

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**  
**ФІЗІОТЕНС<sup>®</sup>**  
**(PHYSIOTENS<sup>®</sup>)**

**Склад.**

*Діюча речовина:* тохонідинум;

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

*допоміжні речовини:* лактоза, моногідрат, повідон К25, кросповідон, магнію стеарат, *оболонка таблетки:* гіпромелоза, етилцелюлоза, макрогол 6000, тальк, заліза оксид червоний (Е 172), титану діоксид (Е 171).

**Лікарська форма.** Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

**Фармакотерапевтична група.** Гіпотензивні засоби. Антиадренергічні засоби з центральним механізмом дії. Агоністи імідазолінових рецепторів. Код АТС С02А С05.

**Клінічні характеристики.**

**Показання.**

Артеріальна гіпертензія.

**Протипоказання.**

- Відома гіперчутливість до будь-якого компонента препарату;
- синдром слабкості синусового вузла або брадикардія у спокої нижче 50 уд./хв;
- період годування груддю.

Фізіотенс<sup>®</sup> не рекомендований для лікування пацієнтів молодше 18 років.

**Спосіб застосування та дози.**

Для дорослих звичайна початкова доза Фізіотенсу<sup>®</sup> становить 0,2 мг на добу, а максимальна добова доза – 0,6 мг за 2 прийоми. Максимальна разова доза – 0,4 мг. Дозу слід підбирати індивідуально, залежно від реакції пацієнта.

Фізіотенс<sup>®</sup> можна приймати незалежно від прийому їжі.

Для хворих з помірно вираженою або тяжкою нирковою недостатністю початкова доза Фізіотенсу<sup>®</sup> становить 0,2 мг на добу. За необхідності і у разі гарної переносимості препарату дозу можна підвищити до 0,4 мг на добу.

Для хворих, що знаходяться на гемодіалізі, початкова доза препарату Фізіотенсу<sup>®</sup> становить 0,2 мг на добу. За необхідності і у разі гарної переносимості препарату дозу можна підвищити до 0,4 мг на добу. Застосування Фізіотенсу<sup>®</sup> у пацієнтів молодше 18 років не рекомендується через недостатність даних щодо безпеки та ефективності препарату в цій групі.

**Побічні реакції.**

Найчастіші побічні ефекти Фізіотенсу<sup>®</sup> включають сухість у роті, головний біль, запаморочення, сонливість і загальну слабкість. Ці симптоми часто зменшуються після кількох тижнів лікування.

Нижче наведені побічні реакції, згруповані за класами систем організму: часті ( 1/100, < 1/10), нечасті ( 1/1000, <1/100), рідкісні ( $\geq$  1/10000, < 1/1000, < 1/1000), дуже рідкісні (< 1/10000, включаючи окремі повідомлення).

*З боку нервової системи:* часті – запаморочення, головний біль, сонливість; нечасті – безсоння.

*З боку судинної системи:* рідкісні – артеріальна гіпотензія, ортостатична гіпотензія.

*З боку шлунково-кишкового тракту:* часті – сухість у роті; нечасті – нудота.

*З боку шкіри та підшкірної тканини:* нечасті – висипання, свербіж; дуже рідкісні – ангіоневротичний

набряк.

*Загальні порушення та реакції у місці введення:* часті – астенія.

### ***Передозування.***

В окремих випадках передозування Фізіотенсу<sup>®</sup>, навіть у дозі 19,6 мг на добу, не призводило до смерті хворих. 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. Базуючись на дослідженнях високих доз препарату у тварин, додатково можна очікувати появу тимчасової артеріальної гіпертензії, тахікардії і гіперглікемії. Специфічні антидоти невідомі. У разі гіпотензії для підтримки гемоциркуляції рекомендується застосування допаміну і введення плазмозамінюючих розчинів. Атропін може бути ефективним при появі брадикардії.

Антагоністи  $\alpha$ -адренорецепторів можуть зменшити або усунути парадоксальні гіпертензивні ефекти передозування Фізіотенсу<sup>®</sup>.

### ***Особливості застосування.***

Якщо Фізіотенс<sup>®</sup> застосовують у комбінації з  $\beta$ -адреноблокатором і обидва препарати необхідно відмінити, спочатку слід відмінити  $\beta$ -адреноблокатор, а потім – Фізіотенс<sup>®</sup>.

Прийом Фізіотенсу<sup>®</sup> не слід припиняти раптово.

Пацієнтам з поодинокими спадковими захворюваннями, такими як непереносимість галактози, недостатність лактази, синдром Лаппа або мальабсорбція глюкози-галактози, не слід приймати цей препарат.

### ***Застосування в період вагітності та годування груддю.***

Дослідження на тваринах не вказують на наявність прямих або непрямих шкідливих ефектів моксонідину на вагітність, розвиток ембріона і плода, пологи і постнатальний розвиток, але клінічні дані щодо застосування Фізіотенсу<sup>®</sup> під час вагітності недостатні. Тому призначати препарат вагітним слід з особливою обережністю.

Моксонідин екскретується у грудне молоко. Жінкам, які годують груддю, слід рекомендувати припинити лікування Фізіотенсом<sup>®</sup> або не годувати дитину, якщо вони приймають препарат.

### ***Діти.***

Фізіотенс<sup>®</sup> не рекомендований для лікування пацієнтів молодше 18 років.

### ***Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.***

Дослідження щодо впливу препарату на здатність до керування автотранспортом або механізмами не проводилися. Повідомлялося про випадки сонливості та запаморочення при застосуванні препарату. Це слід враховувати при виконанні зазначених дій.

### ***Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.***

Застосування Фізіотенсу<sup>®</sup> разом з тіазидними діуретиками і блокаторами кальцієвих каналів є безпечним. Одночасний прийом препарату з цими та іншими антигіпертензивними засобами справляє адитивний ефект.

У здорових осіб фармакокінетичної взаємодії з гідрохлортіазидом, глібенкламідом (глібуридом) і дигоксином не виявлено.

Оскільки трициклічні антидепресанти можуть зменшити ефективність антигіпертензивних агентів центральної дії, призначення цих препаратів разом з Фізіотенсом<sup>®</sup> не рекомендовано. Фармакокінетична взаємодія з моклобемідом не виявлена.

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

## **Фармакологічні властивості.**

### *Фармакодинаміка.*

Моксонідин є селективним агоністом імідазолінових рецепторів у центральній нервовій системі. Ці чутливі до імідазоліну рецептори сконцентровані у ростральному відділі вентролатеральної частини довгастого мозку – ділянці, яка вважається центром регуляції периферичної симпатичної нервової системи. Стимуляція імідазолінових рецепторів гальмує активність симпатичної нервової системи і знижує артеріальний тиск.

Моксонідин відрізняється від інших симпатолітичних антигіпертензивних засобів відносно низькою спорідненістю з відомими постсинаптичними  $\alpha_2$ -адренорецепторами у порівнянні з імідазоліновими рецепторами. Завдяки цьому седативний ефект і сухість у роті при застосуванні моксонідину виникають рідко.

Найвні дані свідчать про те, що моксонідин є ефективним антигіпертензивним агентом. У людини застосування моксонідину призводить до зменшення периферичного судинного опору з подальшим зниження артеріального тиску. Антигіпертензивний ефект моксонідину був продемонстрований у подвійних сліпих, плацебоконтрольованих, рандомізованих дослідженнях.

Моксонідин також підвищує індекс чутливості до інсуліну на 21 % у пацієнтів з ожирінням, резистентністю до інсуліну та помірною гіпертензією.

### *Фармакокінетика.*

*Абсорбція.* Після внутрішнього прийому моксонідин швидко (час досягнення максимальної концентрації у плазмі крові – 1 год) та практично повністю абсорбується у верхніх відділах шлунково-кишкового тракту. Абсолютна біодоступність становить приблизно 88 %, що вказує на несуттєвий пресистемний метаболізм первинного проходження через печінку. Одночасний прийом їжі не впливає на фармакокінетику моксонідину.

*Розподіл.* Ступінь зв'язування з білками плазми крові, визначений *in vitro*, становить приблизно 7,2 %.

*Біотрансформація.* У зразках плазми крові людини було ідентифіковано лише дегідрогенізований моксонідин. Фармакодинамічна активність дегідрогенізованого моксонідину становить приблизно 1/10 активності моксонідину.

*Виведення.* Протягом 24-годинного періоду з сечею екскретується 78 % загальної дози моксонідину у вигляді незміненої сполуки і 13 % – у вигляді дегідрогенізованого моксонідину. Інші незначні метаболіти в сечі становлять приблизно 8 % дози. Менше 1 % виводиться з калом. Період напіввиведення моксонідину та його метаболіту становить приблизно 2,5 год та 5 год відповідно.

У хворих на артеріальну гіпертензію у порівнянні із здоровими особами фармакокінетика моксонідину суттєво не відрізнялася.

У літніх осіб спостерігалися зміни фармакокінетики, найімовірніше через знижений рівень метаболізму і/або декілька більшу біодоступність. Однак ці зміни не вважаються клінічно значущими.

Оскільки моксонідин не рекомендований для лікування дітей, фармакокінетичні дослідження в цій субпопуляції не проводилися.

Виведення моксонідину значною мірою залежить від кліренсу креатиніну. У хворих з помірною нирковою недостатністю (швидкість клубочкової фільтрації 30-60 мл/хв) стабільна концентрація у плазмі і період напіввиведення приблизно в 2 і 1,5 рази вище, відповідно, ніж у пацієнтів з нормальною функцією нирок (швидкість клубочкової фільтрації > 90 мл/хв). У хворих з тяжкою нирковою недостатністю (швидкість клубочкової фільтрації < 30 мл/хв) стабільна концентрація в плазмі і період напіввиведення приблизно в 3 рази вище. У цих хворих не спостерігалось накопичення моксонідину після багаторазового прийому. На термінальних стадіях ниркової недостатності (швидкість клубочкової фільтрації < 10 мл/хв) у хворих, які знаходяться на гемодіалізі, стабільна концентрація в плазмі і період напіввиведення приблизно в 6 і 4 рази вище, відповідно. В усіх групах максимальна концентрація моксонідину в плазмі тільки у 1,5-2 рази вище.

Базуючись на вищенаведених даних, дозу моксонідину для пацієнтів з нирковою недостатністю слід підбирати індивідуально. Під час гемодіалізу моксонідин видаляється незначною мірою.

*Доклінічні дані з безпеки.*

Не виявлено жодного особливого ризику для людини на підставі результатів стандартних фармакологічних досліджень з безпеки, хронічної токсичності, генотоксичності, канцерогенного потенціалу та репродуктивної токсичності.

**Фармацевтичні характеристики.**

***Основні фізико-хімічні властивості:***

0,2 мг – кругла, опукла таблетка світло-рожевого кольору, з маркуванням “0,2”;  
0,3 мг – кругла, опукла таблетка блідо-червоного кольору, з маркуванням “0,3”;  
0,4 мг – кругла, опукла таблетка матово-червоного кольору, з маркуванням “0,4”.

**Умови та термін зберігання.**

Таблетки Фізіотенсу® по 0,2 мг: зберігати при температурі не вище 25 °С, у недоступному для дітей місці. Термін придатності – 2 роки.

Таблетки Фізіотенсу® по 0,3 мг і 0,4 мг: зберігати при температурі не вище 30 °С, у недоступному для дітей місці. Термін придатності – 3 роки.

**Упаковка.**

Таблетки по 0,2 і 0,4 мг:

№ 14 (по 14 таблеток у блістері, по 1 блістеру в картонній коробці);

№ 28 (по 14 таблеток у блістері, по 2 блістери в картонній коробці, або по 28 таблеток у блістері, по 1 блістеру в картонній коробці);

№ 98 (по 14 таблеток у блістері, по 7 блістерів у картонній коробці).

Таблетки по 0,3 мг:

№ 28 (по 14 таблеток у блістері, по 2 блістери в картонній коробці, або по 28 таблеток у блістері, по 1 блістеру в картонній коробці);

№ 98 (по 14 таблеток у блістері, по 7 блістерів у картонній коробці).

**Категорія відпуску.** За рецептом.

**Виробник.** Солвей Фармацевтікалз, Франція.

**Місцезнаходження.** Solvay Pharmaceuticals, Route de Belleville, Lieu dit Maillard, 01400, Chatillon-sur-Chalaronne, France.

**Адреса представництва в Україні:** 04114 м.Київ, вул. Вишгородська, 63

т. (044) 224-53-00, 224-53-02, 224-53-03; адреса в Інтернеті: [www.solvay-pharma.com.ua](http://www.solvay-pharma.com.ua).