

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
Фокусин® (FOKUSIN)

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: ФОКУСИН®

Международное непатентованное название: Тамсулозин

Лекарственная форма: капсулы с модифицированным высвобождением

Состав

Действующее вещество:

Тамсулозина гидрохлорид 0,4 мг

Вспомогательные вещества: метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1] 30 % дисперсия, целлюлоза микрокристаллическая (тип 105), дибутилсебакат, полисорбат 80, кремния диоксид коллоидный, тальк.

Оболочка капсулы: краситель азорубин, краситель синий патентованный, желатин.

Описание

Твердые желатиновые капсулы №1. Корпус и крышечка: темно-синего цвета, прозрачные.

Содержимое капсул: белые или почти белые микропеллеты.

Фармакотерапевтическая группа

Альфа1-адреноблокатор

Код АТХ: G04CA02

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Тамсулозин избирательно и конкурентно блокирует постсинаптические α_{1A} -адренорецепторы гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и α_{1D} -адренорецепторы мочевого пузыря, что приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры, улучшению функции детрузора и уменьшению симптомов обструкции и раздражения, связанных с доброкачественной гиперплазией предстательной железы.

Как правило, терапевтический эффект развивается через 2 недели после начала приема препарата, хотя у ряда пациентов уменьшение выраженности симптомов отмечается после приема первой дозы.

Способность тамсулозина воздействовать на α_{1A} -адренорецепторы в 20 раз превосходит его способность воздействовать на α_{1B} -адренорецепторы гладких мышц сосудов. Благодаря такой высокой селективности препарат не вызывает какого-либо клинически значимого снижения системного артериального давления (АД) как у пациентов с артериальной гипертензией, так и у пациентов с нормальным исходным АД.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь тамсулозин быстро и практически полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ), его биодоступность - почти 100 %. После однократного приема препарата Фокусин® внутрь в дозе 400 мкг C_{max} активного вещества в плазме достигается через 6 ч.

Распределение

Через 5 дней курсового приема значение C_{max} активного вещества в плазме крови на 60-70 % выше, чем C_{max} после однократного приема. Связывание с белками плазмы – 99 %. Объем распределения тамсулозина незначительный (приблизительно 0,2 л/кг).

Метаболизм

Тамсулозин не подвергается эффекту "первого прохождения" и медленно биотрансформируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов, сохраняющих высокую селективность к α_{1A} -адренорецепторам. Большая часть активного вещества присутствует в крови в неизмененном виде.

Выведение

Тамсулозин выводится почками, 9 % дозы выводится в неизмененном виде. $T_{1/2}$ тамсулозина при однократном приеме - 10 ч, после многократного приема - 13 ч, конечное время полувыведения - 22 ч.

Показания к применению

Лечение функциональных расстройств при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к компонентам препарата;

- Ортостатическая гипотензия (в т.ч. в анамнезе);
- Выраженная печеночная недостаточность.
- Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

С осторожностью:

- Хроническая почечная недостаточность (снижением клиренса креатинина ниже 10 мл/мин);
- Артериальная гипотензия (в т.ч. ортостатическая);
- Запланированная операция по поводу катаракты;
- При совместном использовании с мощными или умеренно активными ингибиторами изофермента CYP3A4 (например, кетоконазол, вориконазол)

Способ применения и дозы

Препарат назначают по 400 мкг (1 капсула) в сутки.

Капсулы принимают после первого приема пищи, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

Фокусин® может назначаться, как в виде монотерапии, так и в сочетании с ингибиторами 5 α – редуктазы (финастерид, дутастерид).

Побочное действие

Частота нежелательных реакций представлена в соответствии с классификацией Медицинского словаря по нормативно-правовой деятельности (MedDRA):

Очень часто: (> 10 %),

Часто: ($\geq 1\% < 10\%$),

Нечасто: ($\geq 0,1\% < 1\%$),

Редко: ($\geq 0,01\% < 0,1\%$),

Очень редко: (< 0,01 %),

Частота неизвестна: (определить частоту встречаемости по имеющимся данным не представляется возможным).

- *Нарушения со стороны иммунной системы*

Очень редко: реакции гиперчувствительности.

- *Нарушения со стороны нервной системы*

Часто: головокружение.

Нечасто: головная боль

Редко: синкопальные состояния.

Частота неизвестна: нарушение сна (сонливость или бессонница).

- *Нарушения со стороны органа зрения*

Частота неизвестна: нечеткость зрения, нарушение зрения.

- *Нарушения со стороны сердца*

Нечасто: сердцебиение.

