

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
Моксогама®
(Moxogamma®)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: moxonidin; 4-хлор-5-(2-імідазолін-2-іламіно)6-метокси-2-метилпіримідин;

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.

склад: 1 таблетка містить моксонідину 0,2 мг; 0,3 мг; 0,4 мг

допоміжні речовини: лактози моногідрат, кроповідон, повідон К 25, магнію стеарат, гідроксипропілметилцелюлоза, діоксид титану (Е 171), макрогол 400, червоний оксид заліза (Е 172).

Форма випуску. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Антиадренергічні засоби з центральним механізмом дії. Код АТС 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 в ростральному відділі вентролатеральної частини довгастого мозку, ділянці, що відіграє важливу роль в центральному контролі симпатичної нервової системи. Ефектом такої взаємодії з імідазоліновими рецепторами є зміна активності симпатичної нервової системи та зниженні артеріального тиску.

Моксонідин відрізняється від симпатолітичних антигіпертензивних засобів слабкою спорідненістю з центральними α -адренергічними рецепторами порівняно зі спорідненістю з імідазоліновими рецепторами. Тому седативний ефект та сухість у роті, небажана дія, що спостерігається у цих засобів, при прийомі препарату виникає рідше.

Середній систолічний і діастолічний артеріальний тиск знижується як у спокої, так і під час навантаження.

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

Лише близько 7 % моксонідину зв'язується з білками плазми людини.

Пікових рівнів у плазмі моксонідин досягає через 30 – 180 хвилин після прийому таблетки.

Моксонідин метаболізується на 10 – 20 %, переважно до 4,5-дигідромоксонідину та похідного амінометанамідину, шляхом відкриття імідазолінового каналця. Гіпотензивний ефект 4,5-дигідромоксонідину складає лише 1/10, похідного амінометанамідину – менш ніж 1/100 ефекту моксонідину.

Моксонідин та його метаболіти майже повністю виводяться через нирки.

Більш ніж 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 у плазмі складає 2,2 – 2,3 години, а у нирках – 2,6 – 2,8 години.

У пацієнтів з помірним порушенням функції нирок (швидкість клубочкової фільтрації 30 – 60 мл/хв), кліренс знижується до 52 %. Дозування для таких пацієнтів повинно бути адаптованим, добова доза

не повинна перевищувати 0,4 мг, а разова – 0,2 мг.

Фармакокінетичні дослідження у дітей не проводились.

Моксонідин проникає через ГЕБ, плацентарний бар'єр, потрапляє в грудне молоко.

Показання для застосування. Артеріальна гіпертензія.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі. Лікування слід розпочинати з найнижчої дози моксонідину – 0,2 мг. Якщо терапевтичний ефект недостатній, через три тижні дозу можна збільшити до 0,4 мг. Цю дозу можна приймати за один раз (вранці) або ділити на два прийоми (вранці та ввечері). Якщо протягом наступних трьох тижнів результати незадовільні, дозу можна збільшити максимум до 0,6 мг, приймати у два прийоми, вранці та ввечері. Разова доза 0,4 мг моксонідину та добова доза 0,6 мг моксонідину не повинні перевищуватися.

Моксогаму® можна приймати незалежно від прийому їжі. Таблетку слід приймати з достатньою кількістю рідини.

Люди 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), разова доза не повинна перевищувати 0,2 мг, а добова – 0,4 мг моксонідину. Для пацієнтів з тяжким порушенням функції нирок (швидкість клубочкової фільтрації < 30 мл/хв) моксонідин протипоказаний.

Печінкова недостатність. Для пацієнтів з 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 слабким помірним порушенням функції печінки рекомендується таке ж саме, що і для дорослих. Для пацієнтів з тяжким порушенням функції печінки моксонідин протипоказаний.

Прийом Моксогами® не можна переривати раптово, оскільки можливість рикошетної гіпертензії як «ефекту відміни» не вдається повністю виключити. Прийом Моксогами® слід припиняти протягом двох тижнів.

Побічна дія.

З боку нервової системи: сонливість, загальмованість, головний біль, запаморочення, порушення сну.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, запор.

З боку органів зору: свербіж або печіння в очах.

З боку шкіри: алергічні шкірні реакції.

З боку серцево-судинної системи: вазодилатація, артеріальна гіпотензія, брадикардія, парестезії кінцівок, синдром Рейно, порушення периферичного кровообігу.

Інші: сухість у роті, астения, депресія, відчуття тривоги, набряки, слабкість у ногах, ангіоневротичний набряк, анорексія, біль у навколоручних залозах, затримка або нетримання сечі, гінекомастія, імпотенція або втрата лібідо; дуже рідко (менше 1/100, в тому числі окремі повідомлення): гепатит та застій жовчі.

