

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Моксонидин-СЗ

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Моксонидин-СЗ

Международное непатентованное наименование: моксонидин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

дозировка 0,2 мг:

действующее вещество: моксонидин – 0,2 мг

вспомогательные вещества (ядро): кроскармеллоза натрия (примеллоза) – 3,0 мг; лактозы моногидрат (лактопресс) (сахар молочный) – 95,3 мг; кремния диоксид коллоидный (аэросил) – 0,5 мг; натрия стеарилфумарат – 1,0 мг;

вспомогательные вещества (оболочка): Опадрай II (спирт поливиниловый, частично гидролизованный – 1,32 мг; титана диоксид Е 171 – 0,6027 мг; тальк – 0,6 мг; макрогол (полиэтиленгликоль 3350) – 0,3705 мг; лецитин соевый Е 322 – 0,105 мг; краситель железа оксид (II) желтый – 0,0003 мг; краситель железа оксид (II) красный – 0,0015 мг).

дозировка 0,3 мг:

действующее вещество: моксонидин – 0,3 мг

вспомогательные вещества (ядро): кроскармеллоза натрия (примеллоза) – 3,0 мг; лактозы моногидрат (лактопресс) (сахар молочный) – 95,2 мг; кремния диоксид коллоидный (аэросил) – 0,5 мг; натрия стеарилфумарат – 1,0 мг;

вспомогательные вещества (оболочка): Опадрай II (спирт поливиниловый, частично гидролизованный – 1,32 мг; титана диоксид Е 171 – 0,6003 мг; тальк – 0,6 мг; макрогол (полиэтиленгликоль 3350) – 0,3705 мг; лецитин соевый Е 322 – 0,105 мг; алюминиевый лак на основе красителя пунцового [Понсо 4R] – 0,0039 мг; алюминиевый лак на основе красителя солнечный закат желтый – 0,0003 мг).

дозировка 0,4 мг:

действующее вещество: моксонидин – 0,4 мг

вспомогательные вещества (ядро): кроскармеллоза натрия (примеллоза) – 3,0 мг; лактозы моногидрат (лактопресс) (сахар молочный) – 95,1 мг; кремния диоксид коллоидный (аэросил) – 0,5 мг; натрия стеарилфумарат – 1,0 мг;

вспомогательные вещества (оболочка): Опадрай II (спирт поливиниловый, частично гидролизованный – 1,32 мг; титана диоксид Е 171 – 0,5751 мг; тальк – 0,6 мг; макрогол (полиэтиленгликоль 3350) – 0,3705 мг; лецитин соевый Е 322 – 0,105 мг; алюминиевый лак на основе индигокармина – 0,0018 мг; алюминиевый лак на основе красителя азорубин – 0,0153 мг; алюминиевый лак на основе красителя пунцового [Понсо 4R] – 0,0123 мг).

Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-розового цвета, круглые, двояковыпуклые. Таблетки на изломе белого или почти белого цвета (дозировка 0,2 мг).

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета, круглые, двояковыпуклые. Таблетки на изломе белого или почти белого цвета (дозировка 0,3 мг).

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой темно-розового цвета, круглые, двояковыпуклые. Таблетки на изломе белого или почти белого цвета (дозировка 0,4 мг).

Фармакотерапевтическая группа:

Гипотензивное средство центрального действия.

Код АТХ: C02AC05

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Моксонидин является гипотензивным средством с центральным механизмом действия. В стволовых структурах мозга (ростральный слой боковых желудочков) моксонидин селективно стимулирует имидазолин-чувствительные рецепторы, принимающие участие в тонической и рефлекторной регуляции симпатической нервной системы. Стимуляция имидазолиновых рецепторов снижает периферическую симпатическую активность и артериальное давление (АД).

Моксонидин отличается от других симпатолитических гипотензивных средств более низким сродством к α_2 -адренорецепторам, что объясняет меньшую вероятность развития седативного эффекта и сухости во рту.

Прием моксонидина приводит к снижению системного сосудистого сопротивления и АД.

Моксонидин улучшает на 21 % индекс чувствительности к инсулину (в

сравнении с плацебо) у пациентов с ожирением, инсулинрезистентностью и умеренной степенью артериальной гипертензии.

Фармакокинетика

Всасывание:

После приема внутрь моксонидин быстро и почти полностью абсорбируется в верхних отделах желудочно-кишечного тракта. Абсолютная биодоступность составляет приблизительно 88 %. Время достижения максимальной концентрации – около 1 час. Прием пищи не оказывает влияние на фармакокинетику препарата.

Распределение

Связь с белками плазмы крови составляет 7,2 %.

Метаболизм

Основной метаболит – дегидрированный моксонидин. Фармакодинамическая активность дегидрированного моксонидина – около 10 % по сравнению с моксонидином.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) моксонидина и метаболита составляет 2,5 и 5 часов соответственно. В течение 24 часов свыше 90 % моксонидина выводится почками (около 78 % в неизмененном виде и 13 % в виде дегидриромоксонидина, другие метаболиты в моче не превышают 8 % от принятой дозы). Менее 1 % дозы выводится через кишечник.

