Фокусин



Код АТХ:

- G04CA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Тамсулозин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Капсулы с модифицированным высвобождением твердые желатиновые, размер №1, корпус и крышечка темно-синего цвета, прозрачные; содержимое капсул - микропеллеты белого или почти белого цвета.

	1 капс.
тамсулозина гидрохлорид	400 мкг

Вспомогательные вещества: сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата (1:1) 30% дисперсия - 74.9 мг (в форме твердого вещества)*, целлюлоза микрокристаллическая - 257.1 мг, дибутилсебакат - 8.4 мг, полисорбат 80 - 500 мкг, кремния диоксид коллоидный - 3.7 мг, тальк - 300 мкг.

Состав оболочки капсулы: краситель азорубин - 0.2%, краситель синий патентованный - 0.12%, желатин - до 100%.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

* для одной капсулы используется 30% дисперсия сополимера метакриловой кислоты и этилакрилата (1:1) в количестве 249.67 мг, которое соответствует 74.9 мг в форме твердого вещества.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Блокатор α_1-адренорецепторов. Избирательно и конкурентно блокирует постсинаптические α_1- адренорецепторы гладкой мускулатуре предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры и Н-адренорецепторы мочевого пузыря, что приводит к снижению тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы, шейки мочевого пузыря и простатической части уретры, улучшению функции детрузора, уменьшению симптомов обструкции и раздражения, связанные с доброкачественной гиперплазией предстательной железы.

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

Способность тамсулозина воздействовать на α-адренорецепторы в 20 раз превосходит его способность взаимодействовать с Н-адренорецепторами, которые расположены в гладких мышцах сосудов. Благодаря такой высокой селективности препарат не вызывает какого-либо клинически значимого снижения системного 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 ЖКТ. Биодоступность препарата - около 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 значения C_{max} активного вещества в плазме крови на 60-70% выше, чем C_{max} после однократного приема препарата.

Связывание с белками плазмы - 99%. V_d 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-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, конечный $T_{1/2}$ - 22 ч.

Показания к применению:

— лечение функциональных расстройств при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Относится к болезням:

- Гиперплазия предстательной железы

Противопоказания:

— ортостатическая гипотензия (в т.ч. в анамнезе);

— выраженная печеночная недостаточность;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при хронической почечной недостаточности (КК менее 10 мл/мин), артериальной гипотензии (в т.ч. ортостатической), запланированной операции по поводу катаракты, при одновременном применении мощных и умеренно активных ингибиторов изофермента CYP3A4 (например, кетоконазол, вориконазол).

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь в дозе 400 мкг (1 капс.)/сут.

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

Фокусин может применяться как в качестве монотерапии, так и в сочетании с ингибиторами 5α-редуктазы (финастерид, дутастерид).

Побочное действие:

Частота нежелательных реакций представлена в соответствии с классификацией Медицинского словаря по нормативно-правовой деятельности (MedDRA): очень часто (>10%), часто (≥1%, <10%), нечасто (≥0.1%, <1%), редко (≥0.01%, <0.1%), очень редко (<0.01%), частота неизвестна (определить частоту встречаемости по имеющимся данным не представляется возможным).

Со стороны иммунной системы: очень редко - реакции гиперчувствительности.

Со стороны нервной системы: часто - головокружение; нечасто - головная боль; редко - синкопальные состояния; частота неизвестна - нарушение сна (сонливость или бессонница).

Со стороны органа зрения: частота неизвестна - нечеткость зрения, нарушение зрения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ощущение сердцебиения, ортостатическая гипотензия; частота неизвестна - тахикардия.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - ринит; частота неизвестна - носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительной системы: редко - тошнота, рвота, запор или диарея; частота неизвестна - сухость во рту.

Со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко - синдром Стивенса-Джонсона; частота неизвестна - многоформная эритема, эксфолиативный дерматит.

Со стороны половых органов и молочной железы: очень редко - приапизм; частота неизвестна - нарушения эякуляции (в т.ч. ретроградная эякуляция), снижение либидо.

Аллергические реакции: нечасто - кожная сыпь, зуд, крапивница; редко - ангионевротический отек.

Общие расстройства: нечасто - астенический синдром; частота неизвестна - боль в спине, боль в грудной клетке.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД.

Лечение: проведение кардиотропной терапии, общей поддерживающей терапии, контроль функции почек, введение объемозамещающих растворов или сосудосуживающих препаратов. Для предотвращения дальнейшей абсорбции тамсулозина возможно промывание желудка, прием активированного угля или осмотического слабительного.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Тамсулозин не предназначен для применения у женщин.

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 одновременном 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.

Одновременное применение тамсулозина и мощных ингибиторов CYP3A4 может вызывать повышение системной экспозиции тамсулозина. Одновременное применение тамсулозина с кетоконазолом (мощным ингибитором изофермента CYP3A4) приводило к возрастанию показателей AUC и C_{max} тамсулозина в 2.8 раза и 2.2 раза, соответственно.

Тамсулозин не следует применять в комбинации с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 у пациентов с фенотипом "медленного метаболизма" по изоферменту CYP2D6.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении тамсулозина с мощными и умеренно активными ингибиторами изофермента CYP3A4.

Особые указания и меры предосторожности:

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 ПСА).

Как и при применении других α_1-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.

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

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

При проведении хирургических операций по поводу катаракты у некоторых пациентов, получавших тасмулозина гидрохлорид на момент операции и 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 следует применять в комбинации с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 у пациентов с фенотипом "медленного метаболизма" по изоферменту CYP2D6.

Тамсулозин не предназначен для применения у женщин.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В случае возникновения головокружения необходимо воздержаться от управления автотранспортом и выполнения других потенциально опасных видов деятельности.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует применять препарат при хронической почечной недостаточности (КК менее 10 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказано применение препарата при выраженной печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан к применению в детском и подростковом возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте. Специальных условий хранения не требуется.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Fokusin