$ -адренорецептори, зокрема $\alpha 1A$ та $\alpha 1D$, що знаходяться у гладкій мускулатурі передміхурової залози, шийки сечового міхура і простатичної частини уретри. Це призводить до зниження тону м'язів гладкої мускулатури передміхурової залози, шийки сечового міхура і простатичної частини уретри та поліпшує виділення сечі.

Одночасно зменшуються симптоми обструкції та подразнення, пов'язані з доброякісною гіперплазією передміхурової залози (утруднення початку сечовипускання, послаблення струменя сечі, крапання після закінчення сечовипускання, відчуття неповного спорожнення сечового міхура, часті позиви до сечовипускання в нічний час, невідкладність сечовипускання).

Здатність α 1A-адреноблокаторів зменшувати артеріальний тиск пов'язана зі зменшенням периферичного опору. Тамсулозин у добовій дозі 0,4 мг не спричиняє клінічно значущого зниження системного артеріального тиску (АТ) як у хворих на артеріальну гіпертензію, так і в пацієнтів із нормальним початковим АТ.

Фармакокінетика.

Абсорбція. Тамсін Форте являє собою таблетку пролонгованої дії з контрольованим вивільненням, що забезпечує тривале та повільне вивільнення тамсулозину, що дає експозицію зі слабкими коливаннями протягом 24 годин.

Після перорального прийому натщесерце 57 % тамсулозину абсорбується в кишечнику. Швидкість і розмір абсорбції таблеток пролонгованої дії не змінюється при вживанні їжі із низьким вмістом жиру. Ступінь всмоктування підвищується на 64 % та 149 % (AUC та C_{max} відповідно) при прийомі їжі з високим вмістом жиру порівняно з прийомом натщесерце.

Тамсулозин демонструє лінійну фармакокінетику.

Після одноразового прийому Тамсін Форте натще C_{max} активної речовини у плазмі крові спостерігається через 6 годин. У рівноважному стані, який досягається на четвертий день прийому препарату, пік концентрації спостерігається через 4-6 годин незалежно від вживання їжі. Пік концентрації у плазмі крові підвищується з приблизно 6 нг/мл після першого прийому до 11 нг/мл у рівноважному стані.

Як результат тривалого вивільнення, найнижчий рівень концентрації тамсулозину у плазмі становить 40 % максимальної концентрації незалежно від вживання їжі.

Розподіл. Зв'язування з білками плазми – 99 %. Об'єм розподілу незначний (приблизно 0,2 л/кг).

Метаболізм. Тамсулозину гідрохлорид має низький ефект першого проходження, повільно метаболізується. Більша частина активної речовини присутня в крові у незміненому вигляді. Метаболізується у печінці. Результати *in vitro* показують, що CYP3A4 і також CYP2D6 включаються у метаболізм, інші ізоферменти CYP незначно впливають на тамсулозин. Пригнічення метаболізуючих ферментів CYP3A4 і CYP2D6 може призвести до підвищення експозиції тамсулозину гідрохлориду (див. розділи «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій» і «Особливості застосування»). Жоден із метаболітів не є активнішим за діючу речовину.

Виведення. Тамсулозин та його метаболіти виводяться в основному нирками, 4-6 % дози виділяється у незміненому вигляді. Період напіввиведення тамсулозину при одноразовому прийомі та у рівноважному стані становить 19 і 15 годин відповідно.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування функціональних розладів з боку нижніх сечовивідних шляхів при доброякісній гіперплазії простати.

Протипоказання.

Гіперчутливість до тамсулозину гідрохлориду, включаючи медикаментозно-індукований ангіоневротичний набряк, або до будь-якої з допоміжних речовин препарату; наявність в анамнезі ортостатичної гіпотензії; тяжка печінкова недостатність.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження взаємодії виконувалися тільки у дорослих.

При одночасному застосуванні тамсулозину гідрохлориду з атенололом, еналаприлом або теофіліном лікарської взаємодії не відзначалося. Одночасне застосування з циметидином підвищує, а з фуросемідом – знижує концентрацію тамсулозину в плазмі крові, але оскільки ці рівні залишаються у межах норми, у спеціальній корекції дозування тамсулозину немає необхідності.

