

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

Моксонидин-Акрихин, 0,2 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Моксонидин-Акрихин, 0,4 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: моксонидин.

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

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 0,2 мг моксонидина.

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. раздел 4.4).

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

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 0,4 мг моксонидина.

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

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

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от светло-розового до розового цвета. На поперечном разрезе ядро от белого до белого с сероватым или желтоватым оттенком цвета.

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

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от розового до розового с коричневатым оттенком цвета. На поперечном разрезе ядро от белого до белого с сероватым или желтоватым оттенком цвета.

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

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

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

В большинстве случаев начальная доза препарата Моксонидин-Акрихин 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 (для проведения данного режима дозирования необходимо применять моксонидин в таблетках по 0,3 мг других производителей). Необходима индивидуальная коррекция суточной дозы в зависимости от переносимости пациентом проводимой терапии.

Особые группы пациентов

Пациенты с печеночной недостаточностью

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 переносимости суточная доза может быть увеличена до максимальной 0,4 мг в сутки.

Пациенты с почечной недостаточностью

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) (для проведения данного режима дозирования необходимо применять моксонидин в таблетках по 0,3 мг других производителей).

Дети

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

Способ применения

Внутрь, 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] покоя менее 50 уд/мин).

Атриовентрикулярная блокада II или III степени.

Острая сердечная недостаточность и хроническая сердечная недостаточность (III и IV функциональный класс по классификации Нью-Йоркской кардиологической ассоциации [NYHA]).

Период лактации (см. раздел 4.6).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Следует с осторожностью применять моксонидин при:

- атриовентрикулярной блокаде I степени (риск развития брадикардии);

- заболеваниях коронарных артерий (в том числе [т. ч.] ишемическая болезнь сердца, нестабильная стенокардия, ранний постинфарктный период);
- заболеваниях периферического кровообращения (в т. ч. перемежающаяся хромота, синдром Рейно);
- эпилепсии;
- болезни Паркинсона;
- депрессии;
- глаукоме;
- умеренной почечной недостаточности (КК 30–60 мл/мин, креатинин сыворотки 105–160 мкмоль/л);
- печеночной недостаточности;
- беременности.

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 моксонидина 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 моксонидина сначала отменяют бета-адреноблокаторы и лишь через несколько дней моксонидин.

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

Однако не рекомендуется прекращать прием моксонидина резко, вместо этого следует постепенно уменьшать дозу препарата в течение двух недель.

Лица пожилого возраста

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

Вспомогательные вещества

Препарат Моксонидин-Акрихин содержит лактозу. Данный лекарственный препарат не следует принимать пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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

Бета-адреноблокаторы усиливают брадикардию, выраженность отрицательного ино- и дромотропного действия.

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.

Исследования дигоксина и гидрохлоротиазида не выявили доказательств взаимодействия. Пероральная биодоступность глибенкламида снижалась на 11 % при применении с моксонидином.

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 в период лактации. При необходимости применения моксонидина в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

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

Исследования влияния моксонидина на способность управлять транспортными средствами 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 нежелательные реакции у пациентов, принимающих моксонидин: головная боль*, головокружение, сонливость, бессонница, сухость во рту, диарея, тошнота, рвота, диспепсия, кожная сыпь, зуд, боль в спине, астения. Эти симптомы часто уменьшаются по прошествии первых недель терапии.

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции сгруппированы по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\,000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\,000$, но $< 1/1\,000$), очень редко ($< 1/10\,000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

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*.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

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, костной 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

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 (800) 550-99-03

Адрес электронной почты: pharm@roszdravnadzor.gov.ru или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <https://roszdravnadzor.gov.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, 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, 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 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. 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

Почечная недостаточность

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

Лица пожилого возраста

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

Другие особые группы

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

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат

Повидон (тип К90)

Кросповидон

Магния стеарат

пленочная оболочка: этилцеллюлоза в виде водной 30 % дисперсии, готовая пленочная оболочка розового цвета [гипромеллоза, титана диоксид, тальк, макрогол 6000, железа оксид красный].

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке (контурная ячейковая упаковка в пачке).

6.5. Характер и содержание упаковки

По 10 или 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из фольги алюминиевой и пленки поливинилхлоридной.

1, 2, 3, 5, 6 или 9 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток или 1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки по 30 таблеток вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия,

Акционерное общество «Химико-фармацевтический комбинат «АКРИХИН»
(АО «АКРИХИН»),

142450, Московская область, г.о. Богородский, г. Старая Купавна, ул. Кирова, д. 29

Телефон/факс: +7 (495) 702-95-03

Адрес электронной почты: info@akrikhin.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия,

Акционерное общество «Химико-фармацевтический комбинат «АКРИХИН»
(АО «АКРИХИН»)

142450, Московская область, г.о. Богородский, г. Старая Купавна, ул. Кирова, д. 29

Телефон/факс: +7 (495) 702-95-03

Адрес электронной почты: info@akrikhin.ru

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Моксонидин-Акрихин доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации)
https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC.