

Қазақстан Республикасы  
Денсаулық сақтау және  
әлеуметтік даму министрлігі  
Медициналық және  
фармацевтикалық қызметті  
бақылау комитеті Төрағасының  
2017 жылғы “07” 02  
№N006591 бұйрығымен  
БЕКІТІЛГЕН

**Дәрілік затты медициналық қолдану  
жөніндегі нұсқаулық**

**ФОКУСИН®**

**Саудалық атауы**  
ФОКУСИН®

**Халықаралық патенттелмеген атауы**  
Тамсулозин

**Дәрілік түрі**  
Модификацияланып босап шығатын капсулалар, 0,4 мг

**Құрамы**

Бір капсуланың құрамында

*белсенді зат* - 0,40 мг тамсулозин гидрохлориді

*қосымша заттар*: метакрил қышқылы және 30% дисперсиялы этил акрилаты сополимері (1:1), микрокристалды целлюлоза, дибутилсебакат, полисорбат 80, сулы коллоидты кремнийдің қостотығы, тальк.

*капсуланың қақпақшасы мен корпусы*: азорубин (Е 122), патенттелген көк V (Е 131), желатин.

**Сипаттамасы**

Мөлдір күңгірт-көк қақпақшасы және мөлдір күңгірт-көк түсті корпусы бар қатты желатинді капсулалар.

Капсуланың ішіндегісі – ақтан ақ дерлік түске дейінгі микропеллеттер.

**Фармакотерапиялық тобы**

Урологиялық ауруларды емдеуге арналған препараттар.

Простатаның қатерсіз гипертрофиясын емдеуге арналған препараттар.

Альфа1-адреноблокаторлар

Тамсулозин.

АТХ коды G04CA02

## **Фармакологиялық қасиеттері**

### **Фармакокинетикасы**

#### *Сіңірілуі*

Тамсулозин ішекте сіңеді, және оның биожетімділігі 100% дерлікті құрайды. Егер препаратты тамақтан кейін бірден қабылдаса, тамсулозиннің сіңуі азаяды.

ФОКУСИН® препаратының біркелкі сіңуі оны таңертеңгі тамақтан немесе алғашқы тамақ ішуден кейін (белгілі бір уақытта) қабылдағанда қамтамасыз етіледі.

Тамсулозин кинетикасы дозаға байланысты болады.

Тамсулозинді тамақтан кейін ішке бір рет қабылдағаннан кейін қан плазмасында ең жоғары концентрациясына шамамен 6 сағаттан соң жетеді. Тепе-тең концентрация жағдайына 5 күндік курстан кейін, пациенттерде  $C_{max}$  мәні препаратты бір рет қабылдағаннан кейінгі мәндерінен үштен екіге жоғары болғанда жетеді. Осы әсерлердің тек егде жастағы пациенттерде ғана айғақталғанына қарамастан, осындай нәтижелер жас пациенттерден де күтіледі.

Бір реттік және көп реттік қабылдаудан кейін препараттың плазмалық концентрациялары үшін жекелей айқын айырмашылықтар тән.

#### *Таралуы*

Адамдарда тамсулозиннің шамамен 99%-ы плазма ақуыздарымен байланысады және оның таралу көлемі елеусіз (шамамен 0.2 л/кг).

#### *Биотрансформациясы*

Тамсулозинде алғаш өтудің төмен метаболизмдік әсері білінеді. Тамсулозиннің үлкен бөлігі плазмада өзгермеген күйінде болады. Препарат бауырда метаболизденеді.

Дозаны реттеу бауырдың орташа жеткіліксіздігінде қажет емес.

Препараттың әсер етуші затының тікелей әсері сияқты метаболиттер әсері тиімді және уытты емес.

#### *Шығарылуы*

Тамсулозин және оның метаболиттері негізінен несеппен бірге бөлініп шығады; осы дозаның шамамен 9%-ы өзгермеген күйінде бөлініп шығады. Тамсулозиннің жартылай шығарылу кезеңі пациенттерде өзгермеген күйінде шамамен 10 сағатты (тамақтан кейін қабылданған) және тұрақты концентрацияда 13 сағатты құрайды.

#### *Бүйрек жеткіліксіздігінде*

Бүйрек ауруларында дозаны төмендетудің қажеті жоқ.

Ауыр бүйрек жеткіліксіздігі (креатинин клиренсі <10 мл/мин) бар пациентте сақтықпен қолданылуы тиіс, себебі осы пациенттерде препаратпен емдеуді зерттеу жүргізілген жоқ.

### **Фармакодинамикасы**

#### *Әсер ету механизмі*

Тамсулозин постсинапстық  $\alpha_1$ -адренорецепторлармен, әсіресе  $\alpha_{1A}$  және  $\alpha_{1D}$  қосалқы типтерімен селективті және бәсекелес байланысады. Осылайша,

простата мен уретраның тегіс бұлшықеттерінің босансуына қол жеткізіледі, ол тонустың азаюына және несеп шығарудың жақсаруына әкеледі.

