

核准日期：2007 年 01 月 01 日

修改日期：2010 年 07 月 16 日

2011 年 12 月 30 日

2012 年 11 月 01 日

2013 年 12 月 01 日

2015 年 10 月 18 日

2018 年 12 月 23 日

盐酸特拉唑嗪片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称：盐酸特拉唑嗪片

商品名称：马沙尼®

英文名称：Terazosin Hydrochloride Tablets

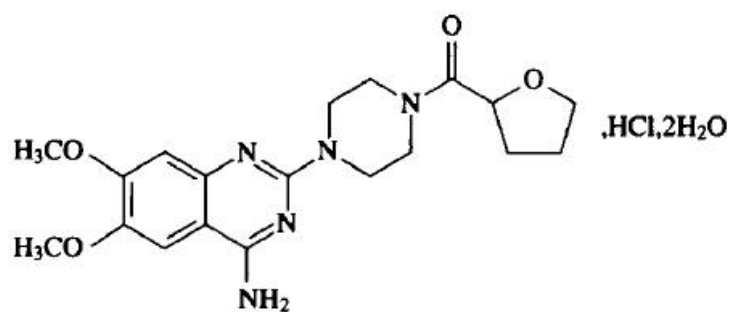
汉语拼音：Yansuan Telazuoqin Pian

【成份】

本品主要成份：盐酸特拉唑嗪

化学名称：1-（4-氨基-6,7-二甲氧基-2-喹唑啉基）-4-（四氢-2-呋喃甲酰基）哌嗪盐酸盐二水合物。

化学结构式：



分子式：C₁₉H₂₅N₅O₄•HCl•2H₂O

分子量：459.93

【性状】

本品为白色或类白色片。

【适应症】

本品口服给药适用于轻度或中度高血压治疗，可与噻嗪类利尿剂或其他抗高血压药物合用，还可以在其他药物不适用或无效时单独使用。本品主要降低舒张压。

本品口服给药还适用于良性前列腺增生(BPH)引起的症状治疗。

【规格】

2mg（按 $C_{19}H_{25}N_5O_4$ 计）

【用法用量】

高血压：

初始剂量为睡前服用 1mg，且不应超过，以尽量减少首剂低血压事件的发生。一周后，每日单剂量可加倍以达预期效应。常用维持剂量为每日一次 2～10mg。剂量超过 20mg 未见效能增加，未对 40mg 以上剂量进行研究。

良性前列腺增生(BPH)：

根据患者的反应来调整给药剂量。初始剂量为睡前服用 1mg，且不应超过，以尽量减少首剂低血压事件的发生。一周或两周后每日剂量可加倍以达预期效应。常用维持剂量为每日一次 5～10mg。给药两周后症状明显改善。到目前为止，还没有足够的证据表明剂量超过每日一次 10mg 会引起进一步的症状缓解。

应当采用初始剂量开始治疗并在四周后进行疗效总结。每次调整剂量都可能发生暂时的不良反应。如果不良反应持续存在，应考虑减少给药剂量。

【不良反应】

最常见的有：体虚无力、心悸、恶心、外周水肿、眩晕、嗜睡、鼻充血/鼻炎和视觉模糊/弱视。

另外，下列不良反应亦有报道：背痛、头痛、心动过速、体位性低血压、晕厥、水肿、体重增加、肢端疼痛、性欲降低、抑郁、神经质、感觉异常、呼吸困难、鼻窦炎、阳痿。

临床试验中报道的其他不良反应及在市场反馈报道中与本品使用关系不太明确的不良反应：胸痛、面部水肿、发烧、腹痛、颈痛、肩痛、血管舒张、心律失常、便秘、腹泻、口干、消化不良、胃肠气胀、呕吐、痛风、关节痛、关节炎、关节失常、肌痛、焦虑、失眠、支气管炎、鼻出血、流感症状、咽炎、鼻炎、感冒症状、瘙痒、皮疹、咳嗽、出汗、视觉异常、结膜炎、耳鸣、尿频、尿道感染以及绝经后妇女早期尿失禁。

使用本品至少报道了两例过敏反应。

有报道使用本品有血小板减少症和阴茎异常勃起，还报道有出现心房纤维性颤动，但尚未建立起因果关系。

实验室检查：在临床对照试验中发现血球容积、血红蛋白、白血球、总蛋白及白蛋白有少量减少，但具有统计意义。这些实验室结果表明存在血浆稀释的可能。连续使用本品治疗 24 个月以上对于前列腺特异性抗原（PSA）水平无显著性影响。

