

УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета контроля медицинской и
фармацевтической деятельности
Министерства здравоохранения и
социального развития
Республики Казахстан
от «07» 02 2017 г.
№ N006591

**Инструкция по медицинскому применению
лекарственного препарата**

ФОКУСИН®

Торговое название
ФОКУСИН®

Международное непатентованное название
Тамсулозин

Лекарственная форма
Капсулы с модифицированным высвобождением 0,4 мг

Состав
Одна капсула содержит
активное вещество - тамсулозина гидрохлорид 0,40 мг
вспомогательные вещества: кислоты метакриловой и этилакрилата сополимер (1:1) 30 % дисперсия, целлюлоза микрокристаллическая, дибутилсебакат, полисорбат 80, кремния диоксид коллоидный водный, тальк.
крышечка и корпус капсулы: азорубин (Е 122), патентованный синий V (Е 131), желатин.

Описание
Твердые желатиновые капсулы с прозрачным корпусом темно-синего цвета и прозрачной крышечкой темно-синего цвета.
Содержимое капсул – микропеллеты от белого до почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа
Препараты для лечения урологических заболеваний.
Препараты для лечения доброкачественной гипертрофии простаты.
Альфа1-адреноблокаторы.
Тамсулозин.

Код АТХ G04CA02

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Всасывание

Тамсулозин всасывается в тонкой кишке, и его биодоступность составляет почти 100%. Всасывание тамсулозина уменьшается, если препарат принимать сразу после еды.

Однородность всасывания препарата ФОКУСИН® обеспечивается приемом после завтрака или первого приема пищи (в одно и то же время).

Кинетика тамсулозина является линейной.

После однократного приема тамсулозина после приема пищи, максимальная концентрация в плазме крови достигается приблизительно через 6 часов. Состояние равновесной концентрации достигается после 5 дневного курса, когда C_{max} у пациентов почти на две трети выше чем после однократного приема препарата. Несмотря, на то, что данный эффект был подтвержден только у пациентов пожилого возраста, те же результаты ожидаемы у молодых пациентов.

Для плазменной концентрации препарата после однократного и многократного приёма характерны выраженные индивидуальные различия.

Распределение

У людей приблизительно 99 % тамсулозина связывается с белками плазмы, и его объем распределения незначителен (приблизительно 0.2 л/кг).

Биотрансформация

У тамсулозина отмечается низкий метаболический эффект первого прохождения. Большая часть тамсулозина присутствует в плазме в неизмененном виде. Препарат метаболизируется в печени.

Регулирование дозировки не является необходимостью при легкой печеночной недостаточности.

Метаболиты не так эффективны и токсичны, как воздействие непосредственно действующего вещества препарата.

Выделение

Тамсулозин и его метаболиты главным образом выделяются с мочой; приблизительно 9 % данной дозы выделяются в неизмененной форме.

Период полувыведения тамсулозина у пациентов составляет приблизительно 10 часов (принятого после еды) и 13 часов в стабильной концентрации.

При почечной недостаточности

При заболеваниях почек нет необходимости в снижении дозы.

Применение у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина <10 мл/мин) должно осуществляться с осторожностью, так как исследование лечения препаратом у данных пациентов не проводилось.

Фармакодинамика

Механизм действия

Тамсулозин селективно и конкурентно связывается с постсинаптическими α_1 -адренорецепторами, преимущественно особенно с α_{1A} и α_{1D} подтипами. Таким образом достигается расслабление гладких мышц простаты и уретры, которое приводит к уменьшению тонуса и улучшению мочеиспускания.

Фармакодинамические эффекты

Тамсулозин снижает тонус гладкой мускулатуры предстательной железы и уретры, улучшая отток мочи. Это приводит к уменьшению симптомов обструкции и облегчению опорожнения. Тамсулозин также уменьшает симптомы наполнения, в развитии которых значительную роль играет нестабильное состояние мочевого пузыря. Эффекты в отношении симптомов наполнения и опорожнения мочеиспускания сохраняются при длительной терапии. Данные эффекты позволяют значительно отсрочить необходимость проведения хирургического лечения или катетеризации.

α_1 -блокаторы уменьшают артериальное давление, понижая периферическое сопротивление. У пациентов, имеющих нормальное артериальное давление, клинически значимого снижения артериального давления не наблюдалось.

Показания к применению

- дизурические расстройства при доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ).

