ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

МОКСОГАМА®

(MOXOGAMMA®)

Склад:

діюча речовина: moxonidinum;

1 таблетка містить моксонідину 0,2 мг або 0,3 мг, або 0,4 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, кросповідон, повідон К 25, магнію стеарат, Опадрай У-1-7000 (містить гідроксипропілметилцелюлоза, титану діоксид (Е 171), макрогол 400), заліза оксид червоний (Е 172).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: ***таблетки по 0,2 мг:*** круглі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, світло-рожевого кольору;

таблетки по 0,3 мг: круглі таблетки, вкриті **плівковою оболонкою, рожевого кольору**;

таблетки по 0,4 мг: **круглі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, темно-рожевого кольору.**

Фармакотерапевтична група. Антигіпертензивний засіб. Антиадренергічний засіб з центральним механізмом дії. Агоніст імідазолінових рецепторів.

Код АТХ. С02А С05.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Моксонідин є селективним агоністом імідазолінових рецепторів у центральній нервовій системі.

У стовбурі мозку моксонідин селективно зв’язується з імідазоліновими рецепторами. Ці чутливі до імідазоліну рецептори знаходяться переважно у ростральному відділі вентролатеральної

частини довгастого мозку, ділянці, що відіграє важливу роль у центральному контролі симпатичної нервової системи. Ефектом такої взаємодії з імідазоліновими рецепторами є зміна активності симпатичної нервової системи та зниження артеріального тиску.

Моксонідин відрізняється від симпатолітичних антигіпертензивних засобів низькою спорідненістю з центральними α-адренергічними рецепторами порівняно зі спорідненістю з імідазоліновими рецепторами. Тому седативний ефект та сухість у роті, при застосуванні моксонідину виникають рідко. Моксонідин є ефективним антигіпертинзивним засобом. Застосування моксонідину призводить до зменшення периферичного судинного опору з подальшим зменшенням артеріального тиску.

Фармакокінетика.

Моксонідин після перорального прийому швидко всмоктується. Абсорбується приблизно 90 % прийнятої дози. Пресистемний метаболізм відсутній, біодоступність становить 88 %.

Лише близько 7 % моксонідину зв’язується з білками плазми крові.

Моксонідин метаболізується на 10-20 %, переважно до 4,5-дигідромоксонідину та похідного аміометанамідину, шляхом відкривання імідазолінового канальця. Гіпотензивний ефект 4,5-дигідромоксонідину становить лише 1/10, похідного аміометанамідину – менше 1/100 ефекту моксонідину.

Моксонідин та його метаболіти майже повністю виводяться через нирки.

Понад 90 % дози виводиться упродовж перших 24 годин через нирки, приблизно

1 % виводиться з фекаліями. Сумарне виведення незміненого моксонідину становить приблизно 50-75 %.

Середній період напіввиведення моксонідину та метаболітів становить приблизно 2,5 години та 5 годин відповідно.

У пацієнтів із помірним порушенням функції нирок (швидкість клубочкової фільтрації 30-60 мл/хв), кліренс знижується до 52 %.

Фармакокінетичні дослідження у дітей не проводили.

Моксонідин проникає через гематоенцефалічний та плацентарний бар’єр, екскретується у грудне молоко.

Клінічні характеристики.

Показання. Від легкої до помірної артеріальної гіпертензії.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до будь-якого компонента препарату;
- синдром слабкості синусового вузла або синоатріальна блокада серця;

- брадикардія (менше 50 ударів за хвилину у стані спокою);
- атріовентрикулярна блокада II або III ступеня;
- серцева недостатність.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Одночасний прийом препарату з іншими антигіпертензивними засобами чинить адитивний ефект.

Оскільки трициклічні антидепресанти можуть зменшити ефективність антигіпертензивних агентів центральної дії, призначення цих препаратів разом з моксонідином не рекомендується.

Моксонідин може потенціювати ефект трициклічних антидепресантів (одночасного призначення слід уникати), транквілізаторів, алкоголю, седативних та снодійних засобів.

Моксонідин помірно підсилює порушення когнітивної функції у пацієнтів, які отримують лоразепам. Він може також посилити седативний ефект бензодіазепінів при одночасному застосуванні.

Моксонідин виводиться шляхом тубулярної екскреції. Не можна виключати взаємодії агентами, що виводяться шляхом тубулярної екскреції.

Особливості застосування.

Моксонідин пацієнтам з атріовентрикулярною блокадою I ступення слід застосовувати з особливою обережністю, щоб уникнути брадикардії.

З обережністю слід застосовувати моксонідин пацієнтам із тяжкою ішемічною хворобою серця або нестабільною стенокардією, оскільки досвід застосування препарату таким пацієнтам обмежений.

Рекомендується з обережністю застосовувати моксонідин пацієнтам із порушенням функції нирок, оскільки він виводиться переважно нирками. Таким пацієнтам рекомендується обережно титрувати дозу, особливо на початку терапії. Лікування слід розпочати з дози 0,2 мг на добу; дозу можна збільшити максимум до 0,4 мг на добу, якщо це клінічно показане і препарат переноситься добре.

Якщо моксонідин застосовувати у комбінації з β-адреноблокаторами і обидва препарати необхідно відмінити, спочатку слід відмінити β-адреноблокатор, а потім через кілька днів – моксонідин.

На даний час прояву ефектів відміни з боку артеріального тиску після припинення прийому моксонідину не відзначалося. Однак раптове переривання терапії моксонідином не рекомендується; натомість дозу слід поступово зменшувати протягом 2-х тижнів.

