

УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета фармации
Министерства здравоохранения
Республики Казахстан
от « ____ » _____ 201_ г.
№ _____

**Инструкция по медицинскому применению
лекарственного средства**

Моксонидин-Тева

Торговое название

Моксонидин-Тева

Международное непатентованное название

Моксонидин

Лекарственная форма

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

Состав

Одна таблетка содержит

активное вещество – моксонидин 0,2 мг или 0,4 мг,

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, кросповидон, повидон, магния стеарат,

состав пленочной оболочки Dyestuff Opadry Y-1-7000 white*: железа(III) оксид красный (E172)

*гипромеллоза, титана диоксид (E171), полиэтиленгликоль

Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-розового цвета, круглой формы, с двояковыпуклой поверхностью, диаметром (6.0 ± 0.2) мм (для дозировки 0,2 мг).

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой темно-розового цвета, круглой формы, с двояковыпуклой поверхностью, диаметром (6.0 ± 0.2) мм (для дозировки 0,4 мг).

Фармакотерапевтическая группа

Гипотензивные препараты. Адреностимуляторы центральные. Альфа 2-адреномиметики центральные, производные имидазолина. Моксонидин.

Код АТХ C02AC05

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

При приеме внутрь моксонидин быстро и почти полностью ($T_{\text{макс}}$ около 1 часа) всасывается из верхних отделов желудочно-кишечного тракта. Абсолютная биодоступность - 88%, что указывает на отсутствие первичного печеночного метаболизма. Прием пищи не оказывает влияния на фармакокинетику моксонидина. Связь с белками плазмы крови составляет 7,2%. В крови выявляется только один метаболит моксонидина – дегидромоксонидин. Его фармакологическая активность в 10 раз меньше, чем моксонидина. В течение 24 часов более 78% моксонидина выводится почками и 13% в виде дегидромоксонидина. Другие, менее значимые метаболиты, обнаруживаются в моче в количестве около 8% от введенной дозы. Менее 1% дозы выводится с калом в виде метаболитов. Период полувыведения моксонидина и его основного метаболита составляет 2,5 и 5 часов соответственно.

Фармакокинетика у пациентов с артериальной гипертензией

У пациентов с артериальной гипертензией не выявлено изменений фармакокинетики.

Фармакокинетика у пожилых

У пожилых пациентов наблюдаются отличия в фармакокинетику моксонидина по сравнению с лицами более молодого возраста, в основном, обусловленные пониженной метаболической активностью и/или повышением биодоступности у пожилых. Однако эти различия фармакокинетики не имеют клинической значимости.

Фармакокинетика у детей и подростков до 18 лет

Исследования фармакокинетики у детей и подростков не проводились.

Фармакокинетика при почечной недостаточности

Выведение моксонидина в значительной степени коррелирует с клиренсом креатинина (КК). У больных с почечной недостаточностью средней степени тяжести (скорость клубочковой фильтрации (СКФ) 30-60 мл/мин) равновесные концентрации в плазме крови и конечный период полувыведения, соответственно, в 2 и 1,5 раза выше, чем у больных гипертензией с нормальной функцией почек (СКФ >90 мл/мин). Более того, максимальные концентрации моксонидина в плазме крови в 1,5-2 раза выше у пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести. У больных с тяжелой почечной недостаточностью (СКФ < 30 мл/мин) равновесные концентрации в плазме крови и конечный период полувыведения приблизительно в 3 раза выше, чем у больных артериальной гипертензией с нормальной функцией почек. Прием многократных доз не приводит к кумуляции моксонидина в организме больных данной группы. У больных в терминальной стадии почечной недостаточности (СКФ < 10 мл/мин) на диализе, площадь под кривой (AUC) и терминальный период полувыведения в 6 и 4 раза, соответственно, выше, чем у больных с нормальной функцией почек. Следовательно, дозу моксонидина у больных с почечной недостаточностью необходимо подбирать в соответствии с индивидуальными потребностями.

Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

Фармакодинамика

Моксонидин-Тева является антигипертензивным препаратом. Доступные экспериментальные данные показывают, что локализацией действия моксонидина является центральная нервная система (ЦНС). Было показано, что моксонидин селективно стимулирует имидазолиновые рецепторы в стволе головного мозга. Имидазолин-чувствительные рецепторы сконцентрированы в ростральном отделе вентролатеральной части продолговатого мозга - участке, который считается центром регуляции периферической симпатической нервной системы. При стимуляции имидазолиновых рецепторов снижается активность симпатической нервной системы и понижается кровяное давление.

Моксонидин отличается от других симпатолитических антигипертензивных средств низким сродством к α_2 -адренорецепторам в сравнении с имидазолиновыми рецепторами. Этим может объясняться низкая вероятность седативного эффекта и сухости во рту при приеме моксонидина.

Моксонидин снижает артериальное давление в результате уменьшения системного сосудистого сопротивления, что доказано клиническими исследованиями.

Моксонидин улучшает чувствительность тканей к инсулину на 21% по сравнению с плацебо у больных с ожирением и резистентностью к инсулину с умеренной артериальной гипертензией.

Показания к применению

- эссенциальная (первичная) гипертензия

Способ применения и дозы

Таблетки принимают внутрь, запивая достаточным количеством воды, независимо от приема пищи.

В большинстве случаев начальная доза Моксонидин-Тева составляет 0,2 мг в сутки; максимальная суточная доза, которую следует разделить на 2 приема, составляет 0,6 мг. Максимальная однократная доза составляет 0,4 мг. Дозу и курс лечения подбирают индивидуально, в зависимости от клинического ответа.

У пациентов с умеренной или тяжелой почечной недостаточностью начальная доза моксонидина составляет 0,2 мг в сутки. При необходимости и хорошей переносимости у пациентов с умеренной почечной недостаточностью доза моксонидина может быть увеличена до 0,4 мг в сутки.

Применение моксонидина у детей и подростков младше 18 лет не рекомендуется в связи с отсутствием данных о безопасности и эффективности.

Побочные действия

Наиболее частые побочные эффекты, о которых сообщалось при приеме моксонидина, включают сухость во рту, головокружение, астению и сонливость. Эти симптомы часто уменьшаются после первых нескольких недель лечения. Нежелательные эффекты (наблюдаемые во время плацебо-контролируемых клинических исследований с n=886 пациентов, принимавших моксонидин) отражены в частотах ниже:

Очень часто ($\geq 1/10$)

- сухость во рту

Часто ($\geq 1/100, < 1/10$)

- головокружение/вертиго, головная боль*, сонливость, бессонница, астения
- диарея, тошнота, рвота, диспепсия
- сыпь, зуд
- боль в спине

Нечасто ($\geq 1/1000, < 1/100$)

- брадикардия, гипотензия* (включая ортостатическую)
- ангионевротический отек, периферические отёки
- боль в области шеи
- звон в ушах
- нервозность, обморок*

* частота была сопоставима с плацебо

Противопоказания

- повышенная чувствительность к компонентам препарата
- синдром слабости синусового узла
- брадикардия (частота сердечных сокращений в покое менее 50 в минуту)
- атриовентрикулярная блокада II или III степени
- сердечная недостаточность
- тяжелая почечная недостаточность (СКФ < 30 мл/мин, концентрация креатинина в сыворотке крови > 160 мкмоль/л)
- детский и подростковый возраст до 18 лет
- беременность и период лактации
- наследственная непереносимость фруктозы, дефицит фермента Lарр-лактазы, мальабсорбция глюкозы-галактозы

Лекарственные взаимодействия

При совместном применении препарата Моксонидин-Тева с другими гипотензивными средствами происходит взаимное усиление действия.

