МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

Инструкция

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Теразозин-Тева

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 000884- 19 1016
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер:

Торговое название: Теразозин-Тева

Международное непатентованное название (МНН): теразозин

Лекарственная форма: таблетки

Состав

1 таблетка содержит *активное вещество*: теразозина гидрохлорида дигидрат (теразозин) 2,374 мг или 5,935 мг (2,00 мг или 5,00 мг); *вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат 118,00/115,285 мг, крахмал кукурузный 14,00/14,00 мг, краситель хинолиновый желтый (Е104) 1,026 мг/-, краситель оксид железа желтый (Е172) -/0,14 мг, краситель оксид железа красный (Е172) -/0,04 мг, кросповидон 6,00/6,00 мг, повидон-К30 2,00/2,00 мг, тальк 5,85/5,85 мг, магния стеарат 0,75/0,75 мг.

Описание

Таблетки 2 мг: круглые плоскоцилиндрические с фаской таблетки желтого цвета с вкраплениями. На одной стороне - гравировка «93», на другой - «761».

Таблетки 5 мг: круглые плоскоцилиндрические с фаской таблетки желто-коричневого цвета (допускаются вкрапления). На одной стороне - гравировка «93», на другой - «762».

Фармакотерапевтическая группа: альфа$_1$-адреноблокатор

Код АТХ: G04CA03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Блокатор периферических постсинаптических альфа$_1$-адренорецепторов.

Симптомы, вызываемые доброкачественной гиперплазией предстательной железы (ДГПЖ), связаны с обструкцией выходного тракта мочевого пузыря, которая происходит в результате статической обструкции, в связи с увеличением предстательной железы, и динамической обструкции, которая зависит от тонуса гладкой мускулатуры предстательной железы и шейки мочевого пузыря, управляемой симпатической нервной системой.

Блокируя альфа$_1$-адренорецепторы гладких мышц предстательной железы и шейки мочевого пузыря, теразозин способствует нормализации мочеиспускания у пациентов с ДГПЖ.

Уменьшение симптомов, связанных с ДГПЖ, при применении теразозина может быть связано со снижением мышечного тонуса, вызываемым блокадой альфа$_1$-адренорецепторов в гладкой мускулатуре шейки мочевого пузыря и предстательной железе.

Вызывает расширение артериол и венул, уменьшает общее периферическое сосудистое сопротивление и венозный возврат к сердцу, в результате чего снижаются пред- и постнагрузка на сердце и артериальное давление (АД). Начало антигипертензивного действия через 15 мин после приема внутрь (однократная доза). Длительность антигипертензивного действия - 24 ч. Максимальный эффект при приеме однократной дозы достигается в течение 2-3 ч. Стойкий антигипертензивный эффект достигается через 6-8 недель терапии. Незначительно влияет на сердечный выброс, перфузию почек и скорость клубочковой фильтрации. Длительное применение теразозина обычно не вызывает развития рефлекторной тахикардии.

Теразозин способствует нормализации липидного обмена: снижает концентрацию холестерина, триглицеридов и липопротеинов низкой и очень низкой плотности в крови, увеличивая при этом количество липопротеинов высокой плотности.

При систематическом применении теразозина отмечается регрессия гипертрофии левого желудочка.

Фармакокинетика

После приема внутрь теразозин быстро и практически полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на абсорбцию. Биодоступность теразозина составляет 80-100%. Для теразозина не характерен эффект «первичного прохождения», поэтому почти вся доза неизмененного теразозина поступает в системный кровоток. Максимальная концентрация в сыворотке крови достигается в течение 1-2 ч после приема внутрь. Связь с белками плазмы крови составляет 90-94% и не зависит от концентрации теразозина в плазме крови.

Теразозин метаболизируется в печени путем гидролиза, деметилирования и деалкилирования с образованием 5 метаболитов, один из которых (пиперазиновое производное теразозина) фармакологически активен. Примерно 60% от принятой дозы выводится через кишечник (из них 20% - в неизмененном виде, остальное - в виде метаболитов), 40% - почками (из них 10% - в неизмененном виде). Неизвестно, выделяется ли теразозин с грудным молоком. Период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет 8-13 ч.

