

# КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

## 1. Търговско име на лекарствения продукт

**FOKUSIN®**

ОДОБРЕН  
ДАТ. R-5559/21.07.09

## 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 алфа<sub>1</sub>-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 след



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 алфа<sub>1</sub>-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 желан 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 алфа<sub>1</sub>-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 алфа<sub>1</sub>-рецептори, предимно към подтипове алфа<sub>1A</sub> и алфа<sub>1D</sub>. 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 отпускането 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.

Алфа<sub>1</sub>-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



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**

3 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 k.s.,  
U kabelovny 130, Dolni Mecholupy,  
102 37 Prague 10, Чешка Република

**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:**

