Физиотенз



Код АТХ:

- C02AC05

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Моксонидин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой бледно-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "0,2" с одной стороны; на изломе - белого цвета.

	1 таб.
моксонидин	200 мкг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 95.8 мг, повидон - 0.7 мг, кросповидон - 3 мг, магния стеарат - 0.3 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 1.3 мг, этилцеллюлоза - 1.2 мг, макрогол - 0.25 мг, тальк - 0.9975 мг, краситель железа оксид красный (E172) - 0.0025 мг, титана диоксид (E171) - 1.25 мг.

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой коричневато-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "0,4" с одной стороны; на изломе - белого цвета.

	1 таб.
моксонидин	400 мкг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 95.6 мг, повидон - 0.7 мг, кросповидон - 3 мг, магния стеарат - 0.3 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 1.3 мг, этилцеллюлоза - 1.2 мг, макрогол - 0.25 мг, тальк - 0.875 мг, краситель железа оксид красный (E172) - 0.125 мг, титана диоксид (E171) - 1.25 мг.

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивный препарат центрального действия.

Моксонидин является антигипертензивным 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 АД.

Моксонидин отличается от других симпатолитических антигипертензивных средств более низким сродством к α_2-адренорецепторам, что объясняет меньшую вероятность развития седативного эффекта и сухости во рту.

Применение 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 продемонстрировали, что при сходном снижении АД применение комбинации антагонистов рецепторов ангиотензина II с моксонидином позволяет в большей степени уменьшить гипертрофию левого желудочка по сравнению со свободной комбинацией тиазидного диуретика и блокатора медленных кальциевых каналов (15% против 11%; $p<0.05$).

Моксонидин улучшает на 21% индекс чувствительности к инсулину (по сравнению с плацебо) у пациентов с ожирением, инсулинрезистентностью и умеренной степенью артериальной гипертензии.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь моксонидин быстро и почти полностью абсорбируется в верхних отделах ЖКТ. Абсолютная биодоступность составляет приблизительно 88%, что указывает на отсутствие значительного эффекта "первого прохождения" через печень.

Время достижения C_{max} - около 1 ч. Прием пищи не оказывает влияние на фармакокинетику препарата.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови составляет 7.2%.

Метаболизм

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

Выведение

$T_{1/2}$ моксонидина и метаболита составляет 2.5 и 5 ч соответственно. В течение 24 ч более 90% моксонидина выводится почками (около 78% - в неизмененном виде и 13% - в виде дегидриромоксонидина, другие метаболиты в моче не превышают 8% от принятой дозы). Менее 1% дозы выводится через кишечник.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

По сравнению со здоровыми добровольцами у пациентов с артериальной гипертензией не отмечается изменений фармакокинетики моксонидина.

Отмечены клинически незначимые изменения фармакокинетических показателей моксонидина у пациентов пожилого возраста, вероятно обусловленные снижением интенсивности его метаболизма и/или несколько более высокой биодоступностью.

Моксонидин не рекомендуется для применения у пациентов в возрасте до 18 лет, в связи с чем в этой группе фармакокинетические исследования не проводились.

Выведение моксонидина в значительной степени коррелирует с КК. У пациентов с почечной недостаточностью средней степени (КК 30-60 мл/мин) равновесные концентрации в плазме крови и конечный $T_{1/2}$ приблизительно в 2 и 1.5 раза выше, чем у лиц с нормальной функцией почек (КК более 90 мл/мин). У пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (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 почечной недостаточностью средней и тяжелой степени. 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 почечной недостаточностью средней степени C_{max} моксонидина в плазме крови выше в 1.5-2 раза. У пациентов с нарушениями функции почек доза должна подбираться индивидуально.

Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

— СССУ;

— выраженная брадикардия (ЧСС в покое менее 50 уд./мин);

— AV-блокада II или III степени;

— острая и хроническая сердечная недостаточность;

— период лактации;

— возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по безопасности и эффективности);

— наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или мальабсорбция глюкозы/галактозы;

— повышенная чувствительность к активному веществу и другим компонентам препарата.

Необходимо соблюдать *особую осторожность* при применении моксонидина у пациентов с AV-блокадой I степени (риск развития брадикардии); тяжелым заболеванием коронарных сосудов и нестабильной стенокардией (опыт применения недостаточен); почечной недостаточностью.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи.

В большинстве случаев начальная доза препарата Физиотенз составляет 200 мкг/сут. Максимальная разовая доза составляет 400 мкг. Максимальная суточная доза, которую следует разделить на 2 приема, составляет 600 мкг.

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** - 200 мкг/сут. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза может быть увеличена до максимальной 400 мкг.

Пациентам с почечной недостаточностью рекомендуется осторожный подбор дозы, особенно в начале лечения. Начальная доза должна составлять 200 мкг/сут. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза препарата может быть увеличена до максимальной - 400 мкг для **пациентов с почечной недостаточностью средней степени (КК более 30 мл/мин, но менее 60 мл/мин)** и 300 мкг - для **пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин)**.

