

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

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

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

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

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: моксонидин

Моксарел, 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 – 64 мг (см. раздел 4.4).

Моксарел, 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 – 64 мг (см. раздел 4.4).

Моксарел, 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 – 64 мг (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

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

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

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

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета. На поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

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

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета. На поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Лекарственный препарат Моксарел показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет при артериальной гипертензии.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

В большинстве случаев начальная доза препарата Моксарел 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, находящиеся на гемодиализе

Начальная доза для пациентов, находящихся на гемодиализе, составляет 0,2 мг/сутки. В случае необходимости и при хорошей переносимости 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 и при 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).

Пациенты с нарушением функции печени

Коррекция дозы для пациентов с печеночной недостаточностью не требуется.

Дети

Безопасность и эффективность у детей в возрасте от 0 до 18 лет на данный момент 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;
- атриовентрикулярная блокада II и III степени;
- выраженная брадикардия (частота сердечных сокращений (ЧСС) покоя менее 50 уд/мин);
- острая и хроническая сердечная недостаточность (III-IV функциональный класс по классификации NYHA);
- период грудного вскармливания.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Следует с осторожностью применять препарат Моксарел при:

- атриовентрикулярной блокаде I степени (риск развития брадикардии);
- заболеваниях коронарных артерий (в 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 АД.

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

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

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

Вспомогательные вещества

Лекарственный препарат Моксарел содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на одну таблетку, то есть по сути не содержит натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Транквилизаторы

Необходимо избегать совместного назначения с препаратом Моксарел, так как он может усиливать седативный эффект.

Седативные и снотворные средства

Необходимо избегать совместного назначения с препаратом Моксарел, так как он может усиливать седативный эффект.

Трициклические антидепрессанты

Необходимо избегать совместного назначения с препаратом Моксарел, так как он может усиливать седативный эффект.

Не рекомендуется применять трициклические антидепрессанты во время лечения препаратом Моксарел, так как они могут снижать эффективность гипотензивных средств центрального действия.

Лоразепам

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

Производные бензодиазепина

Назначение препарата Моксарел совместно с производными бензодиазепина может сопровождаться усилением седативного эффекта последних.

Гипотензивные средства

Совместное применение препарата Моксарел с другими гипотензивными средствами приводит к аддитивному эффекту.

Взаимодействие с алкоголем

Во время лечения препаратом Моксарел следует исключить употребление алкоголя.

Препарат Моксарел 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 лечении беременных препаратом Моксарел отсутствуют.

В ходе исследования на животных было установлено эмбриотоксическое действие препарата при дозировках выше терапевтических. Потенциальный риск для человека неизвестен.

Назначать Моксарел беременным следует с осторожностью только после тщательной оценки врачом соотношения риска и пользы, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Лактация

Применение препарата Моксарел противопоказано в период грудного вскармливания.

Моксонидин проникает в грудное молоко и поэтому не должен назначаться в период грудного вскармливания. При необходимости применения лекарственного препарата грудное вскармливание необходимо прекратить.

Фертильность

Данные о влиянии препарата Моксарел на фертильность не установлены.

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

Моксарел может вызывать головокружение и сонливость. Влияние препарата Моксарел на способность к управлению транспортными средствами и механизмами изучено не было.

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.

Классификация частоты развития НР согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ):

очень часто $\geq 1/10$;

часто от $\geq 1/100$ но $< 1/10$;

нечасто от $\geq 1/1000$ но $< 1/100$;

редко от $\geq 1/10000$ но $< 1/1000$;

очень редко $< 1/10000$, включая отдельные сообщения;

частота неизвестна – по имеющимся данным установить частоту возникновения не представляется возможным.

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 – тошнота, диарея, рвота, диспепсия.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

часто – кожная сыпь, кожный 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.

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

Телефон: 8 (800) 550 99 03

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<http://roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

Головная боль, седативный эффект, сонливость, выраженное снижение АД, головокружение, усталость, астения, брадикардия, сухость во рту, рвота и боль в эпигастральной области, угнетение дыхания, нарушение сознания. Кроме того, возможны кратковременное повышение АД, тахикардия, гипергликемия, как было показано в нескольких исследованиях по изучению высоких доз препарата на животных.

Лечение

Специфического антидота не существует. В случае выраженного снижения АД рекомендуется введение жидкости для восстановления объема циркулирующей крови и допамина (инъекционно). Брадикардия может быть купирована атропином (инъекционное введение). Антагонисты альфа-адренорецепторов могут уменьшать или устранять парадоксальные гипертензивные эффекты при передозировке моксонидином.

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

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 гипотензивным средством, действие которого связано с влиянием на центральные механизмы регуляции активности симпатической нервной системы и артериального давления. В стволовых структурах головного 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 при его применении.

Прием моксонидина сопровождается снижением 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 ангиотензина II с моксонидином позволяет в большей степени уменьшить ГЛЖ по сравнению со свободной комбинацией тиазидного диуретика и блокатора кальциевых каналов (15 % против 11 %; $p < 0,5$).

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 влияние на фармакокинетику препарата.

Распределение

Связь с белками плазмы крови составляет 7,2 %.

Биотрансформация

Основной метаболит – дегидрированное производное моксонидина. Фармакодинамическая активность основного метаболита – около 10 % активности моксонидина.

Элиминация

Период полувыведения ($T_{1/2}$) моксонидина и дегидрированного 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, уровень других метаболитов 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.

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.

Почечная недостаточность

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. У пациентов с умеренной почечной недостаточностью максимальная концентрация моксонидина в плазме крови выше в 1,5-2 раза. У пациентов с нарушением функции почек дозировка должна подбираться индивидуально.

Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

Дети

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

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Моксарел 0,2 мг:

Лактозы моногидрат

Целлюлоза микрокристаллическая 101

Целлюлоза микрокристаллическая 102

Повидон К-30

Кроскармеллоза натрия

Кремния диоксид коллоидный

Магния стеарат

Пленочная оболочка:

Гипромеллоза

Тальк

Титана диоксид

Макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000)

или

Сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу, тальк, титана диоксид, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000)

Моксарел 0,3 мг:

Лактозы моногидрат

Целлюлоза микрокристаллическая 101

Целлюлоза микрокристаллическая 102

Повидон К-30

Кроскармеллоза натрия

Кремния диоксид коллоидный

Магния стеарат

Пленочная оболочка:

Гипромеллоза

Тальк

Титана диоксид

Макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000)

Краситель железа оксид красный

или

Сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу, титана диоксид, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000), краситель железа оксид красный

Моксарел 0,4 мг:

Лактозы моногидрат

Целлюлоза микрокристаллическая 101

Целлюлоза микрокристаллическая 102

Повидон К-30

Кроскармеллоза натрия

Кремния диоксид коллоидный

Магния стеарат

Пленочная оболочка:

Гипромеллоза

Тальк

Титана диоксид

Макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000)

Краситель железа оксид желтый

или

Сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу, тальк, титана диоксид, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000), краситель железа оксид желтый

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.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10, 14, 15 или 30 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки по 10 таблеток, 1, 2 или 4 контурные ячейковые упаковки по 14 таблеток, 1, 2 или 4 контурные ячейковые упаковки по

15 таблеток, 1 или 2 контурные ячейковые упаковки по 30 таблеток вместе с
листом-вкладышем в пачке из картона.

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

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия, АО «ВЕРТЕКС»

Адрес: 197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А

Адрес электронной почты: vertex@vertex.spb.ru

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия, АО «ВЕРТЕКС»

197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д.62, лит. А

Адрес электронной почты: vertex@vertex.spb.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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