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-го або III-го ступеня.
- Тяжке ураження функції нирок (швидкість клубочкової фільтрації < 30 мл/хв, концентрація креатиніну сироватки > 160 мкмоль/л).
- Ангіоневротичний набряк в анамнезі.
- Злоякісна аритмія.
- Застійна серцева недостатність кровообігу IV ст. за класифікацією NYHA.

- Тяжкі захворювання печінки.
- Вагітність, період годування груддю.

Моксогама[®] не рекомендується для лікування дітей та підлітків, віком до 16 років.

Через нестачу терапевтичного досвіду, моксонідин не можна використовувати у таких випадках:

- хвороба Паркінсона;
- хвороба Рейно;
- епілептичні порушення;
- глаукома.

Передозування.

До симптомів передозування відносяться такі реакції: сонливість, загальмованість, артеріальна гіпотензія, ортостатичні розлади, брадикардія, сухість у роті. У поодиноких випадках може виникати блювота і парадоксальна гіпертензія.

Лікування полягає в заходах поглинання та зменшення концентрації, таких як промивання шлунка (одразу після прийому), введення активованого вугілля та проносного. Специфічні антидоти не відомі. Окрім загальних підтримуючих заходів, частково зняти симптоми передозування моксонідину можуть антагоністи α -адренорецепторів. У випадку тяжкої брадикардії рекомендується атропін.

Особливості застосування.

Якщо моксонідин застосовувався в поєднанні з β -блокаторами, у випадку припинення лікування, щоб уникнути надмірного підвищення артеріального тиску, β -блокатор слід відмінити першим, а лікування моксонідином треба поступово припинити протягом двох тижнів.

Надзвичайно обережно слід приймати моксонідин пацієнтам з тяжкою цереброваскулярною недостатністю, гострим інфарктом міокарда та з розладами периферичного кровообігу.

Через недостатність даних щодо клінічної безпеки у пацієнтів із супутньою помірною серцевою недостатністю, моксонідин таким пацієнтам слід застосовувати з надзвичайною обережністю.

Моксонідин не рекомендується давати дітям та підліткам, віком до 16 років, оскільки для цього віку немає достатніх терапевтичних даних.

Прийом Моксогами[®] не можна переривати раптово, оскільки можливість рикошетної гіпертензії як «ефекту відміни» не вдається повністю виключити. Прийом Моксогами[®] слід поступово припинити протягом двох тижнів.

Пацієнти з рідкісною спадковою непереносимістю галактози, дефіцитом лактази або з порушенням всмоктування глюкози та галактози не повинні приймати цей лікарський засіб.

Вагітність і лактація. Достатніх даних щодо застосування моксонідину у вагітних жінок немає. У період вагітності моксонідин має використовуватись тільки у разі крайньої необхідності. Моксонідин не слід приймати у період годування груддю, оскільки він всмоктується у грудне молоко.

Вплив на здатність керувати автомобілем та управляти механізмами.

Дослідження впливу на здатність керувати автомобілем та управляти механізмами не проводились. Проте повідомлялося про сонливість та запаморочення. Цей факт слід враховувати під час виконання таких робіт.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Супутній прийом антигіпертензивних засобів посилює гіпотензивний ефект моксонідину. Моксонідин може інтенсифікувати вплив трициклічних антидепресантів (уникати одночасного призначення), транквілізаторів, алкоголю, заспокійливих та снодійних засобів. Заспокійливий вплив бензодіазепінів при одночасному прийомі моксонідину може посилюватися. При одночасному прийомі з лоразепамом, моксонідин трохи знижує когнітивні функції пацієнтів.

Моксонідин виводиться шляхом канальцевої секреції. Взаємодію з іншими ліками, що виводяться шляхом канальцевої секреції (наприклад: похідні дигіталісу, інсулін, сульфонілсечовина, протиревматичні агенти, гіполіпідемічні засоби, аллопуринол, колхіцин, пробенецид, противиразкові засоби, екстракти щитоподібної залози) не виявлено. Толазодин може знижувати ефект моксонідину в

залежності від дози.

Моксонідин може застосовуватись разом з салуретиками (гідрохлортіазидом); при цьому спостерігається синергічний ефект.

Умови та термін зберігання. При температурі 15°C – 25°C в оригінальній упаковці у недоступному для дітей місці.

Термін придатності – 2 роки. Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності зазначеного на упаковці.

Умови відпуску. За рецептом.

Форма випуску. По 10 таблеток, вкритих плівковою оболонкою у блістері, по 3 блістера у картонній коробці, по 25 таблеток, вкритих плівковою оболонкою у блістері, по 2 блістера у картонній коробці.

Виробник. Вьорваг Фарма ГмбХ і Ко. КГ.

Адреса. Кальверштрассе, 7, 71034 Бьоблінген, Німеччина.