

【說明】

本品為選擇性  $\alpha$ -1 交感神經接受體阻斷劑，能使血管擴張，減少周邊血管阻力而使血壓下降，並使攝護腺和膀胱頸的平滑肌鬆弛，改善良性攝護腺肥大症所造成的排尿困難。

【藥效學】

1. 良性攝護腺肥大(BPH)：在攝護腺、攝護腺囊和膀胱頸富含  $\alpha$ -1 交感神經接受體，對其刺激會增加平滑肌的張力，造成排尿困難。在服 Terazosin 後會阻斷在攝護腺和膀胱頸的  $\alpha$ -1 交感神經接受體，使平滑肌鬆弛，減輕排尿困難症狀和增加尿流速率。因為在膀胱體也有少數  $\alpha$ -1 接受體，所以本品也能在不影響膀胱的收縮力下，降低膀胱出口的阻力，改善排尿困難。
2. 高血壓：Terazosin 會經由減少總周邊血管阻力而使血壓下降。本品使血管擴張之降壓作用主要是阻斷  $\alpha$ -1 交感神經接受體而產生。本品在口服 15 分鐘內，即會使血壓逐漸下降。對臨床試驗病人使用一天一次或一天二次之療法，每天總劑量在 5~20mg。在給藥後 24 小時測量血壓，結果顯示在整個治療期間降壓作用均能持續，在仰臥時的收縮壓比對照組低 5~10mmHg，舒張壓比對照組低 3.5~8mmHg，站立時的血壓亦較仰臥時低 1~3mmHg。血壓測量時間應在給藥期間末端，若效果不佳，可建議病人服用較高劑量或每天二次劑量的治療法。同時應注意服藥後，可能會產生和血壓有關副作用作用，如眩暈、心悸或姿勢性低血壓。血壓效應與姿勢有關(在站立時血壓效應較大)，且在站立時每分鐘心跳速率也會增加 6~10 次。在服藥後 3 小時，12.5% 的病人從仰臥到站立時，其收縮壓會降低至少 20mmHg，站立收縮壓低於 90mmHg。

【藥動學】

本品口服後能完全吸收，食物對吸收的程度幾乎無影響，但會延緩到達最高血中濃度時間約 1 小時，Terazosin 經肝臟的首度代謝很少，在體循環中之劑量幾乎全為原型。口服後約 1 小時即可達最高血中濃度，半衰期約 12 小時。本品約有 90~94% 與血漿蛋白結合，在臨床藥動學範圍內其結合是固定的。口服後約 10% 以原型排於尿中，約 20% 排於糞便中，其餘的則以代謝物的型式排出。腎功能不良對本品之排除無顯著影響，且血液透析病人不一定要調整劑量。

【成分】每錠中含有

Terazosin (as HCl dihydrate) ..... 2 mg.

【適應症】

高血壓、良性攝護腺肥大症。

【用法、用量】

若服用本品停藥數天後，則應使用初劑量再開始治療。

1. 良性攝護腺肥大症：

- 初劑量：於睡前服用 1mg 為開始劑量。病人須遵循醫師指示服用，以降低發生低血壓效應的危險性。
- 維持劑量：劑量應以漸進方式增加到 2mg，5mg，或 10mg，一天一次，以達到期望的改善效果。通常每天一次 10mg 可達到臨床的治療效果。因此，可能須要使用 10mg 治療至少 4~6 週以評估是否已達最大效益。但少數病人須要每天 20mg 的劑量，才能達到治療效果。
- 和其他藥併用：本品和其他降血壓藥併用時，應注意觀察，尤其是鈣離子拮抗劑，以避免產生顯著的低血壓效應。當本品和其他降血壓藥併用時，應減低劑量，和可能須要重新再調整兩者之劑量。

2. 高血壓：本品之劑量和服用間隔(12 或 24 小時)應依病人的血壓反應來調整，以下為服用方法指引：

初劑量：於睡前服用 1mg 為開始劑量。應密切觀察此初劑量之治療，以降低發生嚴重低血壓作用的潛在危險。

維持劑量：劑量應緩慢的增加，使達到預期的降壓效果。通常建議的服用劑量範圍為 1mg 到 5mg，一天一次；但有些病人可能須要高達每天 20mg 才能達到治療效益。劑量超過 20mg 並不能達到更好的降壓效果。應在下次服藥間隔前監測血壓，以確定在治療期間血壓是維持在控制之下。在服藥後 2~3 小時測量血壓，有助於了解最大和最小的效果；也可用於評估因過度低血壓反應所導致的眩暈和心悸症狀。當在 24 小時後效果減少時，則可考慮增加劑量或使用每天服用 2 次之療法。若停用本品數天或更長時間，則應自初劑量再開始治療。在臨床試驗上，除了初劑量外，均應在早上服藥。

【禁忌】

已知對 Terazosin HCl 會產生過敏者禁止使用。

【警語】

暈厥和“初劑量”效應：

1. 本品像其他  $\alpha$ -交感神經阻斷劑一樣，可能會引起顯著的低血壓，尤其是姿態性低血壓，通常在初劑量或治療的前幾天發生，可能會併生暈厥。當治療中止數日，然後再開始治療，可能也會產生相同的作用。在其他  $\alpha$ -交感神經阻斷劑相關的暈厥報告，指出其和迅速增加劑量或併用其他抗高血壓劑有關。暈厥相信是由過度的姿態性低血壓作用所引起。為減低暈厥或過度低血壓的可能性，治療應由 1mg 的劑量睡前服用開始，應依“用法用量”項之說明，慢慢的增加治療劑量，併用其他抗高血壓劑時應小心。在治療初期應警告病人因發生暈厥可能會造成傷害的情況，如避免駕駛或從事危險性工作。
2. 當暈厥發生時，應使病人平臥，必要時給與支持療法。

