МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Тамсулозин-Бинергия

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Тамсулозин-Бинергия

Международное непатентованное наименование: тамсулозин

Лекарственная форма: капсулы кишечнорастворимые с пролонгированным высвобождением

Состав

1 капсула содержит:

Тамсулозин субстанция-пеллеты – 200 мг содержащие:

действующее вещество: тамсулозина гидрохлорид – 0,4 мг;

вспомогательные вещества: «сахарные пеллеты» (сахароза, крахмал кукурузный, повидон-К30), гипромеллоза, тальк, кремния диоксид коллоидный, полисорбат-80;

вспомогательные вещества оболочки пеллет: гипромеллоза, этилцеллюлоза, метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (1:1), триэтилцитрат;

твердая желатиновая капсула (корпус и крышечка): титана диоксид (Е 171), желатин.

Описание

Твердые желатиновые капсулы № 2, корпус и крышечка белого цвета. Содержимое капсул – сферические пеллеты белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Альфа1-адреноблокатор

Код АТХ: G04CA02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тамсулозин является специфическим блокатором постсинаптических альфа1-адренорецепторов, находящихся в гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и

МИНЗДРА В РОССИИ
ЛП-005765-030919
СОГЛАСОВАНО

простатической части уретры. Блокада альфа1-адренорецепторов тамсулозином 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, обусловленные повышенным тонусом гладкой мускулатуры и детрузорной гиперактивностью при доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ).

Способность тамсулозина воздействовать на альфа1-А подтип адренорецепторов в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с альфа1-В 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 нормальным исходным АД.

Фармакокинетика

Всасывание: тамсулозин хорошо всасывается в кишечнике и обладает почти 100 % биодоступностью. Всасывание тамсулозина несколько замедляется 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. После однократного приема внутрь 0,4 мг препарата его максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) достигается через 6 часов. После многократного приема внутрь 0,4 мг в день равновесная концентрация (C_{ss}) 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).

Метаболизм: тамсулозин медленно метаболизируется в печени с образованием менее активных метаболитов. Большая часть тамсулозина представлена в плазме крови в неизмененной форме.

В эксперименте выявлена способность тамсулозина незначительно индуцировать активность микросомальных ферментов печени.

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

Выведение: тамсулозин и его метаболиты главным образом выводятся почками, при этом приблизительно около 9 % препарата выделяется в неизмененном виде.

Период полувыведения препарата ($T_{1/2}$) 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 при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Противопоказания

Гиперчувствительность к тамсулозину или любому другому компоненту препарата; дефицит сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция; ортостатическая гипотензия (в т.ч. в анамнезе); выраженная печеночная недостаточность; детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин); артериальная гипотензия.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат Тамсулозин-Бинергия предназначен для применения только у лиц мужского пола.

Способ применения и дозы

Взрослые старше 18 лет, а также пожилые пациенты

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

У пациентов с нарушением функции печени и почек

При почечной недостаточности, а также при легкой и умеренной печеночной недостаточности не требуется коррекции режима дозирования.

Побочное действие

Частота развития нежелательных явлений представлена в соответствии с классификацией, рекомендованной Всемирной Организацией Здравоохранения: очень часто (>1/10), часто (≥1/100 и <1/10), нечасто (≥1/1000 и <1/100), редко (≥1/10000 и <1/1000), очень редко

(<1/10000), частота неизвестна (оценка не может быть проведена на основании имеющихся данных).

Системно-органный класс, заболевания	Частота развития	Нежелательные явления
Нарушения со стороны нервной системы	Часто	головокружение
	Нечасто	головная боль
	Редко	обморок
Нарушения со стороны сердца	Нечасто	ощущение сердцебиения
	Частота неизвестна	фибрилляция предсердий, аритмия, тахикардия и одышка
Нарушения со стороны сосудов	Нечасто	ортостатическая гипотензия
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения	Нечасто	ринит
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	Нечасто	запор, диарея, тошнота, рвота
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	Нечасто	кожная сыпь, кожный зуд, крапивница
	Редко	ангионевротический отек
	Очень редко	синдром Стивенса-Джонсона
	Частота неизвестна	мультиформная эритема, эксфолиативный дерматит
Нарушения со стороны половых органов и молочной железы	Часто	нарушения эякуляции
	Очень редко	приапизм
Общие расстройства и нарушения в месте введения	Нечасто	астения
Прочие	Нечасто	астения
	Частота неизвестна	описаны случаи интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка) при операции по поводу катаракты и глаукомы у пациентов, принимавших тамсулозин.

