

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1.Търговско име на лекарствения продукт

FOKUSIN

2.Количествен и качествен състав

Лекарствено вещество: Всяка капсула съдържа tamsulosin hydrochloride 0.4 mg, еквивалентни на tamsulosin 0.367 mg.

Помощни вещества: виж т. 6.1.

3. Лекарствена форма

Капсули с изменено освобождаване, твърди

Външен вид: тъмно сини твърди желатинови капсули, съдържащи бели до почти бели пелети.

4. Клинични данни

4.1. Показания

Симптоми на долните пикочни пътища (LUTS) на основата на доброкачествена хиперплазия на простатата (BPH).

4.2. Дозировка и начин на употреба

Една капсула дневно след закуска или след първото хранене за деня.

Капсулите се поглъщат цели, без да се чупят или дъвчат, тъй като в противен случай контролираното освобождаване на лекарственото вещество ще бъде нарушено.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към tamsulosin hydrochloride или към някое от помощните вещества.

Ортостатична хипотензия в анамнезата.

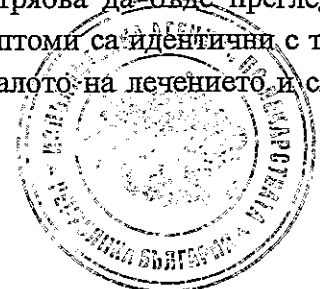
Тежка чернодробна недостатъчност.

4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба

Подобно на другите алфа₁-блокери, в отделни случаи, по време на лечението с tamsulosin е възможно понижаване на кръвното налягане и във връзка с това, много рядко е наблюдавана появата на слабост. При първите симптоми на ортостатична хипотензия (замаяност, слабост), пациентът трябва да седне или да легне до изчезването на тези симптоми.

Преди започване на лечението с tamsulosin пациентът трябва да бъде прегледан внимателно, за да се изключат други заболявания, чиито симптоми са идентични с тези на доброкачествената хиперплазия на простатата. Преди началото на лечението и след

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-12543/07.05.06	
691/28.02.06	Мерц



това, периодично трябва да се провежда дигитално изследване през ректума и ако е необходимо, да се определи нивото на специфичния простатен антиген (PSA).

Специално внимание е необходимо при лечение на пациенти с тежки увреждания на бъбреците (креатининов клирънс под 10 ml/min), тъй като няма данни от клинични изследвания при тези пациенти.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Не са наблюдавани взаимодействия при едновременно прилагане на tamsulosin и атенолол, еналаприл, нифедипин или теофилин. Едновременното прилагане с циметидин води до повишаване на плазмените нива на tamsulosin, а едновременното прилагане с фуросемид предизвиква тяхното понижаване. Нивата на tamsulosin, обаче, остават в нормални граници и следователно, не е необходимо да се променя дозировката.

При *in vitro* условия диазепам, пропранолол, трихлорметиазид, хлормадион, амитриптилин, диклофенак, глибенкламид, симвастатин и варфарин не променят свободната фракция на tamsulosin в човешката плазма. Tamsulosin не променя свободните фракции на диазепам, пропранолол, трихлорметиазид и хлормадион.

По време на *in vitro* изследване на микрозомната фракция на черения дроб (помагащо за изследването на ензимната система на цитохром P450, която участва в метаболизма на лекарствата), не са потвърдени взаимодействия с амитриптилин, салбутамол, глибенкламид и финастерид на ниво чернодробен метаболизъм. Диклофенак и варфарин, обаче, могат да увеличат скоростта на елиминиране на tamsulosin. Едновременното прилагане на други антагонисти на адренергичните алфа₁-рецептори може да доведе до хипотензия.

4.6. Бременност и кърмене

Лекарственият продукт е предназначен за лечение само на мъже.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма данни, дали tamsulosin може да повлияе неблагоприятно или не вниманието по време на шофиране и работа с машини. Въпреки това, пациентите трябва да бъдат информирани за възможността от появата на замаяност.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Много чести (>1%, <10%)

Нервна система: замаяност (1,3%).

Чести (>0,1%, <1%)

Нервна система: главоболие.

Сърдечно-съдова система: палпитации, ортостатична хипотензия.

Дихателна система, гръден кош и медиастриум: ринит.

Стомашно-чревен тракт: констипация, диария, гадене, повръщане.

Кожа и подкожни тъкани: обрив, сърбеж, уртикария.



Репродуктивна система: нарушения на еякулацията.

Общи и други неклассифицирани нарушения и локални реакции след приложение: астения.

Нечести (>0,01%, <0,1%)

Нервна система: синкоп.

Кожа и подкожни тъкани: ангиоедема.

Редки (<0,01%)

Репродуктивна система: приапизъм.

4.9. Предозиране

Не са докладвани случаи на остро предозиране. Теоретично, в такъв случай може да се развие остра хипотензия, изискваща мерки за поддържане на функциите на сърдечно-съдовата система. Нормалните стойности на кръвното налягане и сърдечната честота ще се възстановят по-бързо, ако пациентът е легнал. В случай, че поставянето в хоризонтално положение не доведе до нормализиране на кръвното налягане и сърдечната честота, могат да се използват средства, повишаващи интраваскуларния обем и ако е необходимо, трябва да се приложат вазоконстриктивни средства. Трябва да се започне обща поддържаща терапия и да се следи бъбречната функция. Диализата вероятно няма да има желания ефект, тъй като tamsulosin се свързва с плазмените протеини в кръвта в много висока степен.

