

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ДОКСАЗОЗИН-ЛУГАЛ
DOXAZOSIN-LUGAL

Склад:

діюча речовина: доксазозин;

1 таблетка містить 2 або 4 мг доксазозину (у вигляді доксазозину мезилату);

допоміжні речовини: крохмаль кукурудзяний, магнію стеарат, целюлоза мікрокристалічна, натрію крохмальгліколят(тип А), лактози моногідрат, натрію лаурилсульфат, кислота стеаринова.

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група.

Засоби, які впливають на серцево-судинну систему. Антиадренергічні засоби з периферичним механізмом дії. Блокатори альфа-адренорецепторів. Код АТС С02С А04.

Клінічні характеристики.

Показання.

Артеріальна гіпертензія

Як засіб першого ряду для хворих на артеріальну гіпертензію. Пацієнтам, у яких не вдається досягти адекватного зниження артеріального тиску, Доксазозин-Лугал може бути призначений у комбінації з іншими антигіпертензивними препаратами.

Доброякісна гіперплазія передміхурової залози (ДГПЗ)

Препарат показаний для усунення затримки відтоку сечі та симптомів, пов'язаних з ДГПЗ. Хворим на ДГПЗ можна призначати Доксазозин-Лугал як за наявності артеріальної гіпертензії, так і при нормальному рівні артеріального тиску, в останньому випадку зниження артеріального тиску несуттєво.

Протипоказання.

Підвищена індивідуальна чутливість до хіназолінів та до інших компонентів препарату, стеноз аортального та мітрального клапанів, тромбоемболія легеневої артерії, тяжкі порушення функції печінки, вагітність, період годування груддю, дитячий вік.

Спосіб застосування та дози. Призначають дорослим внутрішньо. Застосовують один раз на добу зранку або ввечері, краще натщесерце, не розжовуючи, запиваючи достатньою кількістю рідини. Початкова доза становить 1 мг. Для цього застосовують доксазозин в іншій лікарській формі з можливістю такого дозування. За необхідності разову дозу збільшують поступово рівномірно (метою мінімізувати ризик потенційної постуральної гіпертензії та/або синкопе або залежно від індивідуальних параметрів уродинаміки та симптоматики ДГПЗ) через 1-2 тижні до 2 мг, 4 мг, 6 мг, 8 мг 1 раз на добу. При цьому необхідно контролювати терапевтичну відповідь у пацієнтів з метою досягнення бажаного зниження артеріального тиску. Рекомендована підтримуюча добова доза – 2-4 мг.

Застосування у людей літнього віку: звичайна доза для дорослих.

Застосування при нирковій недостатності: зважаючи на те, що фармакокінетичні параметри практично незмінні у пацієнтів з нирковою недостатністю та відсутні повідомлення про погіршення вихідної ниркової функції при застосуванні доксазозину, у більшості пацієнтів може бути використаний звичайний режим дозування.

Печінкова недостатність: слід дотримуватись обережності при призначенні доксазозину хворим з порушенням функції печінки.

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи: ефект «першої дози» – артеріальна гіпотонія, запаморочення, непритомність (у т.ч. при зміні положення тіла), припливи крові з відчуттям жару, при тривалому застосуванні – ортостатична гіпотензія, периферичні набряки, порушення ритму серця, порушення мозкового кровообігу, рідко – синкопальні стани. Також можливі у хворих на артеріальну гіпертензію: брадикардія, тахікардія, відчуття серцебиття, за груднинний біль, стенокардія, інфаркт міокарда, порушення мозкового кровообігу, серцеві аритмії.

З боку нервової системи: головний біль, запаморочення, нервозність, сонливість, астеничний синдром, збудження, тремор, втрата свідомості, гіпестезія, парестезія.

З боку травної системи: сухість уроті, нудота, блювання, гастралгії, запор або діарея, диспепсія, біль у животі, метеоризм, холестаза, гепатит, підвищення активності печінкових трансаміназ, ксеростомія.

З боку системи крові: тромбоцитопенія, тромбоцитопенічна пурпура, лейкопенія.

З боку дихальної системи: задишка, кашель, риніт, посилення бронхоспазму, носова кровотеча.

З боку сечовидільної системи: поліурія гематурія, дизурія, ніктурія, порушення сечовипускання; рідко – нетримання сечі.

З боку органа зору: порушення чіткості зору.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз: гінекомастія, зниження лібідо або потенції, затримка еякуляції; рідко – пріапізм.

З боку органів слуху: шум у вухах.

З боку скелетно-м'язової системи: артралгія, біль у грудній клітці та/або в спині м'язові спазми, слабкість м'язів, міалгія.

З боку шкіри: алопеція, свербіж, пурпура, шкірні висипання, кропив'янка.

З боку психіки: ажитація, підвищена тривожність, депресія, безсоння, нервозність.

Інші: анорексія, збільшення маси тіла, відчуття втоми, нездужання.

Передозування. Симптоми: артеріальна гіпотензія, синкопальні стани. **Лікування:** негайно покласти пацієнта на спину, опустивши голову донизу, за необхідності – внутрішньовенні інфузії та введення вазопресорних препаратів. Діаліз не ефективний.

Застосування в період вагітності або годування груддю. Препарат протипоказаний при вагітності (безпека застосування не встановлена). У період вагітності препарат призначають тільки у випадку, якщо очікуваний ефект терапії для матері перевищує потенційний ризик для плода. За необхідності застосування в період лактації годування груддю слід припинити.

Діти. Протипоказано.

Особливості застосування.

