

**УТВЕРЖДЕНА**  
Приказом Председателя  
РГУ «Комитет контроля качества и  
безопасности товаров и услуг»  
Министерства здравоохранения  
Республики Казахстан  
от « \_\_\_\_ » \_\_\_\_\_ 20\_\_ 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 оболочки*: железа(III) оксид красный (E172), Dyestuff Opadry Y-1-7000 white (гипромеллоза, титана диоксид (E171), полиэтиленгликоль)

**Описание**

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

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

**Фармакотерапевтическая группа**

Сердечно-сосудистая система. Антигипертензивные препараты. Антиадренергические препараты центрального действия. Агонисты имидазолиновых рецепторов. 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 фармакокинетике 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. Локализацией действия моксонидина является центральная нервная система (ЦНС). 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  $\alpha_2$ -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**

Нижеперечисленные нежелательные эффекты классифицированы в соответствии с частотой встречаемости. Частотные категории определены в соответствии с обозначениями MedDRA (Медицинского словаря терминов регуляторной деятельности): очень часто ( $\geq 1/10$ ); часто ( $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ); нечасто ( $\geq 1/1000$  до  $< 1/100$ ); редко ( $\geq 1/10000$  до  $< 1/1000$ ); очень редко ( $< 1/10000$ ); неизвестно (не может быть оценено по имеющимся данным).

*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

## **Противопоказания**

- повышенная чувствительность к компонентам препарата
- синдром слабости синусового узла или синоатриальная блокада
- 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 галактозы, дефицит фермента Lapp-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.

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.

Из-за отсутствия клинических данных, подтверждающих безопасность у пациентов с сопутствующей умеренной сердечной недостаточностью, Моксонидин-Тева следует использовать с осторожностью у таких пациентов.

Пожилые пациенты могут быть более восприимчивым к сердечно-сосудистым эффектам лекарств, снижающих кровяное давление. Поэтому терапию следует начинать с самой низкой дозы, а приращения дозы следует вводить с осторожностью, чтобы предотвратить серьезные последствия, к которым могут привести эти реакции.

*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 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению на казахском 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», Ludwig-Mercle-Str. 3, 89143, Блаубойрен, Германия

### **Упаковщик**

«Меркле ГмбХ», Graf-Arco-Str. 3, 89079, Ульм, Германия

### **Держатель регистрационного удостоверения**

«ратиофарм ГмбХ», Graf-Arco-Str. 3, 89079, Ульм, Германия

**Наименование, адрес и контактные данные (телефон, факс, электронная почта) организации на территории Республики**

***Казахстан, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств от потребителей и ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственного средства:***

ТОО «ратиофарм Казахстан», 050059 (A15E2P), г. Алматы, пр. Аль-Фараби 17/1, БЦ Нурлы-Тау, 5Б, 6 этаж. Телефон: (727)3251615; e-mail: info.tevakz@tevapharm.com; веб сайт: www.teva.kz