

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

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

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

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: моксонидин.

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

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

Вспомогательные вещества, наличие которых необходимо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат – 95,8 мг (см. разделы 4.3., 4.4.).

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

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

Вспомогательные вещества, наличие которых необходимо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат – 95,6 мг (см. раздел 4.3., 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой

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

Круглые, двояковыпуклой формы таблетки, покрытые плёночной оболочкой бледно-розового цвета. На поперечном разрезе: белого или почти белого цвета.

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

Круглые, двояковыпуклой формы таблетки, покрытые плёночной оболочкой коричневатого розового цвета. На поперечном разрезе: белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЙ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

- Артериальная гипертензия.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

В большинстве случаев доза препарата моксонидин составляет 0,2 мг в сутки (возможно применение препарата моксонидин в таблетках по 0,2 мг). 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.

Коррекция дозы для пациентов с печеночной недостаточностью не требуется. Начальная доза для пациентов, находящихся на гемодиализе, составляет 0,2 мг в сутки. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза для данной категории пациентов может быть увеличена до максимальной суточной дозы 0,4 мг.

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 (КК более 30 мл/мин, но менее 60 мл/мин).

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;
- выраженная брадикардия (частота сердечных сокращений (ЧСС) покоя менее 50 уд. в 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));
- тяжелая печеночная недостаточность;
- период грудного вскармливания (см. раздел 4.6).

4.4.Особые указания и меры предосторожности при применении

Во время лечения препаратом моксонидин необходим регулярный контроль 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 моксонидина 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.

С осторожностью

Атриовентрикулярная блокада I степени (риск развития брадикардии), заболевания коронарных артерий (в т. ч. ишемическая болезнь сердца, нестабильная стенокардия, ранний постинфарктный период), заболевания периферического кровообращения (в т. ч. перемежающаяся хромота, синдром Рейно), эпилепсия, болезнь Паркинсона, депрессия, глаукома; умеренная почечная недостаточность (КК 30–60 мл/мин, креатинин сыворотки 105–160 мкмоль/л), печеночная недостаточность; беременность.

Вспомогательные вещества

Таблетки препарата моксонидин содержат лактозы моногидрат. Пациенты с редкой наследственной непереносимостью лактозы, дефицитом лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не должны принимать этот 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.

Исследования дигоксина и гидрохлортиазида 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.

Период грудного вскармливания

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

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 нежелательных реакций

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

По данным ВОЗ нежелательные (побочные) эффекты классифицированы в соответствии с их частотой развития следующим образом: очень часто ($>1/10$), часто (от $>1/100$ до $<1/10$), нечасто (от $>1/1000$ до $<1/100$), редко (от $>1/10\ 000$ до $<1/1000$), очень редко ($<1/10\ 000$); частота неизвестна – по имеющимся данным установить частоту возникновения не представлялось 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 – диарея, тошнота, рвота, диспепсия.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки:

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 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

109074, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1.

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефоны: +7 (499) 578-06-70, +7 (499) 578-02-20, +7 800 550 99 03

E-mail: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

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

4.9.Передозировка

Имеются сообщения о нескольких случаях передозировки без летального исхода, когда одновременно применялись дозы до 19,6 мг.

Симптомы

Головная боль, седативный эффект, сонливость, выраженное снижение АД, головокружение, астения, брадикардия, сухость во рту, рвота, повышенная утомляемость, 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

Фармакодинамика

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 (АД).

Моксонидин отличается от других симпатолитических гипотензивных средств более низким сродством к альфа-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 АД, 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 тяжести артериальной гипертензии.

5.2. Фармакокинетические свойства

Всасывание

После приема внутрь моксонидин быстро и почти полностью абсорбируется в верхних отделах желудочно-кишечного тракта (около 90 %). 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 %.

Метаболизм

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

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) моксонидина и его метаболита составляет 2,5 и 5 часов, соответственно. В течение 24 часов почками выводится свыше 90 % моксонидина (около 78 % – в неизменном виде, 13 % – в виде дегидрированного моксонидина, другие метаболиты в моче не превышают 8 % от принятой дозы). Менее 1 % дозы выводится через

кишечник.

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 при почечной недостаточности

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 соответственно 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

Содержимое таблетки, покрытой пленочной оболочкой

Лактозы моногидрат

Повидон К-30

Кросповидон

Магния стеарат

Оболочка таблеток, покрытых пленочной оболочкой

Гипромеллоза

Макрогол 6000

Тальк

Краситель железа оксид красный (E172)

Титана диоксид (E171)

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 или 20 таблеток в контурную ячейковую упаковку из плёнки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 5, 6 или 10 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток или 1, 2, 3, 4, 5 контурных ячейковых упаковок по 20 таблеток вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ОАО «Авексима»

125284, Россия, г. Москва, Ленинградский проспект, д. 31А, стр. 1.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ОАО «Авексима»

125284, Россия, г. Москва, Ленинградский проспект, д. 31А, стр. 1.

Тел.: +7 (495) 258-45-28.

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации.

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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