Фармакокинетика у пациентов с артериальной гипертензией:

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

Фармакокинетика в пожилом возрасте

Отмечены клинически незначимые изменения фармакокинетических показателей моксонидина у пожилых пациентов, вероятно обусловленные снижением интенсивности его метаболизма и/или несколько более высокой биодоступностью.

Фармакокинетика у детей

Моксонидин не рекомендуется для применения у пациентов моложе 18 лет, в связи с чем в этой группе фармакокинетические исследования не проводились.

Фармакокинетика при почечной недостаточности

Выведение моксонидина в значительной степени коррелирует с клиренсом креатинина (КК). У пациентов с умеренной почечной недостаточностью (КК в интервале 30-60 мл/мин) равновесные концентрации в плазме крови и конечный $T_{1/2}$ приблизительно в 2 и 1,5 раза выше, чем у пациентов с нормальной функцией почек (КК более 90 мл/мин.).

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин.), равновесные концентрации в плазме крови и конечный $T_{1/2}$ в 3 раза выше, чем у пациентов с нормальной функцией почек. Назначение многократных доз моксонидина приводит к предсказуемой кумуляции в организме

пациентов с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью. У пациентов с терминальной почечной недостаточностью (КК менее 10 мл/мин), находящихся на гемодиализе, равновесные концентрации в плазме крови и конечный $T_{1/2}$ соответственно в 6 и 4 раза выше, чем у пациентов с нормальной функцией почек. Во всех группах максимальная концентрация моксонидина в плазме крови выше в 1,5 - 2 раза. У пациентов с нарушениями функции почек дозировка должна подбираться индивидуально. Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

Показания к применению

Артериальная гипертензия.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к активному веществу и другим компонентам препарата;
- ангионевротический отек в анамнезе;
- синдром слабости синусового узла или синоатриальная блокада;
- тяжелая печеночная недостаточность;
- выраженная брадикардия (частота сердечных сокращений (ЧСС) покоя менее 50 уд./мин);
- атриовентрикулярная блокада II и III степени;
- острая и хроническая сердечная недостаточность;
- период грудного вскармливания;
- наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или мальабсорбция глюкозы-галактозы;
- возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности).

С осторожностью

Атриовентрикулярная блокада I степени (риск развития брадикардии), заболевания коронарных артерий (в т.ч. ишемическая болезнь сердца, нестабильная стенокардия, ранний постинфарктный период), заболевания периферического кровообращения (в т.ч. перемежающаяся хромота, синдром Рейно), эпилепсия, болезнь Паркинсона, депрессия, глаукома; умеренная почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин, креатинин сыворотки 105 - 160 мкмоль/л), печеночная недостаточность; беременность.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Клинические данные о применении лекарственного препарата Моксонидин-СЗ у беременных отсутствуют.

В ходе исследований на животных было установлено эмбриотоксическое действие препарата.

Моксонидин-СЗ следует назначать беременным только после тщательной оценки соотношения риска и пользы, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Период грудного вскармливания

Моксонидин проникает в грудное молоко и поэтому не должен назначаться во время кормления грудью. При необходимости применения лекарственного препарата Моксонидин-СЗ в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь, независимо от приема пищи.

В большинстве случаев начальная доза препарата Моксонидин-СЗ составляет 0,2 мг в сутки. Максимальная разовая доза составляет 0,4 мг. Максимальная суточная доза, которую следует разделить на 2 приема, составляет 0,6 мг.

Необходима индивидуальная коррекция суточной дозы в зависимости от переносимости пациентом проводимой терапии. Коррекция дозы для пациентов с печеночной недостаточностью не требуется.

Начальная доза для пациентов, находящихся на гемодиализе – 0,2 мг в сутки.

В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза может быть увеличена до максимальной 0,4 мг.

Пациентам с почечной недостаточностью рекомендуется осторожный подбор дозы, особенно в начале лечения. Начальная доза должна составлять 0,2 мг в сутки. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза препарата может быть увеличена максимум до 0,4 мг для пациентов с умеренной почечной недостаточностью (КК более 30 мл/мин, но менее 60 мл/мин) и 0,3 мг для пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин).

Побочное действие

Наиболее частые побочные эффекты у пациентов, принимающих моксонидин: сухость во рту, головокружение, астения и сонливость. Эти симптомы часто уменьшаются по прошествии первых недель терапии.

У пациентов, принимавших участие в плацебо-контролируемых клинических исследованиях моксонидина, отмечены следующие побочные эффекты. Частота побочных эффектов, приведенных ниже, определялась соответственно следующему: очень часто ($>1/10$); часто ($>1/100$, $<1/10$); нечасто ($>1/1000$, $<1/100$); включая отдельные сообщения.

Со стороны центральной нервной системы:

Часто: головная боль*, головокружение (вертиго), сонливость, бессонница.

Нечасто: обморок*, повышенная возбудимость.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

Нечасто: выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия*, брадикардия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

Очень часто: сухость во рту.