【注意】

- 1.一般：攝護腺腫瘤和良性攝護腺肥大(BPH)，會引起很多相同的症狀，且此二種疾病常共存，因此，患有BPH的病人，應在開始使用本品治療前就須先作檢驗，以排除攝護腺腫瘤之存在。
- 2.姿態性低血壓：暈厥是Terazosin最嚴重的姿態性低血壓效應，因降低血壓所引起的其他症狀，如眩暈、頭昏眼花和心悸，為較普遍的副作用。在BPH的臨床試驗中，約有21%曾有下列症狀：眩暈、低血壓、姿態性低血壓、暈厥和頭暈，若有這些症狀發生的病人，在使用本品治療時應特別注意。
- 3.病人須知：應告知病人會有暈厥和姿態性低血壓症狀的可能性，特別是在治療初期、在服用第一個劑量、增加劑量後和中斷治療後又開始治療的12小時內，應避免駕駛或從事危險性工作。在使用本品治療初期，應警告病人以避免因暈厥所導致的傷害。且應告知病人，若有低血壓症狀發生時，則須要坐下或躺下，從坐下或躺下的姿勢起身時應小心。若眩暈、頭昏眼花和心悸已造成困擾時，則應告知醫師以考慮調整劑量。
- 4.藥品交互作用：在對照實驗上，本品和利尿劑、及數種 $\beta$ -交感神經阻斷劑併用，無未預期的交互作用發生。本品也曾用在各種合併療法的病人，亦無交互作用。本品曾和下列藥品併用於至少50位病人：1)止痛/抗發炎劑(如acetaminophen, aspirin, codeine, ibuprofen, indomethacin)；2)抗生藥(如erythromycin, trimethoprim和sulfamethoxazole)；3)抗膽鹼/擬交感神經劑(如phenylephrine HCl, phenylpropanolamine HCl, pseudoephedrine HCl)；4)抗痛風劑(如allopurinol)；5)抗組織胺(如chlorpheniramine)；6)心血管劑(如atenolol, hydrochlorothiazide, methyldichthiazide, propranolol)；7)類固醇；8)胃腸藥(如antacids)；9)降血糖藥；10)鎮靜劑及精神安定劑(如diazepam)。
- 5.和其他藥併用：本品和verapamil併用時，會使Terazosin的平均AUC<sub>0-24</sub>和C<sub>max</sub>增加，T<sub>max</sub>減少。本品和captopril併用時，captopril的血中濃度不受影響，而Terazosin的最高血中濃度會隨劑量呈線性增加。
- 6.致癥性，基因突變，對生殖力的損害：由老鼠的實驗證明並無潛在的致畸胎性，亦未發現有致癥性。
- 7.懷孕，致畸胎作用：目前對孕婦尚未有足夠的和良好控制的 research，孕婦使用Terazosin的安全性也尚未確立。本品不建議孕婦使用，除非經評估其對母親和胎兒之有益性大於潛在的危險性時。
- 8.授乳婦：尚不知道Terazosin是否會分泌到乳汁中，因許多藥會分泌到乳汁中，故授乳婦在服用本品時應小心。
- 9.兒科使用：小孩使用的安全性和有效性尚未確立。

【副作用】

- 1.良性攝護腺肥大：衰弱無力、姿態性低血壓、暈眩、嗜眠、鼻充血/鼻炎和陽萎是常見的副作用。
- 2.高血壓：較常見的副作用為衰弱無力、視力模糊、暈眩、鼻充血、噁心、末梢水腫、心悸和嗜眠。
- 3.整體而言：胸痛、顏面水腫、發燒、腹痛、頭痛、肩痛；心血管系統：心律不整、血管擴張；消化系統：便秘、腹瀉、口乾、消化不良、脹氣、嘔吐；代謝/營養異常：痛風；肌肉骨骼系統：關節痛、關節炎、關節異常、肌肉痛；神經系統：憂慮、失眠；呼吸系統：氣管炎、感冒症狀、鼻衄；流行性感冒症狀、咳嗽增加、咽喉炎、鼻炎；皮膚及附屬器官：搔癢、紅疹、發汗；特殊感覺：視力不正常、泌尿、耳鳴；泌尿生殖系統：頻尿、停經後婦女之尿失禁、泌尿道感染。

【過量】

若因服用本品而導致低血壓，最重要的是使用對心血管系統的支持療法。併用使病人保持仰臥姿勢，使血壓回復和使心跳正常化。若此法不適當，休克時首先應使用體液擴張劑治療，若須要時，再使用血管升壓劑，且應監測和支持腎功能。實驗數據顯示，Terazosin 90~94%會與蛋白質結合，因此，透析可能不會有幫助。

【貯存條件】

請置於緊密、避光的容器中，貯存於25℃以下。

【包裝】

- 2~1000錠，塑膠瓶裝；鋁箔盒裝。
- 衛署藥製字第 G-6809 號 043188

SYNMOSA

健喬信元醫藥生技股份有限公司

33099 新竹縣湖口鄉光復北路21巷4號

SLT0227B