Способ применения и дозы

Принимается внутрь по одной капсуле ежедневно после завтрака или первого приема пищи. Капсулу проглатывают целиком, не нарушая ее целостности и не разжевывая, так как это может оказать влияние на контролируемое высвобождение действующего вещества.

Курс лечения определяется индивидуально лечащим врачом.

Побочные действия

Часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$)

- головокружение

Нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$)

- головные боли

- сердцебиение

- ортостатическая гипотензия

- ринит
- запор, диарея, тошнота, рвота
- сыпь, зуд, крапивница
- астения

Редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$)

- обморок
- ангионевротический отёк

Очень редко ($< 1/10000$)

- приапизм
- синдром Стивенса-Джонсона

Частота не известна (нельзя установить исходя из имеющихся данных)

- нечеткое зрение, нарушение зрения
- носовое кровотечение
- мультиформная эритема, эксфолиативный дерматит
- нарушения эякуляции, ретроградная эякуляция, отсутствие эякуляции
- сухость во рту

При использовании препарата в постмаркетинговом периоде наблюдались случаи синдрома узкого зрачка, так называемый синдром «интраоперационная нестабильность радужной оболочки глаза» (Intraoperative Floppy Iris Syndrome), ассоциируемые с применением тамсулозина во время проведения хирургической операции по поводу катаракты.

Постмаркетинговый опыт применения: помимо вышеперечисленных нежелательных реакций, имеются сообщения о случаях фибрилляции предсердий, аритмии, тахикардии и одышки, ассоциируемых с применением тамсулозина гидрохлорида. В связи с тем, что о данных явлениях сообщается в спонтанных сообщениях о постмаркетинговом опыте применения во всем мире, нельзя достоверно установить частоту случаев и роль тамсулозина в возникновении таких реакций.

Медицинским работникам рекомендуется сообщать о подозрениях на побочные реакции через национальную систему отчётности, что позволяет оценивать баланс пользы/риска медицинского препарата.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к тамсулозину гидрохлориду или к любому из вспомогательных веществ, включая медикаментозный ангионевротический отек
- ортостатическая гипотензия в анамнезе
- тяжелая печеночная недостаточность
- с осторожностью - тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин)
- детский возраст до 18 лет

Лекарственные взаимодействия

Исследования о лекарственных взаимодействиях проводились только на взрослых.

При совместном назначении тамсулозина гидрохлорида с ателололом, эналаприлом или теофиллином не наблюдались никакие взаимодействия. При одновременном применении с циметидином вызывает повышение концентрации тамсулозина в плазме крови; с фуросемидом - снижение концентрации, однако это не требует изменения дозы Фокусина[®], поскольку концентрация препарата остается в пределах нормального диапазона.

Диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадион, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не влияют на свободную фракцию тамсулозина в плазме человека *in vitro*. Как и тамсулозин не влияет на свободные фракции диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона.

Диклофенак и варфарин могут несколько увеличивать скорость выведения тамсулозина.

Одновременное применение тамсулозина гидрохлорида с сильными ингибиторами CYP3A4 могут привести к усилению воздействия тамсулозина гидрохлорида. Параллельный прием с кетоконазолом (известный сильный ингибитор CYP3A4) привел к увеличению AUC и C_{max} тамсулозина гидрохлорида в 2,8 и 2,2 раза, соответственно.

Тамсулозина гидрохлорид не следует назначать в сочетании с сильными ингибиторами CYP3A4 у больных фенотипа «медленный метаболизатор» по CYP2D6.

Следует соблюдать осторожность при применении тамсулозина гидрохлорида в сочетании с сильными и умеренными ингибиторами CYP3A4.

Одновременное применение тамсулозина гидрохлорида с пароксетином, сильным ингибитором CYP2D6, привело к увеличению C_{max} и AUC тамсулозина в 1,3 и 1,6, соответственно, однако данное увеличение не считается клинически значимым.

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

Особые указания

Как и при применении других антагонистов α_1 -адренорецепторов, при лечении тамсулозина гидрохлоридом в отдельных случаях возможно снижение АД крови, очень редко - развитие обморочного состояния. При первых симптомах ортостатической гипотензии пациента следует посадить или положить до исчезновения этих симптомов. Перед началом лечения тамсулозина гидрохлоридом больной должен быть тщательно обследован для исключения других заболеваний, симптомы которых схожи с

симптомами доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Перед началом лечения и далее, следует проводить с регулярными интервалами пальцевое обследование предстательной железы через прямую кишку и, при необходимости, определять уровень специфического антигена простаты (ПСА).

