

RGD: 62884/E/1  
RGD: 61783/H/1  
10.05.2005

**КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА  
ПРОДУКТА**

**Tamsol  
0.4 mg modified-release capsules**

**Тамсол  
капсули с изменено освобождаване 0,4 mg**



МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-14555/19-10-06	
703/19-09-06	)

**1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ**

TAMSOL 0.4 mg modified-release capsules  
ТАМСОЛ капсули с изменено освобождаване 0,4 mg

**2. КАЧЕСТЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

Всяка капсула с изменено освобождаване съдържа 0,4 mg tamsulosin hydrochloride.

За помощните вещества, виж раздел 6.1.

**3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**

Капсули с изменено освобождаване.  
Пълнеж: бял или светлосив, със съдържание на зрънца.  
Обвивка на капсулата: размер №2; запушалка: стандартно матово кафяво, тяло: матово светлобежово.

**4. КЛИНИЧНИ ДАННИ**

**4.1. Терапевтични показания**

Лечение на функционални симптоми на доброкачествена простатна хиперплазия (ДПХ).

**4.2. Дозировка и начин на приложение**

Една капсула дневно да се приема след едно и също хранене всеки ден.  
Капсулата трябва да се погълне цяла, не трябва да се дъвче, тъй като това може да повлияе на измененото освобождаване на активното вещество.

**4.3. Противопоказания**

Свръхчувствителност към тамсулозин хидрохлорид или към някое от помощните вещества. Анамнестични данни за ортостатична хипотония; тежка чернодробна недостатъчност.

**4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба**

Както при останалите алфа<sub>1</sub> блокери, в отделни случаи по време на лечението с Тамсол капсули с изменено освобождаване 0,4 mg, може да настъпи понижаване на артериалното налягане, и в резултат на което в редки случаи може да се появи синкоп. При първите прояви на



ортостатична хипотония (замайване, слабост), пациентът трябва да седне или да легне, докато симптомите изчезнат.

Преди началото на лечението с Тамсол капсули с изменено освобождаване 0,4 mg, пациентът трябва да бъде изследван, за да се изключи наличието на други състояния, които могат да предизвикат същите симптоми както при доброкачествена простатна хиперплазия. Преди лечението и на определени интервали след това трябва да се извърши ректално изследване и когато е необходимо - определяне на специфичен простатен антиген (PSA).

Лечението на пациенти с тежко увреждане на бъбреците (креатининов клирънс под 10 ml/мин.) трябва да се провежда с внимание, тъй като не са извършвани проучвания върху такива пациенти.

#### 4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Не са наблюдавани взаимодействия при приложението на тамсулозин едновременно с атенолол, еналаприл, нифедипин или теофилин.

Едновременното приложение на симетидин води до повишаване на плазмените нива на тамсулозин, а на фуросемид - до понижаването им, но тъй като нивата остават в рамките на нормалните граници, не се налага промяна в приема му.

*Ин vitro* диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадион, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не променят свободната фракция на тамсулозин в човешката плазма. Както и тамсулозин също не променя свободните фракции на диазепам, пропранолол, трихлорметиазид и хлормадион.

При *in vitro* проучвания с чернодробни микрозомални фракции (представени от цитохром P<sub>450</sub>-свързваща лекарствено метаболизираща ензимна система), включващи амитриптилин, салбутамол, глибенкламид и финастерид, не са наблюдавани взаимодействия на ниво чернодробен метаболизъм.

Понякога диклофенак и варфарин могат да повишат скоростта на елиминиране на тамсулозин.

Съществува теоретичен риск от засилване на хипотензивния ефект, когато се приема едновременно с лекарства, които могат да понижат артериалното налягане, включително анестетици и други  $\alpha_1$ -адренорецепторни блокери.

#### 4.6. Бременност и кърмене

Не се прилага, тъй като Тамсол капсули с изменено освобождаване 0,4 mg е предназначен само за мъже.

#### 4.7. Ефект върху способността за шофиране и работа с машини



Тамсол капсули с изменено освобождаване 0,4 mg може да повлияе неблагоприятно върху способността за шофиране и работа с машини. Трябва да се вземе предвид, че при някои пациенти може да се появи сънливост, замъглено виждане, замаяност и синкоп.

#### 4.8. Нежелани лекарствени реакции

*Много често срещани нежелани реакции (>1 %, <10 %):*

Нарушения на нервната система: замаяност (1.3 %)

*Често срещани нежелани реакции (>0.1 %, <1 %):*

Нарушения на нервната система: главоболие.

Сърдечни нарушения: сърцебиене.

Съдови нарушения: постурална хипотония.

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения: ринит.

Стомашно-чревни нарушения: запек, диария, гадене, повръщане.

Нарушения в кожата и подкожната тъкан: обрив, сърбеж, уртикария.

Нарушения в репродуктивната система и млечните жлези: ретроградна еякулация.

Общи нарушения: астения.

*Рядко срещани нежелани реакции (>0.01 %, <0.1 %):*

Нарушения на нервната система: синкоп.

Нарушения в кожата и подкожната тъкан: ангиоедем.

*Много рядко срещани нежелани реакции (<0.01 %):*

Нарушения в репродуктивната система и млечните жлези: приапизъм.

#### 4.9. Предозиране

Няма съобщения за случаи на остро предозиране. Понякога теоретично е възможно да настъпи остра хипотония след предозиране, в такъв случай трябва да се окаже сърдечно-съдова помощ. Артериалното налягане може да се възстанови и сърдечната честота да се доведе до нормалната, когато пациентът легне. Ако това не помогне, може да се използват обемни заместители, а когато е необходимо, съдосвиващи средства. Трябва да се наблюдава бъбречната функция и да се приложат общо поддържащи средства.