При печеночной недостаточности клиренс теразозина снижается.

Применение теразозина у больных с нарушениями функции почек требует тщательного

наблюдения за состоянием пациента. Ограниченные фармакокинетические исследования низких доз (1 мг) не показали явных различий фармакокинетических параметров теразозина по сравнению с пациентами с нормальной функцией почек.

Показания к применению

- Доброкачественная гиперплазия предстательной железы (симптоматическое лечение).
- Артериальная гипертензия (в составе комбинированной терапии).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к теразозину, другим хиназолинам, а также к любому из компонентов препарата, другим альфа-адреноблокаторам; артериальная гипотензия; склонность к ортостатическим нарушениям регуляции, в том числе в анамнезе; тяжелые нарушения функции печени; одновременное применение с ингибиторами фосфодиэстеразы-5 (ФДЭ5), в том числе с силденафилом, тадалафилом и варденафилом; сопутствующая обструкция верхних мочевыводящих путей; хронические инфекционные заболевания мочевыводящих путей или камни в мочевом пузыре; снижение скорости оттока мочи; анурия; возраст до 18 лет; непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция, беременность и период грудного вскармливания.

С осторожностью

Ишемическая болезнь сердца (ИБС) или другие заболевания сердца: отек легких с аортальным или митральным стенозом, сердечная недостаточность с повышением минутного выброса, правожелудочковая недостаточность, обусловленная эмболией легочной артерии или экссудативным перикардитом, левожелудочковая недостаточность с низким давлением наполнения желудочков (см. раздел «Особые указания»), нарушения мозгового кровообращения, гипертензивная ретинопатия III или IV степени, сахарный диабет 1 типа, нарушение функции печени легкой и средней степени тяжести; одновременное применение теразозина с тиазидными диуретиками или другими гипотензивными средствами; нарушения функции почек, пожилой возраст старше 65 лет.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

При беременности препарат Теразозин-Тева применять не рекомендуется.

Неизвестно, выделяется ли теразозин с грудным молоком. При необходимости применения препарата Теразозин-Тева в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь. Таблетки Теразозин-Тева принимают целиком, не разжевывая, запивая стаканом воды, независимо от приема пищи. Пациентов информируют о возможности развития

ортостатической гипотензии и необходимости принимать препарат Теразозин-Тева на ночь перед сном в положении «сидя» или «лежа», после чего находиться в постели в течение 6-8 ч.

ДГПЖ (симптоматическое лечение)

Дозу препарата Теразозин-Тева следует подбирать на основании индивидуальной ответной реакции пациента на проводимую терапию.

Начальной дозой для всех пациентов, которую не следует превышать, является 1 мг (рекомендуется применять теразозин в другой лекарственной форме: таблетки по 1 мг) 1 раз в сутки перед сном, после чего пациент должен находиться в постели 6-8 часов. При приеме первой дозы необходимо тщательно контролировать АД, чтобы снизить риск развития ортостатической гипотензии.

Доза может быть увеличена через 1-2 недели до 2 мг 1 раз в сутки. В этой дозе препарат Теразозин-Тева продолжают принимать в течение 14 дней; после чего переходят на прием по 5 мг 1 раз в сутки в течение 7 дней. После четырех недель от начала приема оценивают эффективность проводимой терапии. При недостаточном клиническом эффекте дозу препарата Теразозин-Тева увеличивают до 10 мг в сутки. Максимальная суточная доза составляет 10 мг. Рекомендуемая поддерживающая доза – 5-10 мг в сутки.

Если применение препарата Теразозин-Тева прерывается на несколько дней или более, терапию возобновляют с начальной дозы.

Артериальная гипертензия (в составе комбинированной терапии)

Доза и интервалы между приемом доз (12-24 часа) препарата Теразозин-Тева должны подбираться индивидуально для каждого пациента, в соответствии с реакцией снижения АД.

Начальной дозой для всех пациентов, которую не следует превышать, является доза в 1 мг (рекомендуется применять теразозин в другой лекарственной форме: таблетки по 1 мг) 1 раз в сутки перед сном. В конце периода времени между приемами доз следует измерить АД для того, чтобы убедиться в поддержании надлежащего уровня АД. Также может оказаться полезным измерение АД через 2 или 3 часа после приема препарата для того, чтобы убедиться в том, что снижение АД стабильно.

