

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Моксонидин-ЛФ, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.
Моксонидин-ЛФ, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: моксонидин.

Моксонидин-ЛФ, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 0,2 мг моксонидина;
вспомогательные вещества, наличие которых следует учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. разделы 4.3, 4.4).

Моксонидин-ЛФ, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 0,4 мг моксонидина;
вспомогательные вещества, наличие которых следует учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. разделы 4.3, 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Моксонидин-ЛФ, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые таблетки двояковыпуклой формы, покрытые пленочной оболочкой светлорозового цвета.

Моксонидин-ЛФ, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые таблетки двояковыпуклой формы, покрытые пленочной оболочкой красновато-коричневого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат Моксонидин-ЛФ показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет при артериальной гипертензии.

4.2. Режим дозирования и способ применения**Режим дозирования**

Взрослые (включая пожилых пациентов)

Обычная начальная доза моксонидина составляет 0,2 мг в сутки в один прием, предпочтительнее в утренние часы. При недостаточности терапевтического эффекта дозу можно увеличить после 3 недель терапии до 0,4 мг в сутки за 2 приема или однократно. Максимальная разовая доза составляет 0,4 мг. Максимальная суточная доза, которую следует разделить на 2 приема, составляет 0,6 мг.

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов, находящихся на гемодиализе, 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.

Пациентам с почечной недостаточностью рекомендуется осторожный подбор дозы, особенно в начале лечения. Начальная доза моксонидина должна составлять 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 умеренной почечной недостаточностью (КК более 30 мл/мин, но

менее 60 мл/мин) и до 0,3 мг в сутки у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин).

Для обеспечения дозировки моксонидина 0,3 мг возможно применение препаратов других производителей в соответствующей дозировке.

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 жидкости.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к моксонидину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- 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 глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- детский возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Необходимо соблюдать осторожность при применении моксонидина у пациентов с атриовентрикулярной блокадой I степени (риск развития брадикардии), заболеваниях коронарных артерий (в т.ч. ишемической болезни сердца, нестабильной стенокардии, раннем постинфарктном периоде), заболеваниях периферического кровообращения (в т.ч. перемежающейся хромоте, синдроме Рейно), эпилепсии, болезни Паркинсона, депрессии, глаукоме, умеренной почечной недостаточности (КК 30-60 мл/мин, креатинин сыворотки 105-160 мкмоль/л), беременности.

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 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 одновременно принимаемых бета-адреноблокаторов и препарата Моксонидин-ЛФ сначала отменяют бета-адреноблокаторы и лишь через несколько дней Моксонидин-ЛФ. В настоящее время нет подтверждений того, что прекращение приема препарата приводит к повышению АД. Однако не рекомендуется прекращать прием препарата резко, вместо этого следует постепенно уменьшать дозу препарата в течение двух недель.

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

Вспомогательные вещества

Лекарственный препарат 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

Совместное применение моксонидина с другими антигипертензивными препаратами приводит к аддитивному эффекту.

Трициклические антидепрессанты могут снижать эффективность антигипертензивных препаратов 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 препаратов. Моксонидин способен умеренно улучшать ослабленные когнитивные функции у пациентов, получающих лоразепам.

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

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

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Клинические данные о применении моксонидина у беременных отсутствуют. В ходе исследований на животных было установлено эмбриотоксическое действие препарата. Моксонидин следует назначать беременным, только после тщательной оценки соотношения риска и пользы, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Лактация

Моксонидин проникает в грудное молоко и поэтому не должен назначаться во время кормления грудью. При необходимости применения моксонидина в период грудного вскармливания, кормление грудью необходимо прекратить.

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

Влияние моксонидина на способность управлять транспортными средствами и другими сложными механизмами не изучалось. Имеются сообщения о возникновении сонливости и головокружения во время приема препарата. Это необходимо учитывать при управлении транспортными средствами и выполнении других потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Наиболее частые нежелательные реакции у пациентов, принимающих моксонидин: сухость во рту, головокружение, астения и сонливость. Выраженность этих симптомов уменьшается по прошествии первых недель терапии.

Резюме нежелательных реакций

По данным Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ) нежелательные реакции классифицированы в соответствии с частотой их развития следующим образом: очень часто ($>1/10$); часто ($>1/100$, $<1/10$); нечасто ($>1/1000$, $<1/100$); редко ($>1/10000$, $<1/1000$); очень редко ($<1/10000$), частота неизвестна (не может быть определена на основании имеющихся данных).

Нарушения со стороны нервной системы:

часто – головная боль*, головокружение (вертиго), сонливость;

нечасто – обморок*.

Нарушения со стороны сердца:

нечасто – брадикардия.

Нарушения со стороны сосудов:

нечасто – выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия*.

Желудочно-кишечные нарушения:

очень часто – сухость во рту;

часто – диарея, тошнота, рвота, диспепсия.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

часто – кожная сыпь, зуд;

нечасто – ангионевротический отек.

Психические нарушения:

часто – бессонница;

нечасто – повышенная возбудимость.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта:

нечасто – звон в ушах.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани:

часто – боль в спине;

нечасто – боль в области шеи.

Общие нарушения и реакции в месте введения:

часто – астения;

нечасто – периферические отеки.

(* – частота сопоставима с плацебо).