#### *Фармакодинамикалық әсерлері*

Тамсулозин қуықасты безінің және уретраның тегіс бұлшықеттерінің тонусын төмендетіп, несептің ағынын жақсартады. Бұл обструкция симптомдарының азаюына және несеп шығарудың жеңілдеуіне әкеледі. Тамсулозин сондай-ақ олардың пайда болуында қуықтың тұрақсыз жағдайы маңызды рөл атқаратын толу симптомдарын төмендетеді. Несептің іркілуіне және несептің шығарылуының бұзылуына қатысты әсерлер ұзақ ем кезінде сақталады. Бұл әсерлер хирургиялық ем немесе катетеризация жүргізу қажеттілігінің едәуір кейінге қалдырылуына мүмкіндік береді.

$\alpha 1$ -блокаторлар шеткергі кедергіні төмендете отырып, артериялық қысымды азайтады. Артериялық қысымы қалыпты пациенттерде артериялық қысымның клиникалық тұрғыдан маңызды төмендеуі байқалған жоқ.

#### **Қолданылуы**

- қуық асты безінің қатерсіз гиперплазиясы (ҚБҚГ) кезіндегі дизуриялық бұзылыстарда.

#### **Қолдану тәсілі және дозалары**

Таңертеңгі астан немесе тағамды бірінші рет қабылдағаннан кейін күн сайын бір капсуладан ішке қабылданады. Капсуланы, оның бүтіндігін бұзбай және шайнамай, тұтасымен жұтады, өйткені бұл әсер етуші заттың босап шығуының бақылануына ықпалын тигізуі мүмкін.

Емдеу курсы емдеуші дәрігер әр адамға жеке белгілейді.

#### **Жағымсыз әсерлері**

*Жиі ( $\geq 1/100$ -ден  $< 1/10$ -ға дейін)*

- бас айналу

*Жиі емес ( $\geq 1/1000$ -нан  $< 1/100$ -ге дейін)*

- бас ауыру

- жүректің қағуы

- ортостатикалық гипотензия

- ринит

- іш қату, диарея, жүректің айнуы, құсу

- бөртпе, қышыну, есекжем

- астения

*Сирек ( $\geq 1/10000$ -нан  $< 1/1000$ -ға дейін)*

- естен тану

- ангионевроздық ісіну

*Өте сирек ( $< 1/10000$ )*

- приапизм

- Стивенс-Джонсон синдромы

*Жиілігі белгісіз* (қолда бар деректер бойынша анықтауға келмейді)

- көрудің көмескіленуі, көрудің нашарлауы

- мұрыннан қан кету

- мультиформалы эритема, эксфолиативті дерматит

- эякуляцияның бұзылуы, ретроградты эякуляция, эякуляцияның болмауы

- ауыз ішінің құрғауы

Препаратты постмаркетингтік кезеңде пайдаланғанда катарактаға қатысты хирургиялық операция жүргізу кезінде тамсулозинді қолданумен астасатын «көздің мөлдір қабығының интраоперациялық тұрақсыздығы» (Intraoperative Floppy Iris Syndrome) синдромы деп аталатын қарашықтың тарылу синдромы жағдайлары байқалды.

Постмаркетингтік қолдану тәжірибесі: жоғарыда аталған жағымсыз реакциялармен қатар, тамсулозин гидрохлоридін қолданумен астасатын жүрекшелердің фибрилляциясы, аритмия, тахикардия және енгізу жағдайлары жөнінде мәлімдемелер бар. Бүкіл әлемде постмаркетингтік қолдану тәжірибесі жөніндегі кездейсоқ мәлімдемелерде осы құбылыстар туралы айтылуына байланысты, осындай реакциялардың пайда болуында тамсулозиннің рөлін және жағдайлардың жиілігін нақты анықтау мүмкін емес.

Медициналық қызметкерлерге медициналық препараттың пайда/қауіп теңгерімін бағалауға мүмкіндік беретін ұлттық есептілік жүйесі арқылы жағымсыз реакцияларға күдіктердің бары туралы хабарлау ұсынылады.

### **Қолдануға болмайтын жағдайлар**

- тамсулозин гидрохлоридіне немесе дәрі-дәрмектік ангионевроздық ісінуді қоса, қосымша заттардың кез келгеніне жоғары сезімталдық

- анамнезде ортостатикалық гипотензия

- ауыр бауыр жеткіліксіздігі

- сақтықпен – бүйректің ауыр жеткіліксіздігі (креатинин клиренсі минутына 10 мл-ден аз)

- 18 жасқа дейінгі балалар

### **Дәрілермен өзара әрекеттесуі**

Дәрілік өзара әрекеттесу туралы зерттеулер тек қана ересектерге жүргізілген.

