ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ДОКСАЗОЗИН

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Доксазозин

Международное непатентованное название (МНН): доксазозин

Лекарственная форма: таблетки

Состав
Одна таблетка содержит активного вещества доксазозина мезилата 2,43мг (пересчете на доксазозин 2 мг).
Вспомогательные вещества: сахар молочный (лактоза), целлюлоза микрокристаллическая, крахмал картофельный, магния стеарат.

Описание
Таблетки белого или белого с кремоватым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые.

Фармакотерапевтическая группа: альфа1-адреноблокатор
Код АТХ: C02CA04

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Доксазозин является селективным конкурентным блокатором постсинаптических альфа1-адренорецепторов. За счет снижения тонуса мышц сосудов 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 наблюдаются изменения толерантности к терапевтическому антигипертензивному эффекту.
В период лечения препаратом 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 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 хорошо всасывается, абсорбция - 80-90% (одновременный прием пищи замедляет всасывание на 1 час). Максимальная концентрация в плазме крови создается через 3 часа. При вечернем приеме время достижения максимальной концентрации удлиняется до 5 часов.
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.
Интенсивно метаболизируется в печени путем о-деметилирования и гидроксилирования.
У пациентов с нарушенной функцией печени, а также при приеме препаратов, способных изменять печеночный метаболизм, может нарушаться процесс биотрансформации препарата.
Основное выведение через кишечник (65% в виде метаболитов и около 5% в неизмененном виде). Почками выводится 10%. Исследование фармакокинетики доксазозина у пожилых больных и у больных с заболеваниями почек не выявили существенных фармакокинетических различий.

Показания к применению
-Артериальная гипертензия: (в комбинации с другими антигипертензивными средствами (тиазидными диуретиками, бета-адреноблокаторами, блокаторами "медленных" кальциевых каналов, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ)).
-Доброкачественная гиперплазия предстательной железы:
как при наличии артериальной гипертензии, так и при нормальном АД.

Противопоказания
-Повышенная чувствительность к доксазозину, иным производным хиназолона или к любому из вспомогательных компонентов препарата, в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены)..

С осторожностью применять: у больных с нарушением функции печени, аортальным и митральным стенозом, ортостатической гипотензией,

Применение при 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 эмбриогенного 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
Доксазозин принимают внутрь 1 раз в день (утром или вечером) независимо от приема пищи, не разжевывая и запивая достаточным количеством воды.
При лечении артериальной гипертензии 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 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 центральной нервной системы: головная боль, головокружение, сонливость.
Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота.
Со стороны сердечно-сосудистой системы: отеки, обморок.
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, парастезии, 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 гепатобилиарной системы: повышение активности «печеночных» трансаминаз, холестаз, гепатит, желтуха.
Со стороны мочевыделительной системы дизурия, гематурия, нарушение мочеиспускания, никтурия, полиурия, редко - недержание мочи;
Со стороны системы кроветворения и системы гемостаза: тромбоцитопения, тромбоцитопеническая пурпура, лейкопения;
Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм, кашель, одышка, носовое кровотечение.
Со стороны кожных покровов: аллопеция.
Со стороны органов чувств: нечеткость зрительного восприятия, шум в ушах.
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, аритмии.

МОСКОВСКАЯ ОБЛАСТЬ * РОССИЙСКИЙ * ЗАКРЫТОЕ АКЦИОНЕРНОЕ ОБЩЕСТВО * ЗиО-Здоровье * Для документов * ОГРН 1025004711646 * г.ПОДОЛЬСК

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД, иногда сопровождающееся обмороками.

Лечение: больного необходимо немедленно поместить в горизонтальное положение, приподнять ноги. Проводится симптоматическая терапия. Диализ не эффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Доксазозин усиливает гипотензивный эффект антигипертензивных средств.

Не отмечено неблагоприятного взаимодействия при одновременном применении Доксазозина и тиазидных диуретиков, фуросемида, бета-адреноблокаторов, блокаторов «медленных» кальциевых каналов, ингибиторов ангиотензин-превращающего фермента, антибиотиков, пероральных гипогликемических средств, непрямых антикоагулянтов и урикозурических средств.

Не влияет на степень всасывания с белками плазмы крови дигоксина, фенитоина.

При одновременном применении с индукторами микросомального окисления в печени возможно повышение эффективности Доксазозина, с ингибиторами - понижение.

Нестероидные противовоспалительные препараты (особенно индометоцин), эстрогены и симпатомиметические средства могут снижать гипотензивное действие Доксазозина.

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

Особые указания

Особую осторожность следует проявлять при назначении Доксазозина больным с нарушениями функции печени, особенно в тех случаях, когда одновременно применяют препараты, способные отрицательно повлиять на функцию 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 2 мг.

ПЕРВИЧНАЯ+ВТОРИЧНАЯ УПАКОВКА

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки ПВХ и фольга алюминиевой печатной лакированной. По 2,3 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.



Условия хранения
Список Б. В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25^{0}С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
2 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
По рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ
ЗАО «ЗиО-Здоровье»
Россия, 142103, Московская область, г. Подольск, ул. Железнодорожная, 2
Тел. (095) 727-92-87, 727-92-30

Директор ИДКЭЛС, профессор В.В.Чельцов

Исполнительный директор
ЗАО «ЗиО-Здоровье» И.Б.Шашкова