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 подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, Москва, Славянская площадь, д.4, стр.1.

Тел.: +7 800 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <https://www.roszdravnadzor.gov.ru>

Республика Беларусь

УП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении»

220037, Минск, Товарищеский пер., 2а

Телефон: +375 (17) 242-00-29

Факс: +375 (17) 242-00-29

Электронная почта: rcpl@rceth.by

Сайт: <https://www.rceth.by>

Республика Казахстан

г. Астана, район Байконур, ул. А. Иманова, 13 (БЦ «Нурсаулет 2»)

РГП на ПХВ «Национальный Центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий» Комитет медицинского и фармацевтического контроля Министерства здравоохранения Республики Казахстан

Телефон: +7 (7172) 225-135

Электронная почта: farm@dari.kz

Сайт: <http://www.ndda.kz>

4.9. 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 эпигастриальной 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: антигипертензивные средства; антиадренергические средства центрального действия; агонисты имидазолиновых рецепторов.

Код АТХ: C02AC05.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Моксонидин является антигипертензивным 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 антигипертензивных препаратов 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. Гипотензивный эффект моксонидина подтвержден в двойных слепых плацебо-контролируемых рандомизированных исследованиях.

Результаты клинического исследования с участием 42 пациентов в артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка (ГЛЖ) продемонстрировали, что при сходном снижении артериального давления, применение комбинации антагонистов рецепторов к ангиотензину II с моксонидином позволяет в большей степени уменьшить

ГЛЖ по сравнению со свободной комбинацией тиазидного диуретика и блокатора кальциевых каналов (15 % против 11 %; $p < 0,05$).

Моксонидин улучшает на 21% индекс чувствительности к инсулину (в сравнении с плацебо) у пациентов с ожирением, инсулинрезистентностью и умеренной артериальной гипертензией.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

После приема внутрь моксонидин быстро и почти полностью абсорбируется в верхних отделах желудочно-кишечного тракта. Абсолютная биодоступность составляет приблизительно 88%, что указывает на отсутствие значительного эффекта «первого» прохождения.

Время достижения максимальной концентрации – около 1 часа. Прием пищи не оказывает влияния на фармакокинетику препарата.

Распределение

Связь с белками плазмы крови составляет 7,2%.

Биотрансформация

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

Элиминация

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 неизменном виде и 13 % – в виде дегидриромоксонидина, другие метаболиты в моче не превышают 8 % от принятой дозы). Менее 1 % дозы выводится через кишечник.

Особые группы пациентов

Пациенты с артериальной гипертензией

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

Пациенты пожилого возраста (старше 65 лет)

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

Дети

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

Пациенты с почечной недостаточностью

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 лиц 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. У пациентов с умеренной почечной недостаточностью максимальная концентрация моксонидина в плазме крови выше в 1,5-2 раза. У пациентов с нарушениями почек дозировка должна подбираться индивидуально. Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Моксонидин-ЛФ, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой:

Ядро таблетки

кросповидон (тип В),

магния стеарат,

лактозы моногидрат;

Оболочка таблетки

пленочная оболочка розовая, состоящая из: поливиниловый спирт частично гидролизированный, титана диоксид E171, макрогол 4000, тальк, краситель железа оксид красный E172, краситель железа оксид желтый E172.

Моксонидин-ЛФ, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой:

Ядро таблетки

кросповидон (тип В),

магния стеарат,

лактозы моногидрат;

Оболочка таблетки

пленочная оболочка красная, состоящая из: поливиниловый спирт частично гидролизированный, титана диоксид E171, макрогол 4000, тальк, краситель железа оксид красный E172, краситель железа оксид желтый E172, краситель железа оксид черный E172.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в оригинальной упаковке (блистер в картонной пачке) для защиты от света при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10 или 15 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По две, три или шесть контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток; по две или четыре контурные ячейковые упаковки по 15 таблеток вместе с листком-вкладышем в пачке из картона.

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

Нет особых требований к утилизации.

Остатки лекарственного препарата и отходы следует уничтожить в установленном порядке.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Республика Беларусь

СООО «Лекфарм»

223141, г. Логойск, ул. Минская, д. 2А, к. 301.

Тел./факс: (01774)-53801.

Электронная почта: office@lekpharm.by.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Автономная некоммерческая организация «Национальный научный центр
Фармаконадзора»

143026, г. Москва, Большой бульвар, д. 42, строение 1.

Тел.: 8 800 777-86-04 (круглосуточно).

Электронная почта: adversereaction@drugsafety.ru.

Республика Беларусь

СООО «Лекфарм», Республика Беларусь, 223141, г. Логойск, ул. Минская, д. 2А, к. 301.

Тел./факс: (01774)-53801.

Электронная почта: office@lekpharm.by, sideeff@lekpharm.by.

Республика Казахстан

Представительство СООО «Лекфарм» в Республике Казахстан,

050000, г. Алматы, Бостандыкский район, проспект Аль-Фараби 7,

БЦ "Нұрлы Тау", корпус 4а, офис 55

Тел. 8(727)-3110454, тел. 24/7: +77013285139

Факс 8(727)-3110455

Электронная почта: baikenova@lekpharm.by

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

**9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ,
ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Моксонидин-ЛФ доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет»: <http://eec.eaeunion.org/>.