Тамсулозин гидрохлоридін атенололмен, эналаприлмен немесе теofilлинмен қатар тағайындағанда ешқандай өзара әрекеттесулер байқалған жоқ. Циметидинмен бір мезгілде қолданғанда қан плазмасындағы тамсулозин концентрациясы жоғарылайды; фуросемидпен бірге – концентрация төмендейді, алайда бұл Фокусин® дозасын өзгертуді талап етпейді, өйткені препарат концентрациясы қалыпты ауқымдық шегінде қалады.

Диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадинон, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин және варфарин адам плазмасында тамсулозиннің бос фракциясына *in vitro* ықпал етпейді. Тамсулозин сияқты диазепамның, пропранололдың, трихлорметиазидтің және хлормадинонның бос фракцияларына ықпалын тигізбейді.

Диклофенак және варфарин тамсулозиннің шығарылу жылдамдығын біршама арттыруы мүмкін.

Тамсулозин гидрохлоридін CYP3A4 күшті тежегіштерімен бір мезгілде қолдану тамсулозин гидрохлориді әсерінің күшеюіне әкелуі мүмкін. Кетоконазолмен (белгілі CYP3A4 күшті тежегіші) қатарластыра қабылдау тамсулозин гидрохлоридінің AUC және  $C_{max}$  мәндерінің, сәйкесінше, 2,8 және 2,2 есе артуына әкелді.

CYP2D6 бойынша «баяу метаболизатор» фенотипі бар науқастарда тамсулозин гидрохлоридін CYP3A4 күшті тежегіштерімен бірге қолданбаған жөн.

Тамсулозин гидрохлоридін CYP3A4 күшті және орташа тежегіштерімен бірге қолданғанда сақ болған жөн.

Тамсулозин гидрохлоридін пароксетинмен, CYP2D6 күшті тежегішімен бір мезгілде қолдану, тамсулозиннің  $C_{max}$  және AUC мәндерінің, сәйкесінше, 1,3 және 1,6 есеге артуына әкелді, алайда бұл арту клиникалық тұрғыдан маңызды деп саналмайды.

$\alpha_1$ -адренорецепторлардың басқа антагонистерін бір мезгілде тағайындау гипотензиялық әсерінің күшеюіне әкеп соғуы мүмкін.

### **Айрықша нұсқаулар**

$\alpha_1$ -адренорецепторлардың басқа антагонистерін қолданған кездегідей, тамсулозин гидрохлоридімен емдеген кезде жекелеген жағдайларда қанның АҚ төмендеуі мүмкін, өте сирек – естен тану жағдайының дамуы. Ортостатикалық гипотензияның алғашқы симптомдарында пациентті осы симптомдар жоғалғанша отырғызған немесе жатқызған жөн. Тамсулозин гидрохлоридімен емдеуді бастар алдында науқас симптомдары қуықасты безінің қатерсіз гиперплазиясы симптомдарына ұқсас болатын басқа аурулардың бар-жоқтығына мұқият тексерілуі тиіс. Емдеуді бастар алдында және әрі қарай тоқ ішек арқылы қуықасты безін саусақтармен тексеруді жүйелі жүргізу және қажет болғанда простатаның спецификалық антигенінің (ПСА) деңгейін анықтау қажет.

Ауыр бүйрек жеткіліксіздігі бар (креатинин клиренсі минутына <10 мл) пациенттерді емдегенде, бұл пациенттер зерттелмегендіктен, сақтық таныту керек.

Тамсулозинді пайдаланғаннан кейін ангионевроздық ісінулер туралы сирек хабарланған. Ангионевроздық ісіну жағдайында емдеу дереу тоқтатылуы тиіс, пациент ісіну жоғалғанша бақылауда болуы керек, тамсулозин де қайтадан қолданылмауы тиіс.

Тамсулозин гидрохлоридімен емделген және емделіп жүрген кейбір пациенттердегі катаракта операциясы кезінде көздің нұрлы қабығының

интраоперациялық синдромы (Intraoperative Floppy Iris Syndrome, қарашықтың тарылу синдромы) байқалды.

Қарашықтың тарылу синдромы операция кезінде және операциядан кейін ұлғайған емшаралық асқынуларға әкеп соғуы мүмкін.

Тамсулозинмен емдеуді катаракта операциясына дейін 1-2 апта тоқтату мақсатқа сай деп есептеледі, алайда тамсулозинмен емдеуді тоқтатқаннан пайда анықталған жоқ. Қарашықтың тарылу синдромы туралы операцияға дейін ұзақ уақыт тамсулозинді тоқтатқан пациенттерде де хабарланған.

