

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

МОКСОНИДИН, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

МОКСОНИДИН, 0,3 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

МОКСОНИДИН, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: моксонидин

МОКСОНИДИН, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 0,2 мг моксонидина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат – 90,8 мг (см. раздел 4.3).

МОКСОНИДИН, 0,3 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 0,3 мг моксонидина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат – 90,7 мг (см. раздел 4.3).

МОКСОНИДИН, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка содержит 0,4 мг моксонидина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат – 181,6 мг (см. раздел 4.3).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

МОКСОНИДИН, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые, двояковыпуклые, без риски, покрытые пленочной оболочкой белого цвета. На поперечном разрезе таблетка белого или почти белого цвета.

МОКСОНИДИН, 0,3 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые, двояковыпуклые, без риски, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета. На поперечном разрезе видны два слоя, внутренний слой белого или почти белого цвета.

МОКСОНИДИН, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые, двояковыпуклые, без риски, покрытые пленочной оболочкой белого цвета. На поперечном разрезе таблетка белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1 Показания к применению

Препарат МОКСОНИДИН показан к применению у взрослых.

Артериальная гипертензия.

4.2 Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

В большинстве случаев начальная доза препарата МОКСОНИДИН 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.

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции печени

Коррекция дозы для пациентов с печеночной недостаточностью не требуется.

Пациенты, находящиеся на гемодиализе

Начальная доза для пациентов, находящихся на гемодиализе, составляет 0,2 мг в сутки. В случае необходимости и при хорошей непереносимости суточная доза может быть увеличена до максимальной 0,4 мг в сутки.

Пациенты с нарушением функции почек

Пациентам с почечной недостаточностью рекомендуется осторожный подбор дозы, особенно в начале лечения. Начальная доза должна составлять 0,2 мг в сутки. В случае необходимости или хорошей переносимости суточная доза препарата может быть увеличена максимум до 0,4 мг для пациентов с умеренной почечной недостаточностью (клиренс креатинина (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).

Дети

Безопасность и эффективность применения моксонидина у детей в возрасте до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Внутри, независимо от приема пищи.

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) в покое менее 50 уд/мин);
- атриовентрикулярная блокада II или III степени;
- острая и хроническая сердечная недостаточность (III и IV функциональный класс по классификации NYHA);
- период грудного вскармливания;
- наследственная непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности).

4.4 Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Во время лечения необходим регулярный контроль артериального давления (АД).

В постмаркетинговом наблюдении зафиксированы случаи атриовентрикулярной блокады различной степени тяжести у пациентов, принимающих моксонидин. Связь между приемом препарата МОКСОНИДИН 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 сначала отменяют бета-адреноблокаторы и лишь через несколько дней МОКСОНИДИН.

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

Однако не рекомендуется прекращать прием препарата МОКСОНИДИН 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 МОКСОНИДИН следует начинать с минимальной дозы.

Вспомогательные вещества

Препарат МОКСОНИДИН содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редко встречающимися наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, непереносимость лактозы вследствие дефицита

лактазы или синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции, не следует принимать данный лекарственный препарат.

4.5 Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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.

4.6 Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Клинические данные о применении лекарственного препарата МОКСОНИДИН у беременных отсутствуют. В ходе исследований на животных было установлено эмбрио-токсическое 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 лекарственного препарата МОКСОНИДИН в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с 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.

4.8 Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

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

Резюме нежелательных реакций

У пациентов, принимавших участие в плацебо-контролируемых клинических исследованиях моксонидина, отмечены следующие побочные эффекты. Частота возникновения побочных эффектов, приведенных ниже, определялась соответственно следующему: очень часто ($>1/10$), часто ($>1/100$, $<1/10$), нечасто ($>1/1\ 000$, $<1/100$), включая отдельные сообщения.

Нарушения со стороны нервной системы:

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

нечасто: обморок*, повышенная возбудимость.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта:

нечасто: звон в ушах.

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.

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

Российская Федерация

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, дом 4, строение 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +7 (495) 698-45-38, +7 (499) 578-02-30

Факс: +7 (495) 698-15-73

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.ru

Сайт: <http://www.roszdravnadzor.ru>

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 эпигастральной области, угнетение дыхания и нарушение сознания.

Кроме того, возможно 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, фармакодинамические эффекты

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.

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. Гипотензивный эффект моксонидина подтвержден в двойных слепых плацебо-контролируемых рандомизированных исследованиях.

Результаты клинического исследования с участием 42 пациентов с 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, инсулинорезистентностью и умеренной степенью артериальной гипертензии.

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

Особые группы пациентов

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

Фармакокинетика у пациентов с почечной недостаточностью

Выведение моксонидина в значительной степени коррелирует с клиренсом креатинина. 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 функции почек дозировка должна подбираться индивидуально. Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1 Перечень вспомогательных веществ

МОКСОНИДИН, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Лактозы моногидрат

Целлюлоза микрокристаллическая (тип 102)

Повидон-K25

Кросповидон

Магния стеарат

Состав оболочки:

Гипромеллоза

Титана диоксид (E171)

Макрогол 400

Диметикон 100

МОКСОНИДИН, 0,3 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Лактозы моногидрат

Целлюлоза микрокристаллическая (тип 102)

Повидон-K25

Кросповидон

Магния стеарат

Состав оболочки:

Гипромеллоза

Титана диоксид (E171)

Макрогол 400

Диметикон 100

Краситель железа оксид желтый (E172)

МОКСОНИДИН, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Лактозы моногидрат

Целлюлоза микрокристаллическая (тип 102)

Повидон-K25

Кросповидон

Магния стеарат

Состав оболочки:

Гипромеллоза

Титана диоксид (E171)

Макрогол 400

Диметикон 100

6.2 Несовместимость

Не применимо.

6.3 Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4 Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5 Характер и содержание первичной упаковки

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация,

ОБЩЕСТВО С ОГРАНИЧЕННОЙ ОТВЕТСТВЕННОСТЬЮ
«ПРАНАФАРМ» (ООО «ПРАНАФАРМ»)

443068, г. Самара, ул. Ново-Садовая, дом 106, корпус 81

тел. (846) 334-52-32, 207-12-61

факс (846) 335-15-61, 207-41-62

e-mail: info@pranapharm.ru

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направляют по адресу:

Российская Федерация,

ОБЩЕСТВО С ОГРАНИЧЕННОЙ ОТВЕТСТВЕННОСТЬЮ
«ПРАНАФАРМ» (ООО «ПРАНАФАРМ»)
443068, г. Самара, ул. Ново-Садовая, дом 106, корпус 81
тел. (846) 334-52-32, 207-12-61
факс (846) 335-15-61, 207-41-62
e-mail: info@pranapharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЕ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИЯ)

Дата первичной регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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