

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

НД РБ

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Моксонидин, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой
Моксонидин, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

3 1 2 5 5 - 2 0 2 3

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: моксонидин.

Каждая таблетка содержит 0,2 мг или 0,4 мг моксонидина.

Вспомогательное вещество, наличие которого следует учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза моногидрат.

Полный список вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.



3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Моксонидин, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета круглые, двояковыпуклые.

Моксонидин, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета круглые, двояковыпуклые.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Артериальная гипертензия.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Рекомендуемая начальная доза моксонидина составляет 0,2 мг в сутки, предпочтительнее в утренние часы. При недостаточности терапевтического эффекта через 4 недели терапии доза может быть увеличена до 0,4 мг в один или два приема в день. Максимальная разовая доза составляет 0,4 мг. Максимальная суточная доза - 0,6 мг (разделенная на два приема). Не следует превышать рекомендованные дозы.

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (скорость клубочковой фильтрации (СКФ) от 30 до 60 мл/мин) или тяжелой почечной недостаточностью (СКФ от 15 до 30 мл/мин) начальная доза составляет 0,2 мг в сутки. В случае необходимости и при хорошей переносимости, доза может быть увеличена до 0,4 мг в сутки у пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести и до 0,3 мг в сутки у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (см. раздел 4.4).

Пациенты на гемодиализе

У пациентов, находящихся на гемодиализе суточная доза составляет 0,2 мг. При необходимости и при хорошей переносимости, доза может быть увеличена до 0,4 мг в сутки.

Дети

Моксонидин не рекомендуется для применения у детей и подростков младше 18 лет, в связи с отсутствием данных о безопасности и эффективности применения.

Способ применения

Внутри, независимо от приема пищи, запивая достаточным количеством воды.

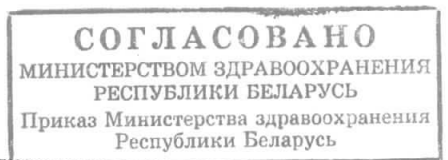
Лечение препаратом может быть длительным.

4.3. Противопоказания

- Повышенная чувствительность к моксонидину или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- синдром слабости синусового узла или синоатриальная блокада;
- брадикардия (частота сердечных сокращений в покое менее 50 ударов в минуту);

- атриовентрикулярная блокада 2-й или 3-й степени;
- сердечная недостаточность.

3 1 2 5 5 - 2 0 2 3



4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Имели место случаи атриовентрикулярной блокады различной степени у пациентов во время терапии моксонидином. На основании этих данных причинная связь приема моксонидина с замедлением атриовентрикулярной проводимости не может быть полностью исключена. Таким образом, рекомендуется соблюдать осторожность при лечении пациентов с возможной предрасположенностью к развитию атриовентрикулярной блокады. Необходимо соблюдать особую осторожность при использовании моксонидина у пациентов с атриовентрикулярной блокадой 1-й степени во избежание брадикардии. Моксонидин противопоказан пациентам с высокой степенью атриовентрикулярной блокады (см. раздел 4.3).

Моксонидин не рекомендуется применять при депрессии ввиду отсутствия клинических данных.

Необходимо соблюдать особую осторожность при использовании моксонидина у пациентов с тяжелой ишемической болезнью сердца или нестабильной стенокардией, так как опыт его применения у данной категории пациентов ограничен.

Поскольку моксонидин выводится, главным образом, почками, следует с осторожностью назначать моксонидин пациентам с почечной недостаточностью. При применении препарата у таких пациентов рекомендуется тщательное титрование дозы, особенно в начале терапии. Начальная доза должна составлять 0,2 мг в сутки и может быть увеличена максимум до 0,4 мг в сутки у пациентов со средней почечной недостаточностью (СКФ от 30 до 60 мл/мин) и до 0,3 мг в сутки у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (СКФ менее 30 мл/мин).

Если моксонидин используется в комбинации с β -блокатором и необходимо прекратить лечение обоими препаратами, то сначала следует отменить β -блокатор, а несколько дней спустя отменить моксонидин.

В настоящий момент нет подтверждений того, что прекращение приема моксонидина приводит к повышению артериального давления («эффект отмены»). Однако не рекомендуется резко прекращать лечение моксонидином. Дозу препарата следует уменьшать постепенно в течение двух недель.

Пациенты пожилого возраста более чувствительны к действию антигипертензивных препаратов, воздействующих на сердечно-сосудистую систему. Следовательно, лечение следует начинать с самой низкой дозы, а увеличение дозы необходимо проводить с осторожностью для предотвращения серьезных нежелательных реакций.