За да се спре резорбцията, трябва да се предизвика повръщане. В случай на предозиране с голямо количество субстанция, трябва да се направи стомашна промивка и да се приложат активен въглен и осмотично-активни лаксативи, като натриев сулфат.

5. Фармакологични свойства

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група:

Адренергичен алфа₁-рецепторен антагонист

АТС код: G04CA02

Лекарственият продукт е предназначен изключително за лечение на заболявания на простатата.

Механизъм на действие:

Tamsulosin се свързва селективно и конкурентно към пост-синаптичните алфа₁-рецептори, предимно към подтипове алфа_{1A} и алфа_{1D}. Така се постига отпускане на гладките мускули на простатата и уретрата, което води до намаляване на напрежението и подобряване на уриноотделянето.

Фармакодинамични свойства:

Tamsulosin увеличава максималния поток на урината. Поради отпусването на гладките мускули на простатата и уретрата, обструкцията намалява, което води до облекчаване на



уринирането. Tamsulosin също така облекчава симптомите на задържане, развитието на които, също в значителна степен се дължи на нестабилността на пикочния мехур. При продължително лечение ефектът върху симптомите, свързани с пълненето и изпразването на пикочния мехур, се запазва. Поради това, необходимостта от хирургическа намеса или катетаризация се отлага значително.

Алфа₁-блокери могат да предизвикат понижаване на кръвното налягане поради намаляване на периферното съпротивление. По време на изследванията на tamsulosin не е наблюдавано клинично значимо понижаване на кръвното налягане.

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Tamsulosin се абсорбира от тънките черва и неговата бионаличност е почти пълна. Абсорбцията на tamsulosin се повишава, ако продуктът се приема скоро след хранене. При приема на FOKUSIN винаги след хранене по едно и също време на деня може да се поддържа постоянна абсорбция.

Кинетиката на tamsulosin е линейна.

След прилагането на единична доза tamsulosin след хранене, максимални стойности на концентрацията в плазмата се достигат приблизително до 6 часа. При устойчиво състояние, което се достига до петия ден след многократно прилагане, C_{max} е около две трети по-висока, отколкото след прилагането на единична доза. Повишаването е наблюдавано при възрастни пациенти; същото може да се очаква и при млади пациенти.

Съществуват значителни индивидуални различия в плазмените нива, достигнати, както след еднократен прием, така и след многократно прилагане при отделните пациенти.

Разпределение

При хора приблизително 99% от tamsulosin се свързва с плазмените протеини в кръвта и неговият обем на разпределение е нисък (приблизително 0,2 l/kg).

Биотрансформация

Tamsulosin се метаболизира бавно и first-pass ефектът е малък. Основната част от tamsulosin присъства в плазмата в непроменена форма. Tamsulosin се метаболизира в черния дроб.

При плъхове, индукция на микрозомални чернодробни ензими, предизвикана от tamsulosin практически не се наблюдава.

Не е доказана необходимостта от коригиране на дозата в случай на чернодробна недостатъчност.

Никой от метаболитите не проявява активност по-висока от тази на изходната субстанция.

Елиминиране

Tamsulosin и неговите метаболити се екскретират предимно с урината; приблизително 9% от приетата доза се отделя в непроменена форма.

След приложение на единична доза tamsulosin след хранене, елиминационният полуживот е приблизително 10 часа. Ако плазменото ниво на субстанцията е в



равновесно състояние (steady state), елиминационният полуживот е приблизително 13 часа.

Не е доказана необходимостта от намаляване на дозата на tamsulosin при бъбречни увреждания.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Токсичността, както след еднократен, така и след многократен прием, е изследвана върху мишки, плъхове и кучета. По-нататък, репродуктивната токсичност е изследвана върху плъхове, канцерогенността – при мишки и плъхове, а също генотоксичността – in vivo и iv vitro.

Цялостният токсикологичен профил, както се вижда при високи дози tamsulosin, отговаря на известната фармакологична активност на алфа-адренергичните блокери.

Много високи дози предизвикват промени в ЕКГ на кучета, но те се оценяват като клинично несъществени. Tamsulosin не показва никакви значими генотоксични свойства.

Наблюдавана е повишена честота на полиферативни изменения на млечните жлези при женски плъхове и мишки. Тези находки, които вероятно са предизвикани от хиперпролактинемия и се появяват само при високи дози, се оценяват като клинично несъществени.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества

Dispersion of copolymer 1:1 30%, microcrystalline cellulose, dibutyl sebacate, polysorbate 80, colloidal hydrated silica, talc.

Капсули: azorubin, patent blue V, gelatin.

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

2 години

6.4. Специални условия на съхранение

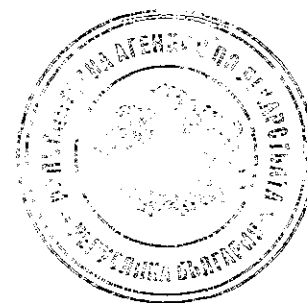
Няма специални изисквания за съхранение.

6.5. Данни за опаковката

Блистер от прозрачно PVC-PVDC/Al фолио, указание за употреба, картонена кутия.

Съдържание на 1 опаковка:

30, 90 или 100 капсули



6.6. Препоръки при употреба

За перорално приложение.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

ZENTIVA a.s.,
U kabelovny 130, Dolni Mecholupy,
102 37 Prague 10, Czech Republic

8. Регистрационен № в регистъра по чл. 28 от ЗЛАХМ

**9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт
(подновяване на разрешението)**

Дата на последна редакция на текста: 23. 03. 2005