上市后经验：白内障手术期间，发生与 α -1 阻断剂有关的小瞳孔综合症的变异形式——手术中虹膜松弛综合症（IFIS）已有报告。

【禁忌】

已知对 α 肾上腺素受体拮抗剂敏感者禁用。

【注意事项】

肾功能损伤患者无需改变推荐剂量；

加用噻嗪类利尿药或其他抗高血压药时应减少特拉唑嗪的用量，必要时应重新调整剂量。特拉唑嗪与噻嗪类利尿药或其他抗高血压药合用时应注意防止发生低血压。

与其他 α 肾上腺素受体拮抗剂一样，建议特拉唑嗪不用于有排尿昏厥史的患者。

直立性低血压在良性前列腺增生患者的发生率较高血压患者高，其中老年患者较年轻患者容易发生。

如果用药中断数天，应当重新使用初始剂量方案进行治疗。

首次用药或停止用药、停药后重新给药会发生眩晕、轻度头痛或瞌睡；建议在给予初始剂量 12 小时内或剂量增加时应当避免从事驾驶或危险工作。

与其他 α 肾上腺素受体拮抗剂一样，特拉唑嗪也会引起眩晕。眩晕常发生在初始用药 30 到 90 分钟内，偶尔也会发生在剂量增加过快或加用另一种抗高血压药物时。如果发生眩晕，应当将患者放置横卧姿势，在必要时采用支持疗法。虽然在昏厥前偶尔会出现心动过速（心率每分钟 120~160 次），但通常认为晕厥与过度的直立性低血压有关。

当从卧位或坐位突然转向立位时可能会发生眩晕、轻度头痛甚至晕厥。出现这些症状时患者应躺下，然后在站立前稍坐片刻以防症状再度发生。大多数情况下，治疗初期后或连续用药阶段不会再发生该反应。

前列腺癌与良性前列腺增生有许多相同的症状，且两者常可能伴生，故使用本品治疗良性前列腺增生前应排除存在前列腺癌的可能性。

使用本品和其他相似的药物均可能引起阴茎异勃起，虽然该现象极少见，但医治不及时可导致永久性阳痿。

白内障手术：对于一些正在接受或曾经接受 α -1 阻断剂治疗的病人，在进行白内障手术时观察到手术中虹膜松弛综合症（IFIS）。IFIS 是小瞳孔综合症的一种变异形式，其具体特征是：虹膜发生松弛并且会对手术中带有刺激性的冲洗产生反应发生剧烈的涌动；即使在手术前用标准扩瞳药放大，手术期间还是会持续缩小；虹膜可能会由晶状体乳化切口脱出。眼科医生在进行这种手术时，应做好对手术技术进行技术修正的准备工作，如使用虹膜牵引钩、虹膜扩张或粘弹剂等。在白内障手术前停止 α -1 阻断治疗并不显示有益处。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

怀孕妇女禁用本品，哺乳期妇女使用本品时应停止授乳。

【儿童用药】

尚不明确。

【老年用药】

药代动力学研究表明老年人使用本品时不必改变推荐剂量。使用特拉唑嗪治疗良性前列腺增生时老年患者较年轻患者易发生直立性低血压。

【药物相互作用】

国外临床试验中，合用本品和血管紧张素（ACE）抑制剂或利尿剂治疗的患者中报道眩晕或其他相关不良反应的比例高于使用本品治疗的全体患者的比例。当本品与其他抗高血压药物合用时应当注意观察，以避免发生显著低血压。当在利尿剂或其他抗高血压药物中加入本品时，应当减少剂量并在必要时重新制定剂量。

已知本品与镇痛剂/抗炎药物、强心甙、降糖药、抗心律失常药物、抗焦虑药物/镇静药、抗细菌药、激素/甾体及治疗痛风药物不会产生相互作用。

有报告认为本品与磷酸二酯酶（PDE-5）抑制剂合用会发生低血压。

【药物过量】

本品过量可能导致急性低血压，此时应采用心血管支持疗法。患者应仰卧以使血压恢复及心率正常化。若该方法还不能解决，则应首先扩容以治疗休克，必要时使用血管加压药。应监测肾功能并应用常规支持疗法。因本品具有较高的血浆蛋白结合率，因此透析无效。

