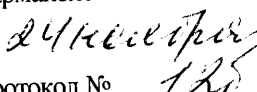


МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

«УТВЕРЖДАЮ»
Руководитель Департамента Государственного
контроля лекарственных средств и медицинской
техники МЗ РФ


В.Е. Акимочкин
«14» декабря 2003 г.

ОДОБРЕНО
Фармакологическим Комитетом МЗ РФ


24 ноября 2003 г.
Протокол № 125

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ДОКСАЗОЗИН

Регистрационное удостоверение № 003144/01
Торговое название препарата: ДОКСАЗОЗИН

Международное непатентованное название (МНН): - Доксазозин.

Лекарственная форма: таблетки

Состав: Одна таблетка содержит активного вещества Доксазозина мезилата в пересчете на доксазозин 1 или 2 или 4 мг

Вспомогательные вещества:

лактоза, кальция фосфат, коллидон 30, натрия додецилсульфат, кальция стеарат, тальк.

Описание: таблетки белого или белого с кремовым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклой формы.

Фармакотерапевтическая группа: альфа1- адреноблокатор.
КОД АТХ С02СА04

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Доксазозин является селективным конкурентным блокатором постсинаптических альфа1 - адренорецепторов. За счет снижения тонуса мышц сосудов доксазозин уменьшает общее периферическое сосудистое сопротивление, что приводит к снижению артериального давления (АД). После однократного приема препарата максимум гипотензивного действия наблюдается в период от 2 до 6 часов, а в целом гипотензивный эффект сохраняется в течение 24 часов. В период лечения доксазозином у больных артериальной гипертензией отсутствуют различия величин АД в положении стоя и лежа.

Эффективен при артериальной гипертензии, в том числе, сопровождающейся метаболическими нарушениями (ожирение, снижение толерантности к глюкозе).

Снижает риск развития ишемической болезни сердца.

Прием препарата у «нормотоников» не сопровождается снижением АД.

При длительном применении доксазозина у больных не наблюдается изменения толерантности к терапевтическому антигипертензивному эффекту.

В период лечения доксазозином наблюдается снижение уровня концентрации в плазме крови триглицеридов, общего холестерина.

Одновременно отмечается некоторый (на 4 - 13%) рост

коэффициента ЛПВП / общий холестерин.

При длительном лечении доксазозином наблюдается регрессия гипертрофии левого желудочка, подавление агрегации тромбоцитов и повышение содержания в тканях активного плазминогена.

В связи с тем, что доксазозин блокирует альфа₁-адренорецепторы, расположенные в строме и капсуле предстательной железы и в шейке мочевого пузыря, происходит снижение сопротивления и давления в мочеиспускательном канале, уменьшение сопротивления внутреннего сфинктера. Поэтому назначение доксазозина больным с симптомами доброкачественной гиперплазии предстательной железы приводит к значительному улучшению показателей уродинамики и уменьшению проявлений симптомов заболевания.

Оказывает эффект у 66-71% больных, начало действия – через 1-2 недели лечения, максимум – после 14 недель, эффект сохраняется в течение длительного времени.

Фармакокинетика

После приема внутрь в терапевтических дозах доксазозин хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте, абсорбция - 80-90% (одновременный прием пищи замедляет всасывание на 1 час), время достижения максимальной концентрации - 3 ч., при вечернем приеме - 5 ч. Биодоступность - 60-70% (пресистемный метаболизм). Связь с белками плазмы крови - около 98%. Выведение из плазмы крови происходит в 2 фазы, с конечным периодом полувыведения - 19-22 ч., что позволяет назначать препарат один раз в сутки.

Быстро метаболизируется в печени путем о-деметилирования и гидроксирования.

Выводится через кишечник, преимущественно в виде метаболитов до 65%, лишь 5% выводится с мочой в неизмененном виде.

Исследования фармакокинетики доксазозина у пожилых больных и у больных с заболеваниями почек не выявили существенных фармакокинетических различий.

Показания к применению

• артериальная гипертензия:

как в монотерапии, так и в комбинации с другими антигипертензивными средствами (тиазидные диуретики, бета-адреноблокаторы, блокаторы «медленных» кальциевых каналов или ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ)).

• доброкачественная гиперплазия предстательной железы:

как при наличии артериальной гипертензии, так и при нормальном АД.

Противопоказания

Препарат **ДОКСАЗОЗИН** противопоказан в случаях повышенной чувствительности к доксазозину, иным производным хиназолона или к любому из вспомогательных компонентов препарата.

С осторожностью применять у больных с нарушением функции печени, аортальным и митральным стенозом, ортостатической гипотензией, в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Применение во время беременности и в период кормления грудью

До настоящего времени опыт применения доксазозина у больных артериальной гипертензией во время беременности и в период кормления грудью недостаточен. Поэтому, несмотря на отсутствие тератогенного и эмбриотоксического эффектов по данным экспериментальных исследований, доксазозин может назначаться при беременности и в период кормления грудью только после тщательного взвешивания лечащим врачом соотношения польза/риск.

Способ применения и дозы

Внутри один раз в день (утром или вечером) независимо от приема пищи, не разжевывая и запивая достаточным количеством воды.

При лечении больных артериальной гипертензией начальная доза составляет 1 мг в сутки перед сном.