У дослідженнях *in vitro* діазепам, пропранолол, трихлорметіазид, хлормадион, амітриптилін, диклофенак, глібенкламід, симвастатин та варфарин не впливають на вільну фракцію тамсулозину у плазмі крові людини. Подібним чином тамсулозин не змінює рівень вільних фракцій діазепаму, пропранололу, трихлорметіазиду та хлормадиону у плазмі крові людини.

Проте диклофенак та варфарин можуть підвищувати швидкість елімінації тамсулозину.

Одночасне застосування тамсулозину гідрохлориду із сильними інгібіторами CYP3A4 може призвести до збільшення впливу тамсулозину гідрохлориду. Одночасне застосування з кетоконазолом (відомий сильний інгібітор CYP3A4) призводило до збільшення AUC і C_{max} до 2,8 і 2,2 відповідно.

Тамсулозину гідрохлорид не слід призначати у комбінації із сильними інгібіторами CYP3A4 у пацієнтів з низьким метаболізмом CYP2D6.

Тамсулозину гідрохлорид слід застосовувати з обережністю у комбінації із сильними і помірними інгібіторами CYP3A4.

Одночасне застосування тамсулозину гідрохлориду і пароксетину (сильний інгібітор CYP2D6) призводило до збільшення AUC і C_{max} до 1,6 і 1,3 відповідно, але це не є клінічно значущим.

Одночасне застосування з іншими α 1-адреноблокаторами може посилювати гіпотензивний

ефект.

Особливості застосування.

Як і при застосуванні інших $\alpha 1$ -адреноблокаторів, в окремих випадках при застосуванні препарату можливе зниження артеріального тиску, що може рідко призводити до втрати свідомості. При появі перших ознак ортостатичної гіпотензії (запаморочення, слабкість) пацієнт повинен присісти або прийняти горизонтальне положення до зникнення вищезгаданих симптомів.

Перед тим як розпочати лікування препаратом Тамсін Форте, слід пройти медичне обстеження з метою виявлення інших супутніх захворювань, що можуть спричинити такі самі симптоми, як доброякісна гіперплазія передміхурової залози. Перед початком лікування необхідно провести ректальне обстеження передміхурової залози та при необхідності – тест на визначення рівня специфічного антигену передміхурової залози (PSA) до початку та через однакові проміжки часу під час лікування.

Призначати препарат пацієнтам із тяжкою стадією ниркової недостатності (кліренс креатиніну <10 мл/хв) необхідно з особливою обережністю, оскільки клінічних досліджень для таких пацієнтів не проводили.

У деяких пацієнтів, які приймали або приймають тамсулозин, під час хірургічного втручання з приводу видалення катаракти і глаукоми відзначався синдром атонічної зіниці (IFIS, варіант синдрому звуженої зіниці), що може стати причиною збільшення кількості ускладнень під час або після проведення такої операції.

Зазвичай, за 1-2 тижні перед проведенням операції з приводу видалення катаракти і глаукоми рекомендується припинити лікування тамсулозином, проте користь від припинення лікування тамсулозином на даний час точно не встановлена. Про синдром атонічної зіниці повідомлялося також у пацієнтів, яким припинили застосування тамсулозину протягом тривалого часу до проведення оперативного втручання з приводу катаракти.

У пацієнтів перед плановою операцією катаракти або глаукоми не рекомендується розпочинати прийом тамсулозину гідрохлориду. При підготовці до операції хірурги та офтальмологи мають дізнатися, чи приймав (або приймає) пацієнт тамсулозин, з метою попередження можливих ускладнень, пов'язаних з IFIS.

Тамсулозину гідрохлорид не слід призначати у комбінації із сильними інгібіторами CYP3A4 пацієнтам із низьким метаболізмом CYP2D6.

Тамсулозину гідрохлорид слід застосовувати з обережністю у комбінації із сильними і помірними інгібіторами CYP3A4 (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Іноді можна знайти залишки таблетки у фекаліях.

Повідомляли про випадки алергічних реакцій на тамсулозин у пацієнтів з наявністю в анамнезі алергії на сульфаніламід. Слід дотримуватися обережності при застосуванні тамсулозину гідрохлориду пацієнтам, у яких раніше відзначалася алергія на сульфаніламід.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Тамсін Форте не показаний для застосування жінкам.