【药理毒理】

药理作用

虽然到目前为止还没有建立起盐酸特拉唑嗪降压作用的确切机理，但外周

血管的松弛主要是由于突触后 α 肾上腺素受体的竞争拮抗作用引起的。特拉唑嗪开始时产生缓慢的降低血压作用，随后发挥持续抗高血压效应。

临床经验表明血浆总胆固醇降低 2-5%和 LDLc+VLDLc 结合部分降低 3-7%与特拉唑嗪治疗剂量有关。

临床试验中可观察到服用盐酸特拉唑嗪后总胆固醇及结合低密度和极低密度脂蛋白的血浆浓度轻度降低。合用其他能升高血浆总胆固醇的抗高血压药未见总胆固醇的升高。

研究表明 α_1 肾上腺素受体的拮抗作用有益于改善慢性膀胱阻滞患者（如良性前列腺增生，BPH）的尿道功能。BPH 症状主要是由前列腺增生及尿道出口和前列腺平滑肌阈值增加（主要由 α_1 肾上腺素受体调节）引起。

体外试验表明盐酸特拉唑嗪可拮抗去氧肾上腺素诱导的人前列腺组织的收缩。在临床试验中还显示了盐酸特拉唑嗪可以改善 BPH 患者的尿道功能和症状。

毒性研究

遗传毒性：

盐酸特拉唑嗪体内、外试验（Ames 试验、细胞遗传学体内试验、小鼠显性致死试验、中国仓鼠染色体畸变体内试验和 V79 细胞正向突变试验）中均未见潜在致突变性。

生殖毒性：

大鼠每日灌胃 8、30 和 120mg/kg 特拉唑嗪以研究对生育力/生殖影响。结果显示 30mg/kg 组（240mg/M²，人最大推荐剂量的 20 倍）20 只雄性大鼠中有 4 只、120mg/kg 组（960mg/M²，人最大推荐剂量的 80 倍）19 只雄性大鼠有 5 只丧失生育能力。睾丸的重量和形状未受影响。交配后阴道涂片显示 30 和 120mg/kg 组较对照组精子数少，精子数目与怀孕胎仔数有良好的相关性。

大鼠连续 1 或 2 年每日经口给予特拉唑嗪 40 和 250mg/kg（人最大推荐剂

量的 29 倍和 175 倍) 睾丸萎缩明显增加, 但每日 8mg/kg (大于人最大推荐剂量的 6 倍) 未见该现象。犬连续 3 月每日给予特拉唑嗪 300mg/kg (大于人最大推荐剂量的 500 倍) 也可见睾丸萎缩。但连续 1 年每日给予特拉唑嗪 20mg/kg (人最大推荐剂量的 38 倍) 未见睾丸萎缩。哌唑嗪(一种选择性 α_1 受体阻滞剂) 也可导致该损伤。

大鼠和家兔每日经口给予分别为人最大推荐剂量 280 和 60 倍的特拉唑嗪未见致畸作用。大鼠每日给予 480mg/kg (人最大推荐剂量的 280 倍) 可见吸收胎。家兔每日给予人最大推荐剂量 60 倍的特拉唑嗪, 可见吸收胎增加、胎儿体重减轻和子代多胎。该现象可能为母体毒性的继发反应。

大鼠每日给予 120 mg/kg (大于人最大推荐剂量的 75 倍) 特拉唑嗪组幼仔死亡数较对照组明显增加。

致癌作用

雄性大鼠长时间给予大剂量特拉唑嗪可引起肿瘤的生成, 但在雌性大鼠和小鼠未见该现象。该现象与人临床用药的相关性尚未知。

【药代动力学】

原形药物血浆浓度最大值出现在给药后 1 小时左右, 半衰期大约为 12 小时。食物很少甚至不会影响特拉唑嗪生物利用度。给药量的大约 40%经尿液排泄, 60%经粪便排出。特拉唑嗪具有较高的血浆蛋白结合率。

【贮藏】遮光, 密封保存。

【包装】

铝塑包装: 14 片/ 板, 1 板/ 盒;

铝塑包装: 14 片/ 板, 2 板/ 盒;

铝塑包装: 20 片/ 板, 1 板/ 盒。

【有效期】24 个月

【执行标准】

【批准文号】国药准字 H10970081

【生产企业】

企业名称：华润赛科药业有限责任公司

生产地址：北京市通州区中关村科技园光机电基地经海七路 3 号

邮政编码：101111

电话号码：400-810-8780

传真号码：010-67793887

网 址：www.saike.com.cn