Передозировка

Нет сообщений о случаях острой передозировки тамсулозином. Однако, теоретически при передозировке возможно развитие острого снижения АД и компенсаторной тахикардии, в случае

которой необходимо проведение симптоматической терапии. АД и частота сердечных сокращений могут восстановиться при принятии человеком 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 сильно связан с белками плазмы.

Для предотвращения дальнейшего всасывания препарата целесообразно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного, например, магния сульфата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При назначении тамсулозина вместе с атенололом, эналаприлом или нифедипином взаимодействий обнаружено не было.

При одновременном применении тамсулозина с циметидином отмечено некоторое повышение концентрации тамсулозина в плазме крови, а с фуросемидом – снижение концентрации, однако это не требует изменения дозы препарата Тамсулозин-Бинергия, поскольку концентрация препарата остается в пределах нормального диапазона.

В исследованиях *in vitro* не были выявлены взаимодействия с сальбутамолом и финастеридом. Диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадинон, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не изменяют свободную фракцию тамсулозина в плазме 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.

Одновременное назначение тамсулозина с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 может привести к увеличению концентрации тамсулозина. Одновременное назначение с кетоконазолом (мощный ингибитор CYP3A4) приводило к увеличению AUC и C_{max} тамсулозина в 2,8 и 2,2 раза соответственно.

Тамсулозин не следует применять в комбинации с мощными ингибиторами CYP3A4 у пациентов с нарушением метаболизма изофермента CYP2D6. Препарат следует применять с осторожностью в комбинации с мощными и умеренными ингибиторами CYP3A4.

Одновременное назначение тамсулозина и пароксетина, мощного ингибитора CYP2D6, приводило к увеличению AUC и C_{max} тамсулозина в 1,6 и 1,3 раза соответственно, однако данное увеличение признано клинически незначимым.

Одновременное назначение других антагонистов альфа1-адренорецепторов может привести к

снижению АД.

При совместном применении тамсулозина с ингибиторами холинэстеразы, алпростадилом, анестетиками, диуретиками, леводопой, миорелаксантами, нитратами, антидепрессантами, бета-адреноблокаторами, блокаторами «медленных» (кальциевых каналов) и этанолом возможен риск выраженного снижения АД.

Особые указания

Как и при применении других альфа1-адреноблокаторов, при лечении препаратом Тамсулозин-Бинергия в отдельных случаях может наблюдаться снижение 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 указанные симптомы не исчезнут.

Прежде чем начать терапию тамсулозином, пациент должен быть обследован с тем, чтобы исключить наличие других заболеваний, которые могут вызвать такие же симптомы, как и ДГПЖ. Перед началом лечения и регулярно во время терапии должно выполняться пальцевое ректальное обследование и, если требуется, определение простатического специфического антигена.

Есть сообщения о случаях развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии альфа1-адреноблокаторами. В случае сохранения эрекции в течение более 4 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.

Лечение препаратом Тамсулозин-Бинергия пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина <10 мл/мин) требует осторожности, т.к. исследований у этой категории пациентов не проводилось.

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 пациентам у которых 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 следует немедленно прекратить терапию препаратом. Повторное назначение тамсулозина противопоказано.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и занятиями потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций, в связи с тем, что при приеме тамсулозина возможно развитие головокружения.

Форма выпуска

Капсулы кишечнорастворимые с пролонгированным высвобождением 0,4 мг.

По 10 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой для упаковки или гибкой упаковки на основе алюминиевой фольги или гибкой упаковки в рулонах на основе алюминиевой фольги для лекарственных препаратов.

По 10, 30, 60, 90 или 100 капсул в банку полимерную с амортизатором и крышкой натягиваемой с контролем первого вскрытия для витаминов и лекарственных средств БПН, или банку полимерную с винтовой горловиной и крышкой навинчиваемой для витаминов и лекарственных средств БПВ, или банку полимерную для лекарственных средств (в комплекте с крышкой). Свободное пространство заполняют ватой медицинской.

По 1 банке, 1, 3, 6, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение / Организация, принимающая претензии:

ЗАО «Бинергия», Россия, 143910, Московская область, г. Балашиха, ул. Крупешина, д. 1.

Тел.: 8-495-580-55-02

Факс: 8-495-580-55-03

Производитель и адрес места производства:

ООО НПО «ФармВИЛАР», Россия, 249096, Калужская обл., г. Малоярославец, ул. Коммунистическая, д. 115.

Начальник отдела регистрации,
стандартизации и лицензирования
ЗАО «Бинергия» Долина Е.Р.