Пацієнтам із рідкісною спадковою непереносимістю галактози, дефіцитом лактази або з порушенням всмоктування глюкози та галактози не можна приймати цей лікарський засіб.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Відповідних даних щодо застосування моксонідину вагітним жінкам немає. Дослідження на тваринах продемонстрували токсичний вплив на плід. Можливий ризик для людей невідомий. Моксонідин не слід застосовувати у період вагітності, якщо немає явної необхідності.

Моксонідин екскретується у грудне молоко і тому його не можна застосовувати у період годування груддю. Якщо терапія моксонідином є необхідною, годування груддю слід припинити.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Дослідження щодо впливу препарату на здатність керувати автомобілем або працювати з іншими механізмами не проводили. Проте повідомлялося про сонливість та запаморочення. Цей факт слід враховувати під час виконання таких робіт.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі. Лікування слід розпочинати з найнижчої дози моксонідину – 0,2 мг на добу. Якщо терапевтичний ефект недостатній, через 3 тижні дозу можна збільшити до 0,4 мг. Цю дозу можна приймати за 1 раз (вранці) або розподілити на 2 прийоми (вранці та ввечері). Якщо протягом наступних 3-х тижнів результати незадовільні, дозу можна збільшити максимум до 0,6 мг, приймати у 2 прийоми, вранці та ввечері. Разову дозу 0,4 мг моксонідину та добову максимальну дозу 0,6 мг моксонідину не можна перевищувати. Дозу препарату слід підбирати індивідуально, залежно від реакції пацієнта.

Препарат можна приймати незалежно від вживання їжі. Таблетку слід застосовувати з достатньою кількістю рідини.

Пацієнти літнього віку. Якщо немає ниркової недостатності, дозування таке ж саме, як і для дорослих.

Ниркова недостатність. Для пацієнтів з помірним порушенням функції нирок (швидкість клубочкової фільтрації > 30 мл/хв, але < 60 мл/хв), та для хворих, які знаходяться на гемодіалізі, початкова доза не має перевищувати 0,2 мг, у разі необхідності дозу можна збільшити. Пацієнтам із тяжким порушенням функції нирок (швидкість клубочкової фільтрації < 30 мл/хв) моксонідин протипоказаний.

Печінкова недостатність. Для пацієнтів із порушенням функції печінки клінічні дані відсутні. Проте моксонідин не зазнає метаболізму у печінці, значного впливу на його фармакокінетику не очікується. Тому дозування для пацієнтів зі слабкими помірними порушенням функції печінки рекомендується таке ж саме, що і для дорослих. Прийом препарату не можна переривати раптово, оскільки можливість рикошетної артеріальної гіпертензії як «ефекту відміни» неможливо повністю виключити. Прийом препарату слід припиняти протягом 2-х тижнів, поступово зменшуючи дозу.

Діти. Ефективність і безпека застосування препарату дітям не встановлені, тому препарат не слід призначати цій віковій категорії.

Передозування.

В окремих випадках передозування моксонідину, навіть у дозі 19,6 мг на добу, не призводило до летального наслідку. До симптомів передозування належить головний біль, седативний ефект, сонливість, артеріальна гіпотензія, запаморочення, загальна слабкість, брадикардія, сухість у роті, блювання, біль у верхній ділянці живота і відчуття нездужання. У випадку тяжкого передозування рекомендується ретельний моніторинг порушень свідомості та особливо – пригнічення дихання. Базуючись на дослідженнях високих доз препарату у тварин, додатково можна очікувати появу тимчасової артеріальної гіпертензії, тахікардії і гіперглікемії.

Специфічні антидоти невідомі. У випадку артеріальної гіпотензії для підтримки гемоциркуляції рекомендується застосування допаміну і введення плазмозамінюючих розчинів. Атропін може бути ефективним при появі брадикардії.

Антагоністи α-адренорецепторів можуть зменшити або усунути парадоксальні гіпертензивні ефекти передозування моксонідину.

Побічні реакції.

Найчастіші побічні ефекти моксонідину включають сухість у роті, запаморочення, сонливість і загальну слабкість/астенію. Ці симптоми часто зменшуються після кількох тижнів лікування.

З боку нервової системи: **головний біль, запаморочення/вертиго, сонливість, непритомність**.

З боку шлунково-кишкового тракту: сухість у роті, діарея, нудота/блювання, диспепсія.

З боку органів зору та лабіринту: дзвін у вухах.

З боку шкіри та підшкірної тканини: реакції гіперчутливості, у тому числі висипання, свербіж; ангіоневротичний набряк.

З боку серцево-судинної системи: брадикардія, артеріальна гіпотензія (у тому числі ортостатична гіпотензія).

З боку скелетно-м'язової системи та сполучної тканини: біль у спині, біль у шиї.

Психічні порушення: безсоння; знервованість.

Загальні порушення: астенія; набряк.

Термін придатності.

2 роки для дозування 0,2 мг. 3 роки для дозування 0,3 мг та 0,4 мг.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 30 °С у

недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток, вкритих плівковою оболонкою у блістері, по 3 блістери у картонній коробці, по 25 таблеток, вкритих плівковою оболонкою у блістері,

по 2 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Артезан Фарма ГмбХ і Ко. КГ, Німеччина/Artesan Pharma GmbH & Co. KG, Germany.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця впровадження діяльності. 29439, Люхов, Вендландштрасе 1/29439, Luechow, Wendlandstrasse 1.