Часто: диарея, тошнота, рвота, диспепсия.

Со стороны кожи и подкожных тканей:

Часто: кожная сыпь, зуд.

Нечасто: ангионевротический отек.

Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения:

Нечасто: звон в ушах.

Со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани:

Часто: боль в спине.

Нечасто: боль в области шеи.

Общие расстройства и нарушения в месте введения:

Часто: астения.

Нечасто: периферические отеки.

(* - частота сопоставима с плацебо).

Передозировка

Имеются сообщения о нескольких случаях передозировки без летального исхода, когда одномоментно применялись дозы до 19,6 мг.

Симптомы: головная боль, седативный эффект, сонливость, выраженное снижение АД, головокружение, астения, брадикардия, сухость во рту, рвота, усталость, боль в эпигастральной области, угнетение дыхания и нарушение сознания.

Кроме того, возможны также кратковременное повышение АД, тахикардия и гипергликемия, как было показано в нескольких исследованиях по изучению высоких доз на животных.

Лечение: Специфического антидота не существует. В случае выраженного снижения АД может потребоваться восстановление объема циркулирующей крови за счет введения жидкости и допамина (инъекционно).

Брадикардия может быть купирована атропином (инъекционное введение).

В тяжелых случаях передозировки рекомендуется тщательно контролировать нарушения сознания и не допускать угнетения дыхания.

Антагонисты альфа-адренорецепторов могут уменьшать или устранять парадоксальные гипертензивные эффекты при передозировке моксонидином.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Совместное применение моксонидина с другими гипотензивными средствами приводит к аддитивному эффекту.

Трициклические антидепрессанты могут снижать эффективность гипотензивных средств центрального действия, в связи с чем не рекомендуется их прием совместно с моксонидином.

Моксонидин может усиливать седативное действие трициклических антидепрессантов (необходимо избегать совместного назначения), транквилизаторов, этанола, седативных и снотворных средств.

Моксонидин способен умеренно улучшать ослабленные когнитивные функции у пациентов, получающих лоразепам.

Моксонидин может усиливать седативный эффект производных бензодиазепина при их одновременном назначении.

Моксонидин выделяется путем канальцевой секреции. Поэтому не исключено его взаимодействие с другими препаратами, выделяющимися путем канальцевой секреции.

Особые указания

Во время лечения необходим регулярный контроль АД.

В постмаркетинговом наблюдении зафиксированы случаи атриовентрикулярной блокады различной степени тяжести у пациентов, принимающих моксонидин. Связь между приемом препарата Моксонидин-СЗ и замедлением атриовентрикулярной проводимости не может быть полностью исключена. Таким образом, при лечении пациентов с вероятной предрасположенностью к развитию атриовентрикулярной блокады рекомендуется соблюдать осторожность.

При необходимости отмены одновременного принимаемых бета-адреноблокаторов и препарата Моксонидин-СЗ сначала отменяют бета-адреноблокаторы и лишь через несколько дней Моксонидин-СЗ.

В настоящее время нет подтверждений того, что прекращение приема препарата Моксонидин-СЗ приводит к повышению АД.

Однако не рекомендуется прекращать прием препарата Моксонидин-СЗ резко, вместо этого следует постепенно уменьшать дозу препарата в течении двух недель.

У пациентов пожилого возраста может быть повышен риск развития сердечно-сосудистых осложнений вследствие применения гипотензивных препаратов, поэтому терапию препаратом Моксонидин-СЗ следует начинать с минимальной дозы.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Исследования влияния препарата на способность управлять автомобилем и другими механизмами не проводились.

Имеются сообщения о сонливости и головокружении в период лечения моксонидином. Это следует учитывать при выполнении вышеуказанных действий.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 0,2 мг, 0,3 мг и 0,4 мг

По 10, 14 или 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку.

По 60 таблеток в банки полимерные или во флаконы полимерные.

Каждую банку, флакон, 3 контурные ячейковые упаковки по 10 таблеток, 1, 2 контурные ячейковые упаковки по 14 таблеток или 1, 2, 3, 4 контурные ячейковые упаковки по 30 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель:

ЗАО «Северная звезда», Россия

188663, Россия, Ленинградская обл., Всеволожский муниципальный район,
Кузьмолотовское городское поселение, г.п. Кузьмолотовский, ул. Заводская, д. 4;
д. 4 корп. 1; д. 4 корп. 2

тел/факс: (812) 309-21-77.

Владелец регистрационного удостоверения/организация, принимающая претензии потребителя

ЗАО «Северная звезда», Россия

Юридический адрес предприятия-производителя:

111141, г. Москва, Зеленый проспект, д. 5/12, стр. 1

Адрес производителя и принятия претензий:

188663, Россия, Ленинградская обл., Всеволожский муниципальный район,
Кузьмолотовское городское поселение, г.п. Кузьмолотовский, ул. Заводская, д. 4;
д. 4 корп. 1; д. 4 корп. 2

тел/факс: (812) 309-21-77.

Генеральный директор
ЗАО «Северная звезда»



Е.В. Чуглина