Так как трициклические антидепрессанты могут снизить эффективность антигипертензивных средств центрального действия, не рекомендуется одновременный прием Моксонидин-Тева с препаратами данной группы.

Моксонидин-Тева может усиливать седативное действие трициклических антидепрессантов (следует избегать их совместного назначения), транквилизаторов, алкоголя, седативных и снотворных средств.

Моксонидин-Тева умеренно улучшает сниженную когнитивную способность у пациентов, принимающих лоразепам. Моксонидин-Тева усиливает седативный эффект бензодиазепинов при совместном приеме. Так как Моксонидин-Тева выводится посредством тубулярной экскреции, не исключается взаимодействие с препаратами, имеющими такой же путь выведения.

Особые указания

С осторожностью назначают у пациентов с возможной предрасположенностью к развитию атриовентрикулярной блокады и больным с атриовентрикулярной блокадой 1-й степени во избежание брадикардии.

Больные с тяжелой ишемической болезнью или нестабильной стенокардией нуждаются в тщательном наблюдении, так как опыт применения препарата у данной группы пациентов ограничен.

Необходимо соблюдать особую осторожность при применении моксонидина у пациентов с тяжелой ишемической болезнью сердца или нестабильной стенокардией, так как опыт применения препарата у данной категории пациентов ограничен.

Рекомендуется соблюдать меры предосторожности при назначении Моксонидин-Тева больным с почечной недостаточностью, так как моксонидин выводится почками. Эти пациенты нуждаются в тщательном подборе дозы, особенно в начале терапии. Начальная доза моксонидина должна составлять 0,2 мг в сутки и, при условии клинических показаний и хорошей переносимости, может быть увеличена максимум до 0,4 мг в сутки у пациентов с умеренной почечной недостаточностью (СКФ > 30 мл/мин, но < 60 мл/мин). Если Моксонидин-Тева принимают в комбинации с препаратом из группы бета-адреноблокаторов, то при необходимости отмены обоих препаратов сначала отменяют бета-адреноблокатор и лишь через несколько дней - Моксонидин-Тева. Не наблюдается синдрома отмены при прекращении приема препарата. Однако не следует резко прерывать лечение; рекомендуется постепенно, в течение двух недель, снижать дозу. Пациенты с врожденной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы Лаппа или нарушением всасывания глюкозы-галактозы не должны принимать Моксонидин-Тева.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от управления автотранспортом и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций из-за сонливости и головокружения.

Передозировка

Симптомы: головная боль, седативный эффект, сонливость, гипотензия, головокружение, астения, брадикардия, сухость во рту, рвота, усталость и

боль в желудке. В случаях серьезной передозировки возможно расстройство сознания и угнетение дыхания. Потенциально возможны также кратковременное повышение АД, тахикардия, гипергликемия.

Лечение: специфических антидотов не существует. При гипотензии может потребоваться введение допамина и меры по поддержанию циркуляции, включая внутривенную инфузию растворов. Для устранения брадикардии можно применять атропин. Антагонисты альфа-адренорецепторов могут уменьшать или устранять парадоксальную артериальную гипертензию.

Форма выпуска и упаковка

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

По 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках вкладывают в коробку из картона.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке, в защищенном от света месте, при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

2 года

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

"Меркле ГмбХ", Германия

Владелец регистрационного удостоверения

«ратиофарм ГмбХ», Германия

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству продукции (товара)

ТОО «ратиофарм Казахстан», 050059 (А15Е2Р), г. Алматы, пр. Аль-Фараби 17/1, БЦ Нурлы-Тау, 5Б, 6 этаж. Телефон: (727)3251615, (727)3251690

Адрес организации, на территории Республики Казахстан, ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственного средства

ТОО «ратиофарм Казахстан», 050059 (А15Е2Р), г. Алматы, пр. Аль-Фараби 17/1, БЦ Нурлы Тау, 5Б, 6 этаж. Телефон: (727)3251642, e-mail:

Safety.Kazakhstan@tevapharm.com