Катарактаға қатысты хирургиялық операция жоспарланған науқастарды тамсулозин гидрохлоридімен емдеуді бастамай тұра тұру керек. Операция алдындағы дайындық кезінде хирургтар және офтальмологтар командасы операция кезінде қарашықтың тарылу синдромының болжамды дамуын басқара алатын талапқа сай шараларды қабылдау үшін тамсулозинмен емделгенін немесе емделіп жүргенін назарға алу керек.

СҮР2D6 бойынша «баяу метаболизатор» фенотипі бар науқастарда тамсулозин гидрохлоридін СҮР3А4 күшті тежегіштерімен бірге қолданбаған жөн.

Тамсулозин гидрохлоридін СҮР3А4 күшті және қалыпты тежегіштерімен бірге сақтықпен пайдалану керек.

*Жүктілік және лактация кезеңі*

Тамсулозин әйелдерді емдеуге арналмаған.

Эякуляцияның бұзылулары тамсулозинмен қысқа мерзімді және ұзақ мерзімді клиникалық зерттеулерде байқалған. Эякуляцияның бұзылыс, ретроградтық эякуляция жағдайлары және шәуһет шығуының жеткіліксіздігі тіркеуден кейінгі кезеңде тіркелген.

*Дәрілік заттың көлік құралын немесе қауіптілігі зор механизмдерді басқару қабілетіне әсер ету ерекшеліктері*

Аппараттарды жүргізу және басқару қабілетіне тигізетін әсерлеріне зерттеулер жүргізілмеген. Алайда пациенттерге бас айнарудың дамуы мүмкін екенін мәлімдеу керек.

### **Артық дозалануы**

*Симптомдары:* ауыр гипотензия туындауы мүмкін (ол әртүрлі дәрежедегі артық дозалануда байқалды).

*Емі:* Жүрек-қантамыр жүйесі функциясын демейтін шараларды жүргізу қажет етіледі. Артық дозаланғаннан кейін пайда болатын жедел гипотензия жағдайында жүрек-қантамыр жүйесін демеудің емдік шараларын жүргізу қажет. Артериялық қысымды және жүректің жиырылу жиілігін пациентті жатқызу арқылы қалпына келтіруге болады. Бұл шаралар тиімсіз болған жағдайда көлемін алмастыратын ерітінділерді енгізу және қажет болғанда қантамырларды тарылтатын дәрілерді енгізу қажет етіледі. Бүйрек функциясын бақылау және оны демеуге бағытталған шараларды жүргізу қажет. Диализ тиімді емес, өйткені тамсулозин қан плазмасы ақуыздарымен өте үлкен мөлшерлерде байланысады. Сіңуіне жол бермеу үшін құстыру қажет. Препараттың үлкен мөлшерімен артық

дозаланған жағдайда асқазанды шаю, сондай-ақ белсендірілген көмір және осмостық іш айдағыш дәрілерді, мысалы, натрий сульфатын тағайындау қажет.

### **Шығарылу түрі және қаптамасы**

Қатты түссіз поливинилхлоридті үлбірден және алюминий фольгадан жасалған пішінді ұяшықты қаптамаға 10 капсуладан салынған.

Пішінді ұяшықты 3, 9 және 10 қаптама медициналық қолдану жөнінде мемлекеттік және орыс тілдеріндегі нұсқаулықпен бірге картон қорапшаға салынады.

### **Сақтау шарттары**

+10°C-ден +25°C-ге дейінгі температурада. Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек.

### **Сақтау мерзімі**

3 жыл

Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін қолдануға болмайды.

### **Дәріханадан босатылу шарттары**

Рецепт арқылы

### **Өндіруші**

Санека Фармасьютикалс а.с., Словак Республикасы

### **Тіркеу куәлігінің иесі**

Зентива к.с., Чех Республикасы.

***Қазақстан Республикасы аумағында тұтынушылардан өнім (тауар) сапасына қатысты шағымдар қабылдайтын ұйымның мекенжайы***

«Санofi-авентис Қазақстан» ЖШС

Қазақстан Республикасы, 050013,

Алматы қ., Фурманов к-сі 187 Б

телефон: +7 (727) 244-50-96

факс: +7 (727) 258-25-96

e-mail:quality.info@sanofi.com

***Қазақстан Республикасы аумағында дәрілік заттың тіркеуден кейінгі қауіпсіздігін қадағалауға жауапты ұйымның атауы, мекенжайы және байланыс деректері (телефон, факс, электронды пошта):***

«Санofi-авентис Қазақстан» ЖШС

Қазақстан Республикасы, 050013,

Алматы қ., Фурманов к-сі 187 Б

телефон: +7(727) 244-50-96

факс: +7 (727) 258-25-96

e-mail: [Kazakhstan.Pharmacovigilance@sanofi.com](mailto:Kazakhstan.Pharmacovigilance@sanofi.com)