Побочное действие:

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

У пациентов, принимавших участие в плацебо-контролируемых клинических исследованиях препарата Физиотенз, отмечены следующие побочные эффекты.

Частота побочных эффектов, приведенных ниже, определялась соответственно следующему: очень часто (>1/10); часто (>1/100, <1/10); нечасто (> 1/1000, <1/100), включая отдельные сообщения.

Со стороны ЦНС: часто - головная боль*, головокружение (вертиго), сонливость; нечасто - обморок.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия*, брадикардия.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - сухость во рту; часто - диарея, тошнота, рвота, диспепсия.

Со стороны кожи и подкожных тканей: часто - кожная сыпь, зуд; нечасто - ангионевротический отек.

Со стороны психики: часто - бессонница; нечасто - нервозность.

Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: нечасто - звон в ушах.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - боль в спине; нечасто - боль в области шеи.

Со стороны организма в целом: часто - астения; нечасто - периферические отеки.

* - частота сопоставима с плацебо.

Передозировка:

Имеются сообщения о нескольких случаях передозировки без летального исхода, когда одномоментно применялись дозы до 19.6 мг.

Симптомы: головная боль, седативный эффект, сонливость, выраженное снижение АД, головокружение, астения, брадикардия, сухость во рту, рвота, усталость, 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: специфических антидотов не существует. В случае выраженного снижения АД может потребоваться восстановление ОЦК 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 α-адренорецепторов могут уменьшать или устранять парадоксальные гипертензивные эффекты при передозировке моксонидина.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременность

Клинические данные о применении Физиотенза у беременных отсутствуют.

В ходе *экспериментальных исследований* на животных было установлено эмбриотоксическое действие препарата.

Физиотенз следует назначать беременным только после тщательной оценки соотношения риска и пользы, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Период лактации

Моксонидин выделяется с грудным молоком, поэтому его не следует назначать в период кормления грудью. При необходимости применения Физиотенза в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение моксонидина с другими антигипертензивными препаратами приводит к аддитивному эффекту.

Трициклические антидепрессанты могут снижать эффективность антигипертензивных средств центрального действия, в связи с чем не рекомендуется их одновременное применение с моксонидином.

Моксонидин может усиливать действие трициклических антидепрессантов (необходимо избегать их одновременного применения), 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 применении.

Моксонидин выделяется путем канальцевой секреции. Поэтому не исключено его взаимодействие с другими препаратами, выделяющимися путем канальцевой секреции.

Особые указания и меры предосторожности:

В постмаркетинговом наблюдении зафиксированы случаи AV-блокады различной степени тяжести у пациентов, принимающих моксонидин. Связь между приемом препарата Физиотенз и замедлением AV-проводимости не может быть полностью исключена. Таким образом, при лечении пациентов с вероятной предрасположенностью к развитию AV-блокады рекомендуется соблюдать осторожность.

При необходимости отмены одновременно принимаемых бета-адреноблокаторов и препарата Физиотенз, сначала следует отменить бета-адреноблокаторы и лишь через несколько дней - Физиотенз.

В настоящее время нет подтверждений того, что прекращение приема препарата Физиотенз приводит к повышению АД. Однако не рекомендуется прекращать прием препарата Физиотенз резко, вместо этого следует постепенно уменьшать дозу препарата в течение 2 недель.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению машинами и механизмами

Исследования влияния препарата на способность управлять автомобилем и другими механизмами не проводились. Имеются сообщения о сонливости и головокружении в период лечения моксонидином, что следует учитывать пациентам, занимающимся потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Начальная доза для **пациентов, находящихся на гемодиализе** - 200 мкг/сут. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза может быть увеличена до максимальной 400 мкг.

Пациентам с почечной недостаточностью рекомендуется осторожный подбор дозы, особенно в начале лечения. Начальная доза должна составлять 200 мкг/сут. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза препарата может быть увеличена до максимальной - 400 мкг для **пациентов с почечной недостаточностью средней степени (КК более 30 мл/мин, но менее 60 мл/мин)** и 300 мкг - для **пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин)**.

При нарушениях функции печени

Коррекция дозы для пациентов с **печеночной недостаточностью** не требуется.

Применение в пожилом возрасте

Отмечены клинически незначимые изменения фармакокинетических показателей моксонидина у пациентов пожилого возраста, вероятно обусловленные снижением интенсивности его метаболизма и/или несколько более высокой биодоступностью.

Применение в детском возрасте

Противопоказано применение препарата у пациентов в возрасте до 18 лет (в связи с отсутствием данных по безопасности эффективности).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте.

Препарат в форме таблеток 200 мкг следует хранить при температуре не выше 25°С.

Препарат в форме таблеток 400 мкг следует хранить при температуре не выше 30°С. Срок годности - 3 года.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.