Если действие препарата Теразозин-Тева через 24 часа значительно уменьшается, можно попытаться увеличить дозу или применять препарат 2 раза в сутки. В последнем случае следует выяснить, наблюдаются ли такие побочные реакции, как головокружение, ощущение сердцебиения или ортостатическая гипотензия через 2-3 часа после приема препарата.

Дозу увеличивают постепенно, удваивая дозу с интервалом не менее 1 недели, до

достижения желаемого уровня снижения АД. Обычно поддерживающая доза препарата Теразозин-Тева колеблется от 2 до 10 мг в сутки. Максимальная суточная доза – 20 мг/сут. При необходимости прекращения терапии на несколько дней и более, возобновление приема следует вновь начинать с начальной дозы (1 мг/сут) с дальнейшим постепенным её увеличением.

При применении препарата Теразозин-Тева в дополнение к уже проводимой гипотензивной терапии, за пациентом следует тщательно наблюдать на случай возникновения артериальной гипотензии. При одновременном применении с тиазидными диуретиками или другими гипотензивными средствами может потребоваться снижение дозы препарата Теразозин-Тева или даже его отмена и повторное титрование дозы под контролем врача.

У пациентов с нарушением функции почек коррекции дозы не требуется.

У пожилых пациентов коррекции дозы не требуется, но необходим регулярный контроль состояния пациента.

У пациентов с нарушением функции печени следует подбирать суточную дозу с особой осторожностью. Нет достаточного опыта применения препарата Теразозин-Тева у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью.

Побочное действие

Как и другие альфа$_1$-адреноблокаторы, теразозин может вызвать обморок. Обморок может возникнуть в течение 1-1,5 часов после приема начальной дозы препарата. В единичных случаях перед обмороком может резко возрастать число сердечных сокращений до 120-160 уд./мин. После приема первой дозы препарата может развиться выраженное снижение АД, которое может привести к ортостатическому головокружению, в тяжелых случаях - к обмороку. Наиболее характерны синкопальные эпизоды, которые возникали в период 30-90 мин после приема первой дозы, а также прослеживалась связь с быстрым увеличением дозы или применением другой гипотензивной терапии.

Частота развития побочных эффектов классифицирована согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения: очень часто - не менее 10%; часто - не менее 1%, но менее 10%; нечасто - не менее 0,1%, но менее 1%; редко - не менее 0,01%, но менее 0,1%; очень редко - менее 0,01%, включая отдельные сообщения.

Со стороны крови и лимфатической системы: очень редко - тромбоцитопения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы (ССС): часто - обморок (особенно при быстрой смене положения тела из положения «лежа» в положение «стоя» или в положение «сидя» - постуральная гипотензия), ощущение сердцебиения, тахикардия, боль в груди, периферические отеки, очень редко - фибрилляция предсердий (однако

причинно-следственная связь с приемом препарата не была установлена).

Со стороны нервной системы: часто - головокружение, слабость, головная боль, астения, повышенная раздражительность, сонливость, парестезии; нечасто - депрессия, синкопальные состояния.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень часто - заложенность носа, ринит, синусит; неизвестная частота - одышка.

Со стороны системы пищеварения: часто - тошнота, запор, диарея, рвота.

Со стороны органов чувств: очень часто - нарушение зрения, амблиопия; часто - снижение остроты зрения, нарушение цветового восприятия; неизвестная частота - вертиго.

Со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: часто - боль в спине; неизвестная частота - боль в конечностях.

Со стороны репродуктивной системы: часто - эректильная дисфункция; нечасто - снижение либидо; очень редко - приапизм; неизвестная частота - импотенция.

Аллергические реакции: часто - кожная сыпь, зуд; нечасто - крапивница, анафилактоидные реакции.

Со стороны мочевыделительной системы: часто - инфекции мочевых путей и недержание мочи (в основном у женщин в постменопаузе).

Прочие: нечасто - увеличение массы тела.