Частота неизвестна: тахикардия.

- *Нарушения со стороны сосудов*

Нечасто: ортостатическая гипотензия.

- *Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения*

Нечасто: ринит.

Частота неизвестна: носовое кровотечение.

- *Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта*

Редко: тошнота, рвота, запор или диарея.

- *Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей*

Нечасто: кожная сыпь, зуд, крапивница.

Редко: ангионевротический отек.

Очень редко: синдром Стивенса-Джонсона.

Частота неизвестна: мультиформная эритема, эксфолиативный дерматит.

- *Нарушения со стороны половых органов и молочной железы*

Очень редко: приапизм.

Частота неизвестна: нарушения эякуляции, в том числе ретроградная эякуляция, снижение либидо.

- *Общие расстройства и нарушения в месте введения*

Нечасто: астенический синдром.

Частота неизвестна: боль в спине, боль в грудной клетке, сухость во рту.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение артериального давления.

Лечение: кардиотропная терапия, контроль функции почек, общая поддерживающая терапия, введение объемозамещающих растворов или сосудосуживающих препаратов.

Для предотвращения дальнейшей абсорбции тамсулозина возможно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Одновременное применение тамсулозина с другими α 1-адреноблокаторами может привести к снижению АД.

Диклофенак и непрямые антикоагулянты (варфарин) несколько увеличивают скорость выведения тамсулозина.

Циметидин повышает концентрацию тамсулозина в плазме, а фуросемид - снижает (существенного клинического значения не имеет).

При совместном применении тамсулозина с атенололом, эналаприлом или теофиллином признаки лекарственного взаимодействия отсутствовали.

В условиях *in vitro* введение диазепама, пропранолола, трихлорметиазида, хлормадинона, амитриптилина, диклофенака, глибенкламида, симвастатина и варфарина не приводило к изменению свободной фракции тамсулозина в плазме крови. Тамсулозин также не оказывал влияния на свободные фракции диазепама, пропранолола, трихлорметиазида и хлормадинона.

Совместное применение тамсулозина и мощных ингибиторов изофермента CYP3A4 может вызывать повышение системной экспозиции тамсулозина. Одновременный прием тамсулозина с кетоконазолом (мощным ингибитором изофермента CYP3A4) приводило к возрастанию показателей AUC и C_{max} тамсулозина в 2,8 и 2,2 раза, соответственно.

Тамсулозин не должен применяться в комбинации с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 у пациентов с фенотипом «медленного метаболизма» по изоферменту CYP2D6.

Следует соблюдать осторожность при совместном использовании тамсулозина с мощными или умеренно активными ингибиторами изофермента CYP3A4.

Особые указания

До начала терапии препаратом Фокусин[®] необходимо исключить наличие других заболеваний, которые могут вызывать такие же симптомы, как и доброкачественная гиперплазия предстательной железы. Перед началом лечения и регулярно во время терапии должно проводиться обследование предстательной железы (пальцевое ректальное обследование, определение простатического специфического антигена (ПСА)).

Как и при использовании других альфа1-адреноблокаторов, при лечении препаратом Фокусин[®] в отдельных случаях может наблюдаться снижение АД, которое может приводить к обморочному состоянию.

Препарат Фокусин® следует применять с осторожностью у пациентов с предрасположенностью к ортостатической гипотензии (см. раздел «С осторожностью»).

При первых признаках ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) больного следует усадить или уложить.

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

При развитии ангионевротического отека, а также других иммунологических реакций, таких как синдром Стивенса-Джонсона, применение препарата следует немедленно прекратить. Пациент должен находиться под наблюдением до ликвидации данного патологического состояния; повторное назначение тамсулозина не допускается.

При проведении хирургических операций по поводу катаракты у некоторых пациентов, получавших тамсулозина гидрохлорид на момент операции или в прошлом, имело место развитие синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза (синдром узкого зрачка). Возникновение синдрома интраоперационной нестабильности радужной оболочки глаза может приводить к повышению риска осложнений со стороны органа зрения во время и после операции.

Тамсулозина гидрохлорид не должен применяться в комбинации с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 (например, кетоконазол, вориконазол) у пациентов с фенотипом «медленного метаболизма» по изоферменту CYP2D6.

Тамсулозин не предназначен для применения у женщин.

Форма выпуска

Капсулы с модифицированным высвобождением 0,4 мг.

По 10 капсул в блистере из ПВХ/ПВДХ/А1. По 3, 6, 9 или 10 блистеров вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать после даты, указанной на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.