Дополнительная информация

Препарат Моксонидин содержит:

лактозу - пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Нерекомендуемые комбинации:

с алкоголем

Увеличение седативного действия. Рекомендуется воздержаться от управления транспортными средствами и работы с опасными механизмами из-за недостатка внимания. Избегать употребления алкогольных напитков и лекарственных препаратов, содержащих спирт.

с β -блокаторами при сердечной недостаточности

Центральное снижение симпатического тонуса и сосудорасширяющее действие антигипертензивных препаратов центрального действия, опасны для пациентов с сердечной недостаточностью, получающих β -блокаторы и вазодилататоры.

Комбинации, требующие соблюдения мер предосторожности:

3125Б-2023

с баклофеном

Увеличение риска гипотензии. Необходим мониторинг артериального давления, в случае необходимости требуется корректировка дозы.

с β -блокаторами (кроме эсмолола)

Значительное повышение артериального давления в случае резкого прекращения лечения антигипертензивным препаратом центрального действия. Избегать резкой отмены моксонидина.

Комбинации, которые следует принимать во внимание:

с амифостином

Повышается риск гипотензии, особенно ортостатической.

с нестероидными противовоспалительными препаратами

На основании экстраполяции данных по индометацину, возможно уменьшение антигипертензивного эффекта путем ингибирования сосудорасширяющих простагландинов и задержки жидкости.

с α -блокаторами, применяемыми в урологии или антигипертензивными α -блокаторами

Повышение гипотензивного эффекта. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

с нейролептиками, трициклическими антидепрессантами, нитратами и их производными

Повышенный риск гипотензии, особенно ортостатической.

Одновременное назначение моксонидина с лекарственными препаратами, обладающими седативным действием, такими как производные морфина (анальгетики, противокашлевые и препараты для заместительной терапии), нейролептики, барбитураты, бензодиазепины и снотворные средства, не относящиеся к производным бензодиазепина (например, мепробамат), седативные препараты, антидепрессанты (амитриптилин, доксепин, миансерин, мirtазапин, тримипрамин), антигистаминные препараты (блокаторы H_1 -рецепторов с седативным действием), центральные антигипертензивные препараты, баклофен, талидомид, сопровождается усилением центральной депрессии. В связи с возможным снижением внимания необходимо избегать управления транспортными средствами и использования опасных механизмов.

Одновременное применение моксонидина с другими антигипертензивными препаратами приводит к взаимному усилению антигипертензивного действия.

Поскольку трициклические антидепрессанты могут снижать эффективность антигипертензивных препаратов с центральным механизмом действия, не рекомендуется использовать вместе с моксонидином.

Моксонидин умеренно улучшал ослабленные когнитивные функции у пациентов, получающих лоразепам.

Моксонидин выводится путем канальцевой секреции. Не исключается его взаимодействие с другими лекарственными препаратами, которые выводятся путем канальцевой секреции.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Отсутствуют адекватные данные по применению моксонидина у беременных женщин. Исследования на животных выявили эмбриотоксические эффекты (см. раздел 5.3). Назначать моксонидин беременным женщинам не рекомендуется, если только это не обусловлено крайней необходимостью.

Лактация

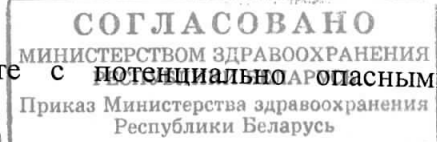
Моксонидин не следует применять при лактации, поскольку препарат выделяется в грудное молоко.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Исследования влияния препарата на способность управлять автомобилем и другими механизмами не проводились. Некоторые нежелательные реакции препарата (сонливость и головокружение) могут снижать реакцию и концентрацию внимания пациента, что может повлиять на его способность управлять автомобилем и механизмами. Это следует

учитывать при управлении автомобилем или работе с потенциально опасными механизмами.

3 1 2 5 5 - 2 0 2 3



4.8. Нежелательные реакции

Наиболее частые нежелательные реакции у пациентов, принимающих моксонидин: сухость во рту, головокружение, астения и сонливость. Выраженность этих симптомов часто снижается после первых нескольких недель терапии.

Нежелательные реакции на препарат описаны в следующем порядке по частоте с применением следующей градации: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$).

Нарушения со стороны сердца: нечасто – брадикардия.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: нечасто – шум в ушах.

Нарушения со стороны нервной системы:

часто – головная боль*, головокружение, вертиго, сонливость;
нечасто – обморок*.