Дополнительно были получены сообщения о нежелательных реакциях в ходе клинических исследований и при применении в клинической практике: гриппоподобный синдром, инфекции верхних дыхательных путей, фарингит, инфекции мочевыводящих путей, тревожность, бессонница, конъюнктивит, шум в ушах, аритмия, симптомы вазодилатации, бронхит, кашель, боль в животе, сухость слизистой оболочки полости рта, диспепсия, метеоризм, боль в груди, боль в шее, боль в области плеч, артралгия, артрит, миалгия, учащение позывов на мочеиспускание, недержание мочи (у женщин в период менопаузы), ангионевротический отек, обострение течения подагры, носовое кровотечение, повышенное потоотделение, лихорадка; небольшое, но статистически значимое снижение гематокрита, гемоглобина, лейкоцитов, гипопротеинемия, гипоальбуминемия, что может свидетельствовать о гемодилюции. Лечение теразозином в течение 24 мес. не оказывает существенного влияния на концентрацию общего или свободного простат-специфического антигена (ПСА).

Четкой связи развития побочных реакций с применением теразозина не установлено.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД, нарушение координации движений, обморок,

нарушения водно-электролитного баланса.

Лечение: промывание желудка, применение адсорбирующих средств, симптоматическая терапия. При выраженном снижении АД пациента необходимо уложить на спину, ноги приподнять, провести коррекцию ОЦК. Специфического антидота нет. Гемодиализ неэффективен. При необходимости вводят вазопрессорные препараты, проводят коррекцию показателей водно-электролитного баланса, контроль функции почек.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Согласно результатам клинических исследований, одновременный прием теразозина и ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента или диуретиков сопровождался большей частотой развития симптомов ортостатической гипотензии и других побочных эффектов.

При одновременном применении теразозина с другими гипотензивными средствами возможно усиление антигипертензивного действия. При одновременном применении с тиазидными диуретиками или другими гипотензивными средствами может потребоваться снижение дозы препарата или даже его отмена и повторное титрование дозы под контролем врача.

Одновременное применение теразозина с другими альфа-адреноблокаторами не рекомендуется в связи с увеличением частоты проявления нежелательных реакций.

При одновременном применении с вазодилататорами и нитратами может усиливаться антигипертензивное действие теразозина.

Всасывание теразозина снижается при одновременном приеме адсорбентов и антацидов.

Одновременное применение препарата Теразозин-Тева и ингибиторов ФДЭ5 (например, силденафил, тадалафил, варденафил) может быть причиной развития выраженного снижения АД.

Нестероидные противовоспалительные препараты (особенно индометацин) и эстрогены могут снижать антигипертензивный эффект теразозина, вследствие подавления синтеза простагландинов и/или задержки жидкости и натрия.

Симпатомиметики могут ослаблять антигипертензивный эффект теразозина (риск развития артериальной гипотензии) и ослаблять вазодилатирующий эффект в ответ на введение допамина, эфедрина, норэпинефрина, метараминола, метоксамина и фенилэфрина.

Теразозин снижает антигипертензивный эффект клонидина, введенного внутривенно.

Особые указания

Перед началом лечения пациентов с ДГПЖ препаратом Теразозин-Тева следует исключить злокачественное новообразование предстательной железы или другие

причины, приводящие к задержке мочи. Эффективность проводимой терапии оценивают через 4-6 недель лечения поддерживающими дозами препарата Теразозин-Тева.

Уменьшение симптомов ДГПЖ возможно уже на второй неделе терапии, однако наступление терапевтического эффекта может затянуться до 6 и более недель.

Есть сообщения о случаях развития длительной эрекции и приапизма на фоне терапии альфа1-адреноблокаторами. В случае сохранения эрекции в течение более 4 часов следует немедленно обратиться за медицинской помощью. Если терапия приапизма не была проведена незамедлительно, это может привести к повреждению тканей полового члена и необратимой утрате потенции.

После применения максимально рекомендованной дозы прием препарата Теразозин-Тева следует прекратить, если улучшение показателей урофлоуметрии немного отличается от исходных показателей. Лечение препаратом следует прекратить, если возникающие побочные эффекты более серьезны, чем симптомы ДГПЖ, или при развитии у пациента осложнений со стороны мочевыводящего тракта при приеме препарата.