Диализата не би помогнала, тъй като тамсулозин е силно свързан с плазмените протеини.



За да се избегне абсорбцията, трябва да се предприемат мерки, като повръщане. Когато са приети големи количества от лекарството, може да се приложи стомашна промивка и да се въведат активен въглен и осмотично разслабително средство, като натриев сулфат.

## 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

### 5.1. Фармакодинамични свойства

**Фармакотерапевтична група:** Алфа<sub>1</sub>-адренорецепторен антагонист.

**АТС код:** G04C A02

Тамсулозин се свързва селективно и конкуриращо с постсинаптичните алфа<sub>1</sub>-адренорецептори, по-специално със субтипове алфа<sub>1A</sub> и алфа<sub>1D</sub>, които водят до релаксация на гладката мускулатура на простатата, вследствие на което се намалява напрежението.

Тамсол капсули с изменено освобождаване 0,4 mg повишава максимално струята урина чрез намаляване на напрежението на гладките мускули в простатата и уретрата, като се овладява обструкцията.

Също така подобрява комплекс от симптоми на дразнене и обструкция, при които нестабилността на пикочния мехур и напрежението на гладките мускули на долния уринарен тракт играят съществена роля.

Алфа<sub>1</sub>-блокери могат да понижат артериалното налягане чрез намаляване на периферното съпротивление. По време на проучвания с тамсулозин не е наблюдавано понижение на артериалното налягане с клинична значимост.

### 5.2. Фармакокинетични свойства

#### **Абсорбция:**

Тамсулозин се абсорбира от тънките черва и е с почти пълна бионаличност.

Абсорбцията на тамсулозин се намалява от скорошно хранене.

Приемането на Тамсол капсули с изменено освобождаване 0,4 mg от пациента след един и същ прием на храна ежедневно съдейства за постоянната абсорбция.

Тамсулозин показва линейна кинетика.

След единична доза Тамсол капсули с изменено освобождаване 0,4 mg в хранителната фаза, плазмените нива на тамсулозин достигат връхна точка след около 6 часа, и steady-state, което се достига на петия ден след многократно приложение,  $C_{max}$  при пациенти е около 2/3 пъти по-висока от достигнатата след единична доза. Въпреки че това се наблюдава при пациенти в напреднала възраст, същите данни може да се очакват и при млади пациенти.



Има значителна разлика между плазмените нива при отделните пациенти, както и след прием на единична или многократни дози.

#### **Разпределение:**

При хора, тамсулозин е свързан с плазмените протеини в около 99% и обемът на разпределение е малък (около 0.2 l/kg).

#### **Биотрансформация:**

Тамсулозин има нисък ефект на първо преминаване, тъй като се метаболизира бавно. По-голяма част от тамсулозин се открива в плазмата в непроменена форма. Метаболизира се в черния дроб.

При плъхове, почти не е установено индуциране на микрозомалните чернодробни ензими, причинено от тамсулозин.

Никой от метаболитите не е по-активен от оригиналната съставка.

#### **Елиминиране:**

Тамсулозин и неговите метаболити се отделят главно в урината с около 9% от дозата в непроменена форма.

След единична доза Тамсол капсули с изменено освобождаване 0,4 mg в хранителната фаза и при пациенти в *steady state*, плазменият полуживот е измерен, съответно около 10 и 13 часа.

Наличието на бъбречно увреждане не дава основание за намаляване на дозата.

### **5.3. Предклинични данни за безопасност**

Проведени са проучвания за токсичност на единична и повтарящи се дози при мишки, плъхове и кучета. Освен това са проведени проучвания за репродуктивната токсичност при плъхове, за канцерогенност при мишки и плъхове и е изследвана *in vivo* и *in vitro* генотоксичност. Профилът на общата токсичност с високи дози тамсулозин е съпоставим с известните фармакологични ефекти на алфа-адренергичните блокери. При много високи дози, при кучета се променя ЕКГ. Този тип отговор се счита за клинично незначим. Тамсулозин показва незначителни генотоксични свойства.

Има съобщения за повишена честота на пролиферативни промени на млечните жлези при женски плъхове и мишки. Тези промени, които



вероятно са обусловени от хиперпролактинемия, се срещат само при високи дози, и не се отнасят към токсичните.

## 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

### 6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Пълнеж: calcium stearate, triethyl citrate, talc, methacrylic acid – ethyl acrylate copolymer 1:1 (including: polysorbate 80, sodium laurilsulfate), microcrystalline cellulose.

Обвивка на капсулата: yellow iron oxide (E172), black iron oxide (E172), red iron oxide (E172), titanium dioxide (E171), gelatin.

### 6.2. Несъвместимости

Не са установени.

### 6.3. Срок на годност

2 години

### 6.4. Специални условия за съхранение

Не се изискват специални условия за съхранение на този продукт.

### 6.5. Данни за опаковката

30 бр. капсули с изменено освобождаване са поставени в безцветен, прозрачен PVC/PVDC/Al блистер и картонена кутия.

100 бр. капсули с изменено освобождаване са поставени в безцветен, прозрачен PVC/PVDC/Al блистер и картонена кутия.

### 6.6. Препоръки при употреба/манипулиране

Забележка: ☼ (единичен кръст) силно действие.

Достъпност: Лекарствен продукт по лекарско предписание (група II/3.a).

## 7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Gedeon Richter Ltd.  
H-1103 Budapest X., Gyömrői út 19-21.  
Hungary



8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР
  
9. ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ
  
10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) ОБРАБОТКА НА ТЕКСТА