Нарушения со стороны сосудов: нечасто – гипотензия* (включая ортостатическую гипотензию).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:

очень часто – сухость во рту;

часто – диарея, тошнота, рвота, диспепсия.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки:

часто – сыпь, зуд;

нечасто – ангионевротический отек.

Общие расстройства и нарушения в месте введения:

часто – астения;

нечасто – отек.

Нарушения со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани:

часто – боль в спине;

нечасто – боль в области шеи.

Психические расстройства:

часто – нарушения сна;

нечасто – повышенная возбудимость.

*увеличение частоты по сравнению с плацебо не наблюдалось.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза - риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях.

Республика Беларусь

220037, г. Минск, Товарищеский пер., 2а.

УП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении»

Телефон/факс отдела фармаконадзора: +375(17)242-00-29

Электронная почта: rcpl@rceth.by, rceth@rceth.by

Сайт: www.rceth.by

4.9. Передозировка

Сообщалось о нескольких случаях передозировки без летального исхода при приеме моксонидина в дозе 19,6 мг.

Симптомы

Головная боль, седативный эффект, сонливость, гипотензия, головокружение, астения, брадикардия, сухость во рту, рвота, усталость и боль в эпигастрии. При тяжелой передозировке рекомендуется тщательный контроль за состоянием пациента, особенно при нарушении сознания и угнетении дыхания.

3125Б-2023

Кроме того, как было показано в нескольких исследованиях по изучению высоких доз у животных, могут также встречаться переходящая артериальная гипертензия, тахикардия и гипергликемия.

Лечение

Специфического антидота не существует. В случае гипотензии рекомендуется восстановление объема циркулирующей крови за счет введения жидкости и допамина. Брадикардия может быть купирована атропином. Антагонисты α -адренорецепторов могут уменьшать или устранять парадоксальные гипертензивные эффекты при передозировке моксонидином.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: Антигипертензивные средства. Агонисты имидазолиновых рецепторов.

Код АТХ: C02AC05

Механизм действия

Моксонидин является сильным антигипертензивным средством, что было показано на различных моделях животных. Имеющиеся экспериментальные данные свидетельствуют о том, что местом антигипертензивного действия моксонидина является центральная нервная система (ЦНС). Моксонидин является селективным агонистом I_1 -имидазолиновых рецепторов. Эти имидазолин-чувствительные рецепторы сконцентрированы в ростральном отделе вентролатеральной части продолговатого мозга - участке, который считается центром регуляции периферической симпатической нервной системы. Результат такого влияния на I_1 -имидазолиновые рецепторы проявляется в снижении активности симпатических нервов (показано для сердечных, висцеральных и ренальных симпатических нервов) и в снижении артериального давления.

Моксонидин отличается от других антигипертензивных средств центрального действия тем, что он обладает низким сродством к центральным α_2 -адренорецепторам, по сравнению с I_1 -имидазолиновыми рецепторами; α_2 -адренорецепторы считаются молекулярной мишенью, через которую осуществляются наиболее распространенные нежелательные реакции антигипертензивных агентов центрального действия, такие как седативный эффект и сухость во рту.

В организме человека моксонидин приводит к снижению системного сосудистого сопротивления и, следовательно, артериального давления.

В ходе исследования было отмечено что через 6 месяцев применения моксонидина наблюдалась регрессия гипертрофии левого желудочка.

По сравнению с клонидином моксонидин считается в 10 раз более активным на центральном уровне и в 10 раз менее активным на периферическом уровне, поэтому прекращение лечения не должно сопровождаться рецидивом артериальной гипертензии, учитывая более низкое сродство к α_2 -адренорецепторам.

Проведенные исследования не показали влияния на частоту сердечных сокращений, инотропность и проводимость.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

После перорального приема, моксонидин всасывается на 90%. Биодоступность составляет приблизительно 88%, указывая на отсутствие значительного метаболизма первого прохождения. Прием пищи не оказывает влияния на фармакокинетику моксонидина.

Максимальный уровень в плазме крови достигается на протяжении 30-180 минут после приема препарата.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 7% (объем распределения равен $1,8 \pm 0,4$ л/кг).

Биотрансформация

10-20 % моксонидина метаболизируется, главным образом, до 4,5-дегидромоксонидина и производных гуанидина вследствие раскрытия имидазольного кольца. Гипотензивный

эффект 4,5-дегидромоксонидина составляет только 1/10 от такового для моксонидина, а для производных гуанидина - менее 1/100.

Элиминация

Моксонидин и его метаболиты почти полностью выводятся почками. Более 90 % дозы выводится через почки в течение первых 24 часов после приема, и только около 1 % выводится с калом. Доля выведенного моксонидина через почки составляет около 50-75 %. Средний период полувыведения из плазмы составляет 2,2-2,3 часа, а период полувыведения почками составляет 2,6-2,8 часа.