Независимо от показаний, по которым принимается препарат Теразозин-Тева, во избежание развития "эффекта первой дозы" начальная доза препарата Теразозин-Тева не должна превышать 1 мг.

Для снижения риска развития ортостатической артериальной гипотензии ("эффект первой дозы"), первую дозу препарата Теразозин-Тева рекомендуется принимать в вечернее время перед сном, после чего пациент должен находиться в постели в течение 6-8 ч. Риск возникновения выраженного снижения АД наиболее высок в течение 30-90 мин после приема препарата, а также повышен у пациентов, одновременно получающих бета-адреноблокаторы и диуретики, при уменьшении объема циркулирующей крови, малосолевой диете, а также при возобновлении лечения препаратом Теразозин-Тева после перерыва (несколько дней).

Пациента необходимо проинформировать о том, что при первых признаках ортостатической гипотензии (головокружение, слабость) пациент должен сесть или лечь и оставаться в этом положении до тех пор, пока самочувствие не улучшится, а также об увеличении риска развития выраженного снижения АД при употреблении алкоголя, длительном стоянии или выполнении физических упражнений, а также при высокой температуре окружающей среды.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении препарата Теразозин-Тева с тиазидными диуретиками или другими гипотензивными средствами; при необходимости комбинированной терапии дозу препарата Теразозин-Тева снижают.

Одновременное применение ингибиторов ФДЭ5, в том числе силденафила, тадалафила,

варденафила, и препарата Теразозин-Тева может привести к выраженному снижению АД у некоторых пациентов. Для того чтобы свести к минимуму риск развития ортостатической гипотензии, перед началом применения ингибиторов ФДЭ5 необходимо добиться того, чтобы АД у пациента было стабильным на фоне лечения препаратом Теразозин-Тева.

Подбор поддерживающей дозы препарата Теразозин-Тева у пожилых пациентов, особенно у пациентов с ДГПЖ в возрасте более 65 лет, рекомендуется проводить с осторожностью под врачебным контролем, в связи с высоким риском развития ортостатической гипотензии в этой группе пациентов.

В связи с проявлением сосудорасширяющего действия препарат Теразозин-Тева следует с осторожностью применять у пациентов с ИБС или другими заболеваниями сердца: отек легких с аортальным или митральным стенозом, сердечная недостаточность с повышением минутного выброса, правожелудочковая недостаточность, обусловленная эмболией легочной артерии или экссудативным перикардитом, левожелудочковая недостаточность с низким давлением наполнения желудочков.

У некоторых пациентов, ранее принимавших тамсулозин, при проведении хирургического вмешательства по поводу катаракты был отмечен «интраоперационный синдром дряблой радужки» (ИСДР, разновидность синдрома узкого зрачка). Отдельные отчеты также были получены и при применении других блокаторов альфа$_1$-адренорецепторов, поэтому нельзя исключать возможное влияние класса данных препаратов.

При проведении хирургического вмешательства (по поводу катаракты) необходимо проинформировать хирурга-офтальмолога о применении блокаторов альфа$_1$-адренорецепторов.

При применении у пациентов с нарушением функции печени следует соблюдать осторожность в связи с тем, что метаболизм теразозина осуществляется в печени. Данные о применении препарата Теразозин-Тева у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью отсутствуют.

В процессе лечения не изменяется концентрация ПСА.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

В течение 12 ч после приема первой дозы, после увеличения дозы или прерывания терапии больным не рекомендуется заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций (в т.ч. вождение транспортных средств). В дальнейшем степень ограничений следует устанавливать в зависимости от индивидуальной реакции пациента.

Форма выпуска

Таблетки 2 мг, 5 мг.

По 10 таблеток в блистере ПВХ/алюминий.

По 2 или 3 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано РУ:

Тева Фармацевтические Предприятия Лтд., Израиль

Производитель: Тева Фармацевтические Предприятия Лтд.,

18 Эли Гурвитц Ст., Инд. Зоун, Кфар Саба, Израиль

Организация, принимающая претензии потребителей:

ООО «Тева», 115054, Москва, ул. Валовая, 35,

тел.: (495) 644-22-34, факс: (495) 644-22-35/36

Представитель фирмы  А.С. Карас