К лечению пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина <10 мл/минуты) нужно подходить с осторожностью, поскольку эти пациенты не были изучены.

Об ангионевротическом отеке после использования тамсулозина сообщалось редко. В случае ангионевротического отека лечение должно быть немедленно прекращено, пациент должен быть под наблюдением до исчезновения отека, и тамсулозин не должен повторно применяться.

Во время операции катаракты у некоторых пациентов, которые лечились или лечатся тамсулозина гидрохлоридом, наблюдался синдром интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (Intraoperative Floppy Iris Syndrome, синдром узкого зрачка).

Синдром узкого зрачка может привести к увеличенным процедурным осложнениям во время и после операции.

Прекращение лечения тамсулозином за 1 - 2 недели до операции катаракты считают целесообразным, но польза от прекращения лечения тамсулозином, не была установлена. О синдроме узкого зрачка сообщалось и у пациентов, у которых отмена тамсулозина была и за более длительный период до операции.

Не рекомендуется начинать терапию тамсулозина гидрохлоридом у больных, у которых запланирована хирургическая операция по поводу катаракты. Во время предоперационной подготовки команда хирургов и офтальмологов должны принять во внимание, лечится или лечился ли пациент тамсулозином, для принятия адекватных мер в управлении возможного развития синдрома узкого зрачка во время операции.

Тамсулозина гидрохлорид не следует принимать в сочетании с сильными ингибиторами CYP3A4 у больных фенотипа «медленный метаболизатор» по CYP2D6.

Тамсулозина гидрохлорид следует использовать с осторожностью в сочетании с сильными и умеренными ингибиторами CYP3A4.

Беременность и период лактации

Тамсулозин не предназначен для применения у женщин.

Нарушения эякуляция наблюдались в краткосрочных и долгосрочных клинических исследованиях с тамсулозином. Случаи расстройства эякуляции, ретроградной эякуляции и недостаточности семяизвержения было зарегистрированы в пострегистрационный период.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Исследования воздействий на способность вождения и управления аппаратами не выполнялись. Однако, пациентам нужно сообщить о возможности развития головокружения.

Передозировка

Симптомы: может развиваться тяжелая гипотензия (которая наблюдалась при передозировке различной степени).

Лечение: Требуется проведение мероприятий, поддерживающих функцию сердечно-сосудистой системы. В случае острой гипотензии, возникшей после передозировки необходимо провести лечебные мероприятия по поддержке сердечно-сосудистой системы. Нормализовать артериальное давление и частоту сердечных сокращений можно путем приведения пациента в горизонтальное положение. При неэффективности этого мероприятия, возможно, потребуются введение объёмо-замещающих растворов и при необходимости введение сосудосуживающих средств. Необходимо контролировать функцию почек и проводить мероприятия, направленные на ее поддержание. Диализ не эффективен, т.к. тамсулозин связывается с белками плазмы крови в очень больших количествах. Для предупреждения всасывания необходимо вызвать рвоту. В случае передозировки большим количеством препарата, необходимо провести промывание желудка, а также необходимо назначить приём активированного угля и осмотических слабительных средств, например, натрия сульфата.

Форма выпуска и упаковка

По 10 капсул помещают в контурные ячейковые упаковки из твердой бесцветной пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 3, 9 и 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в картонную пачку.

Условия хранения

При температуре от +10°C до +25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок хранения

3 года

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

Санека Фармасьютикалс а.с., Словацкая Республика

Владелец регистрационного удостоверения

Зентива к.с., Чешская Республика.

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству продукции (товара)

ТОО «Санофи-авентис Казахстан»

Республика Казахстан, 050013, г. Алматы, ул. Фурманова 187Б

телефон: +7 (727) 244-50-96

факс: +7 (727) 258-25-96

e-mail: quality.info@sanofi.com

Наименование, адрес и контактные данные (телефон, факс, электронная почта) организации на территории Республики Казахстан, ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственного средства

ТОО «Санофи-авентис Казахстан»

Республика Казахстан, 050013, Алматы, ул. Фурманова 187Б

телефон: +7(727) 244-50-96

факс: +7 (727) 258-25-96

e-mail: Kazakhstan.Pharmacovigilance@sanofi.com