Фертильність

Під час клінічних досліджень тамсулозину протягом короткого та тривалого часу відзначалися порушення еякуляції. Випадки порушення еякуляції, ретроградної еякуляції і недостатньої еякуляції відзначалися у післяреєстраційному періоді.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Дослідження впливу препарату на здатність керувати транспортними засобами і працювати з механізмами не проводилися. Однак пацієнти повинні бути проінформовані про можливе виникнення запаморочення.

Спосіб застосування та дози.

Для перорального застосування.

Рекомендована приймати таблетку щоденно, незалежно від вживання їжі. Таблетку слід ковтати цілою, не розжовуючи та не розламуючи її, оскільки це буде перешкоджати пролонгованому вивільненню активної речовини.

Тривалість лікування встановлюється індивідуально.

Пацієнтам із нирковою недостатністю не потрібна корекція дози. Пацієнтам із печінковою недостатністю помірного та середнього ступеня тяжкості корекція дози не потрібна (див. також розділ «Протипоказання»).

Діти.

Препарат не застосовують для лікування дітей.

Безпеку та ефективність застосування тамсулозину дітям не оцінювали.

Передозування.

Симптоми.

Передозування тамсулозином гідрохлоридом може потенційно спричинити тяжку гіпотензивну дію. Тяжка гіпотензивна дія відзначалася при різних ступенях передозування.

Лікування.

У випадку раптового зниження артеріального тиску внаслідок передозування слід проводити підтримуючу терапію, спрямовану на відновлення нормальної функції серцево-судинної системи, (наприклад, пацієнт має прийняти горизонтальне положення). Якщо цей захід не діє, провести інфузійну терапію та призначити вазопресорні засоби. Необхідно слідкувати за функцією нирок та проводити загальну підтримуючу терапію. Внаслідок високого ступеня зв'язування тамсулозину з білками плазми крові проведення гемодіалізу є навряд чи доцільним.

З метою припинення подальшого всмоктування препарату можна штучно викликати блювання. При передозуванні значної кількості препарату пацієнту необхідно промити шлунок із застосуванням активованого вугілля та низькоосмотичних послаблювальних засобів, таких як сульфат натрію.

Побічні реакції.

Система організму	Часто (>1/100, <1/10)	Нечасто (>1/1000, <1/100),	Рідко (>1/10000, <1/1000)	Дуже рідко (<1/10000)	Частота невідома (неможливо оцінити при наявності доступних даних)
Неврологічні розлади	Запаморочення (1,3 %)	Головний біль	Непритомність		
З боку органів зору					Затуманення зору*, порушення зору*
З боку серця		Відчуття серцебиття			
З боку судин		Ортостатична гіпотензія			
Респіраторно-медіастинальні розлади		Риніт			Носова кровотеча*
З боку шлунково-кишкового тракту		Запор, діарея, нудота, блювання			Сухість у роті*
Розлади з боку шкіри та слизових оболонок		Висипання, свербіж, кропив'янка	Ангіоневротичний набряк	Синдром Стивенса-Джонсона	Мультиформ-на еритема*, ексфоліативний дерматит*
Репродуктивні порушення	Розлади еякуляції, включаючи ретроградну еякуляцію і недостатність еякуляції			Пріапізм	
Загальні розлади		Астенія			

*- відзначалися у післяреєстраційному періоді.

Під час післяреєстраційного нагляду описані випадки інтраопераційної нестабільності райдужної оболонки ока (синдром звуженої зіниці) при операції з приводу катаракти та глаукоми у пацієнтів, які приймали тамсулозин (див. розділ «Особливості застосування»).

Післяреєстраційний досвід: крім вищевказаних побічних реакцій повідомлялося про випадки фібриляції передсердь, аритмії, тахікардії та диспное. Про зазначені випадки повідомлялося спонтанно, частота повідомлень та роль тамсулозину у цьому випадку не можуть бути достовірно встановлені.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Захищати від світла та вологи.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °C у сухому місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери в картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Сінтон Хіспанія, С.Л./Synthon Hispania, S.L.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

K/ Кастелло, № 1, Сант Бої де Ллобрегат, Барселона, 08830, Іспанія/

C/ Castelló, n°1, Sant Boi de Llobregat, Barcelona, 08830, Spain.