Особые категории населения

Пациенты с артериальной гипертензией

По сравнению со здоровыми добровольцами у пациентов с артериальной гипертензией не отмечается изменений фармакокинетики моксонидина.

Пациенты пожилого возраста

Небольшие различия между фармакокинетическими свойствами моксонидина у здоровых пожилых пациентов и взрослых лиц молодого возраста не являются клинически значимыми. Поскольку отсутствует кумуляция моксонидина, коррекция дозы не требуется при условии нормальной функции почек.

Дети

Так как моксонидин не рекомендуется для применения у детей, никакие фармакокинетические исследования в этой субпопуляции не проводились.

Пациенты с почечной недостаточностью

Выведение моксонидина в значительной степени связано с клиренсом креатинина.

У пациентов с умеренными нарушениями функции почек (скорость клубочковой фильтрации (СКФ) 30-60 мл/мин) AUC повышается на 85 %, а клиренс снижается на 52 %. Для таких пациентов следует проводить тщательный контроль гипотензивного эффекта моксонидина, в особенности в начале лечения. Кроме того, индивидуальная доза не должна превышать 0,2 мг, а суточная доза - 0,4 мг.

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (СКФ < 30 мл/мин) устойчивые концентрации в плазме и конечный период полувыведения приблизительно в 3 раза выше. У этих пациентов не наблюдалось никакого неожиданного накопления препарата после многократного приема.

У пациентов с почечной недостаточностью терминальной стадии (СКФ < 10 мл/мин), находящихся на гемодиализе, величина площади под кривой «концентрация - время» (AUC) и конечный период полувыведения в 6 и 4 раза выше, соответственно, по сравнению с гипертензивными пациентами с нормальной функцией почек.

Поэтому, у пациентов с поражением функции почек, дозу моксонидина следует титровать в соответствии с индивидуальными потребностями.

Моксонидин в незначительной мере выводится при гемодиализе.

5.3. Данные доклинической безопасности

Доклинические данные не содержат информации о каком-либо особом риске для человека по результатам стандартных исследований фармакологической безопасности, хронической токсичности, генотоксичности, канцерогенного потенциала и репродуктивной токсичности.

Исследования на животных показали токсическое влияние на эмбриональное развитие при применении доз, токсичных для материнского организма. В исследованиях репродуктивной токсичности не установлено влияния на фертильность и тератогенный потенциал. Эмбриотоксические эффекты наблюдали у крыс при дозах ≥ 9 мг/кг/день, а у кроликов - при дозах свыше 0,7 мг/кг/день. В пери- и постнатальном исследовании у крыс влияние на развитие и жизнеспособность потомства проявлялось при дозах ≥ 3 мг/кг/день.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

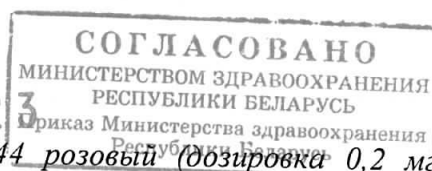
6.1. Перечень вспомогательных веществ

Кросповидон (тип А)

Повидон К-25

Магния стеарат
Кремния диоксид коллоидный безводный
Лактоза моногидрат 100 mesh

НД РБ



3125Б-2023

Состав оболочки Опадрай II серии 32 (F) код 240044 розовый (дозировка 0,2 мг):
гипромеллоза, макрогол 4000 (Полиэтиленгликоль), лактоза моногидрат, окрашивающий пигмент: титана диоксид E171, железа оксид красный E172, железа оксид желтый E172.
Состав оболочки Опадрай II серии 32 (F) код 280000 белый (дозировка 0,4 мг):
гипромеллоза, макрогол 4000 (Полиэтиленгликоль), лактоза моногидрат, окрашивающий пигмент: титана диоксид E171.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в оригинальной упаковке (пачка картонная) для защиты от света при температуре не выше 25°C.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

10 таблеток в контурной ячейковой упаковке. 3 контурные ячейковые упаковки вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона (№10х3).

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Весь оставшийся лекарственный препарат и отходы следует уничтожить в установленном порядке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Открытое акционерное общество «Борисовский завод медицинских препаратов»
Республика Беларусь, Минская обл., г. Борисов, ул. Чапаева, 64,
тел +375(177)735612, 744280
электронная почта: market@borimed.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Моксонидин доступна на официальном сайте уполномоченного органа государства – члена Евразийского союза в информационно-коммуникационной сети Интернет <http://www.rceth.by>.