Через ризик розвитку постуральної гіпотензії з обережністю слід призначати пацієнтам з діабетичною нейропатією, порушеннями функції печінки, пацієнтам, які отримують комбіновану антигіпертензивну терапію, а також пацієнтам з гіперплазією передміхурової залози за наявності у них схильності до артеріальної гіпотензії. Слід враховувати, що ефекти першої дози (гіпотонія, запаморочення, головний біль) особливо виражені у пацієнтів, що приймають діуретики або знаходяться на дієті з обмеженням натрію. Перший прийом препарату бажано здійснювати перед сном для попередження розвитку ортостатичної гіпотензії. Ризик розвитку ортостатичної гіпотензії збільшується при тривалому прийомі препарату у дозі

вище 4 мг.

Пацієнти повинні бути попереджені про можливість виникнення вищевказаних ситуацій, у результаті яких може настати запаморочення та втрата свідомості протягом початкової терапії доксазозином.

При призначенні пацієнтам з гіперплазією передміхурової залози необхідно виключити її злоякісне походження.

Через те що доксазозин метаболізується переважно в печінці, слід дотримуватися обережності при призначенні препарату хворим з порушенням функції печінки.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Враховуючи профіль побічних реакцій, рекомендовано утримуватися від керування автотранспортними або іншими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Посилює антигіпертензивний ефект інших антигіпертензивних лікарських засобів. Естрогени, які викликають затримку рідини, нестероїдні протизапальні засоби (особливо індометацин), симпатоміметичні засоби та індуктори мікросомального окиснення можуть знижувати антигіпертензивний ефект доксазозину, інгібітори мікросомального окиснення – підвищують його. Доксазозин зменшує пресорний ефект метарамінолу, ефедрину, блокує альфа-адренергічні ефекти епінефрину, що може призводити до тяжкої артеріальної гіпотензії і тахікардії. Застосування доксазозину при одночасному застосуванні інгібіторів фосфодіестерази 5 типу повинно здійснюватись з пересторогами, адже у деяких пацієнтів можуть виникнути симптоми артеріальної гіпотензії.

Одночасний прийом алкоголю може посилювати побічні ефекти доксазозину.

Не встановлено несприятливих взаємодій при одночасному прийомі з діуретиками, бета-адреноблокаторами, блокаторами кальцієвих каналів, нестероїдними протизапальними засобами, інгібіторами ангіотензинперетворюючого ферменту, антибіотиками, пероральними гіпоглікемічними засобами, непрямими антикоагулянтами та урикозуричними засобами.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Антигіпертензивний, судинорозширювальний, гіполіпідемічний, спазмолітичний засіб. Селективний блокатор постсинаптичних альфа₁-адренорецепторів.

Чинить судинорозширювальну дію внаслідок постсинаптичних альфа₁-адренорецепторів у судинах. Адренолітична дія найбільшою мірою виявляється в судинах нирок, шкіри, меншою – в черевних, церебральних та легеневих. Знижує загальний периферичний опір судин, попереджає вазоконстрикцію, спричинену катехоламінами, що приводить до помірного зниження артеріального тиску без рефлекторної тахікардії. Зменшує перед- і постнавантаження серця і потребу міокарда в кисні. При серцевій недостатності знижує вивільнення передсерцевого натрійуретичного пептиду, зменшує ступінь гіпертрофії лівого шлуночка.

Зменшує рівні загального холестерину та атерогенних фракцій ліпопротеїдів, підвищує вміст ліпопротеїдів високої щільності, сприяючи зниженню ризику розвитку ішемічної хвороби серця. Виявляє сприятливий ефект на вуглеводний обмін, підвищує чутливість тканин до інсуліну. Пригнічує синтез колагену в судинній стінці. Пригнічує агрегацію тромбоцитів, збільшує концентрацію тканинного активатора плазміногену. Зменшує тонус гладком'язових клітин стромы і капсули передміхурової залози, шийки сечового міхура.

Антигіпертензивний ефект виявляється тільки при початково підвищеному артеріальному тиску, дія починається через 1-2 години після прийому, досягає максимуму через 5-6 годин і зберігається до 24 годин. Чітко зменшення виразності обструктивних та запальних симптомів, що обумовлені гіперплазією передміхурової залози, та поліпшення показників уродинаміки. Така дія препарату пов'язана із селективною блокадою альфа₁-адренорецепторів, які знаходяться у м'язовій стромі та капсулі передміхурової залози, а також у шийці сечового міхура.

Фармакокінетика. Швидко і досить повно (80-90 %) всмоктується зі шлунково-кишкового тракту,

одночасний прийом їжі уповільнює всмоктування на 1 годину. Максимальна концентрація у крові досягається через 2-3 години, при прийомі ввечері – через 5 годин. Піддається ефекту «першого проходження» через печінку, біодоступність становить 62-69 %. Зв'язування білками плазми становить близько 98-99 %. Інтенсивно біотрансформується в печінці шляхом О-деметилування та гідроксилювання з утворенням активних метаболітів. Накопичується у грудному молоці. Включається в еритрогепатичну циркуляцію, у результаті, більша частина (63 %) виводиться через кишечник (5-19 % у незміненому вигляді), нирками виділяється 9 %. Виведення з плазми крові двофазне з періодом напіввиведення кінцевої фази 19-22 години.

За наявності порушень функції печінки дія препарату пролонгується. У літніх пацієнтів та при нирковій недостатності фармакокінетика істотно не змінюється.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості. Таблетки плоскоциліндричної форми, з фаскою, білого або майже білого кольору Таблетки по 4 мг – з рискою.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30 °С. *Зберігати у недоступному для дітей місці.*

Упаковка.

По 10 таблеток у блістер, по 3 блістери в пачці

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ПАТ «Луганський хіміко-фармацевтичний завод».

Місцезнаходження.

Україна, 91019, м. Луганськ, вул. Кірова, 17.