После приема первой дозы больной должен находиться в постели в течение 6-8 часов. Это требуется в связи с возможностью развития "феномена первой дозы", особенно выраженной на фоне предшествующего приема диуретиков.

При недостаточности терапевтического эффекта суточную дозу можно увеличить до 2 мг через 1-2 недели. В последующем через каждые 1-2 недели дозу можно увеличить на 2 мг. У подавляющего большинства больных оптимальный терапевтический эффект достигается при дозе 8 мг в сутки.

Максимальная доза - 16 мг в сутки, превышать нельзя.

После достижения стойкого терапевтического эффекта дозу обычно несколько снижают (средняя терапевтическая доза при поддерживающей терапии обычно равна 2 - 4 мг доксазозина в сутки).

При лечении больных доброкачественной гиперплазией предстательной железы без артериальной гипертензии обычно используют дозы, равные 2-4 мг в сутки.

Максимально допустимой является доза, равная 8 мг в сутки.

Препарат **ДОКСАЗОЗИН** применяют длительно. Продолжительность лечения определяет лечащий врач.

Побочное действие

Артериальная гипертензия

В клинических исследованиях наиболее часто наблюдались, особенно в начале лечения, ортостатическая гипотензия, которая в редких случаях может привести к обморокам.

Общие реакции: астения, утомляемость, недомогание.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: отеки, обморок.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, сонливость.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота.

Со стороны дыхательной системы: ринит.

Доброкачественная гиперплазия предстательной железы (ДГПЖ)

У больных ДГПЖ встречаются те же побочные эффекты, что и у больных артериальной гипертензией, а также:

Общие реакции: аллергические реакции, кожная сыпь, крапивница, боль в спине, ощущение жара («приливы»).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, ортостатическая гипотензия.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: сухость во рту, приапизм, гипостезия, парестезия, тремор, импотенция, бессонница, повышенная возбудимость.

Со стороны эндокринной системы: гинекомастия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: боль в животе, запор, диарея, диспепсия, метеоризм, тошнота, потеря аппетита.

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, пурпура, тромбоцитопения.

Печень/желчный пузырь: повышение активности «печеночных» трансаминаз, холестаза, гепатит, желтуха.

✓ *Со стороны скелетно-мышечной системы:* артралгия, мышечные судороги, слабость в мышцах, миалгии.

Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм, кашель, одышка, носовое кровотечение.

Со стороны кожных покровов: аллопеция.

Со стороны кожных покровов: аллопеция.
Со стороны органов чувств: нечеткость зрительного восприятия, шум в ушах.
Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, гематурия, нарушение мочеиспускания, никтурия, полиурия, недержание мочи.

А также отмечались следующие побочные реакции у больных артериальной гипертензией (причинно-следственная связь не установлена): брадикардия, тахикардия, сердцебиение, боль в груди, стенокардия, инфаркт миокарда, нарушение мозгового кровообращения и аритмии.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД, иногда сопровождающееся обмороками.

Лечение: Больного необходимо уложить на спину, опустив голову вниз, приподнять ноги.

Проводится симптоматическая терапия.

Гемодиализ не эффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Доксазозин усиливает гипотензивный эффект антигипертензивных средств (при использовании комбинации требуется коррекция доз).

Не отмечено неблагоприятного взаимодействия при одновременном применении доксазозина и тиазидных диуретиков, фуросемида, бета - адреноблокаторов, антибиотиков, пероральных гипогликемических средств, не прямых антикоагулянтов и урикозурических средств.

Не влияет на степень связывания с белками плазмы дигоксина, фенитоина.

При одновременном применении с индукторами микросомального окисления в печени возможно повышение эффективности доксазозина, с ингибиторами - понижение. Нестероидные противовоспалительные препараты (особенно индометацин), эстрогены и симпатомиметические средства могут снижать гипотензивное действие доксазозина.

Устраняя альфа-адреностимулирующие эффекты эпинефрина, может приводить к развитию тахикардии и артериальной гипотензии.

Особые указания

Особую осторожность следует проявлять при назначении данного препарата больным с нарушением функции печени, особенно в тех случаях, когда одновременно применяются препараты, способные отрицательно повлиять на функции печени. В случаях ухудшения показателей функционального состояния печени препарат немедленно отменяют.

С целью предотвращения ортостатических реакций больные должны избегать неожиданных и резких смен положения тела (переход из положения лежа в положение стоя).

В связи с тем, что доксазозин способен вызывать ортостатические реакции в начале лечения или в период повышения дозировок, больным целесообразно воздерживаться от всех потенциально опасных видов деятельности, в частности от управления автотранспортом и другими транспортными средствами и механизмами. Прием алкоголя способен усиливать нежелательные реакции.

Эффект «первого» приема препарата особенно выражен на фоне предшествующей диуретической терапии и диете с ограничением натрия.

Перед началом терапии необходимо исключить раковое перерождение предстательной железы.

Форма выпуска

Таблетки по 1, 2 и 4 мг. По 7 или 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку. По 1, 2, 3, 4 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке!

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель:

ЗАО «Фармацевтическое предприятие «Оболенское»

142279, Московская область, Серпуховский район, п.Оболенск 0799 7-8
тел./факс (0967) 36-01-07

Директор ИДКЭЛС, профессор



Чельцов В.В.

Директор
ЗАО «ФП «Оболенское»



Зимин Е.В.