Моксарел



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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе - ядро белого или почти белого цвета.

	1 таб.
моксонидин	200 мкг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 64 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 29.8 мг, кремния диоксид коллоидный - 1 мг, повидон К30 - 2 мг, кроскармеллоза натрия - 2 мг, магния стеарат - 1 мг.

Состав пленочной оболочки: (гипромеллоза - 1.8 мг, тальк - 0.6 мг, титана диоксид - 0.33 мг, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000) - 0.27 мг) или (сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу - 60%, тальк - 20%, титана диоксид - 11%, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000) - 9%) - 3 мг.

14 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе - ядро белого или почти белого цвета.

	1 таб.
моксонидин	400 мкг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 64 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 29.6 мг, кремния диоксид коллоидный - 1 мг, повидон К30 - 2 мг, кроскармеллоза натрия - 2 мг, магния стеарат - 1 мг.

Состав пленочной оболочки: (гипромеллоза - 1.8 мг, тальк - 0.6 мг, титана диоксид - 0.31 мг, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000) - 0.27 мг, железа оксид желтый (железа оксид) - 0.02 мг) или (сухая смесь для пленочного покрытия, содержащая гипромеллозу - 60%, тальк - 20%, титана диоксид - 10.33%, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000) - 9%, железа оксид желтый (железа оксид) - 0.67%) - 3 мг.

14 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

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_1-адренорецепторам, что объясняет меньшую вероятность развития седативного эффекта и сухости слизистой оболочки полости рта.

Прием моксонидина приводит к снижению системного сосудистого сопротивления и АД.

Моксонидин улучшает индекс чувствительности к инсулину у пациентов с ожирением, инсулинорезистентностью 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%. Время достижения C_{max} - около 1 ч. Прием пищи не оказывает влияние на фармакокинетику препарата.

Распределение

Связь с белками плазмы крови составляет 7.2%.

Метаболизм

Основной метаболит - 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 свыше 90% моксонидина выводится почками (около 78% в неизмененном виде и 13% в виде дегидромоксонидина, другие метаболиты в моче не превышают 8% от принятой дозы). Менее 1% дозы выводится через кишечник.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

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

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

Выведение моксонидина в значительной степени коррелирует с КК. У пациентов с умеренной почечной недостаточностью (КК в интервале 30-60 мл/мин) равновесные концентрации в плазме крови и конечный $T_{1/2}$ приблизительно в 2 и 1,5 раза выше, чем у пациентов с нормальной функцией почек (КК более 90 мл/мин). У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (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 умеренной и тяжелой почечной недостаточностью. 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. Во всех группах C_{max} моксонидина в плазме крови выше в 1.5-2 раза. У

пациентов с нарушением функции почек дозировка должна подбираться индивидуально. Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

— выраженные нарушения ритма сердца;

— синдром слабости синусового узла;

— AV блокада II и III степени;

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

— острая и хроническая сердечная недостаточность (III-IV функциональный класс по классификации NYHA);

— одновременное применение с трициклическими антидепрессантами;

— тяжелая почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин), включая пациентов, находящихся на гемодиализе;

— возраст старше 75 лет;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность моксонидина не установлены);

— период грудного вскармливания;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— повышенная чувствительность к активному веществу, другим компонентам препарата.

С осторожностью

— нарушения функции почек (КК более 30 мл/мин);

— тяжелая печеночная недостаточность (более 9 баллов по классификации Чайлд-Пью);

— AV блокада I степени;

— тяжелые заболевания коронарных сосудов;

— тяжелая ИБС или нестабильная стенокардия (опыт применения недостаточен);

— хроническая сердечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи.

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

Начальная доза для пациентов с **умеренной или тяжелой почечной недостаточностью**, а также для пациентов, находящихся на гемодиализе, составляет 200 мкг/сут. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза может быть увеличена до 400 мкг.

Побочное действие:

Частота развития побочных эффектов, приведенных ниже, определялась соответственно следующему: очень часто (≥10%); часто (≥1%, но <10%); нечасто (≥0.1%, но <1%); редко (≥ 0.01%, но <0.1%); очень редко (<0.01%, включая единичные случаи).

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 ЖКТ: очень часто - сухость слизистой оболочки полости рта; часто - тошнота, диарея, 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 и соединительной ткани: часто - боль в спине; нечасто - боль в области шеи.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: часто - астения; нечасто - периферические отеки.

Передозировка:

Симптомы: головная боль, седативный эффект, сонливость, выраженное снижение АД, головокружение, повышенная утомляемость, астения, брадикардия, сухость слизистой оболочки полости рта, рвота и боль в эпигастральной области, угнетение дыхания, нарушение сознания. Потенциально возможны также кратковременное повышение АД, тахикардия, гипергликемия.

Лечение: специфического антидота не существует. В случае выраженного снижения АД рекомендуется введение жидкости для восстановления ОЦК и допамина. Брадикардия может быть купирована атропином. Антагонисты α-адренорецепторов могут уменьшать или устранять парадоксальные гипертензивные эффекты при передозировке моксонидином. В тяжелых случаях передозировки рекомендуется тщательно контролировать нарушения сознания и не допускать угнетения дыхания. Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Клинические данные о лечении беременных препаратом Моксарел отсутствуют.

Назначать Моксарел при беременности следует с осторожностью только после тщательной оценки соотношения риска и пользы, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Моксонидин проникает в грудное молоко. Кормящим женщинам в период лечения рекомендуется прекратить грудное вскармливание или отменить препарат.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Совместное применение моксонидина с другими гипотензивными средствами приводит к аддитивному эффекту.

Трициклические антидепрессанты могут снижать эффективность гипотензивных средств центрального действия, в связи с чем не рекомендуется их прием совместно с моксонидином.

Моксонидин может усиливать действие трициклических антидепрессантов, транквилизаторов, этанола, седативных и снотворных средств.

Моксонидин способен умеренно улучшать ослабленные когнитивные функции у пациентов, получающих лоразепам.

Назначение моксонидина совместно с производными бензодиазепина может сопровождаться усилением седативного эффекта последних.

Одновременное применение моксонидина с бета-адреноблокаторами приводит к усилению брадикардии, выраженности ино- и дромотропного действия.

При назначении моксонидина совместно с моклобемидом фармакодинамическое взаимодействие отсутствует.

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

Особые указания и меры предосторожности:

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

При необходимости отмены одновременно принимаемых бета-адреноблокаторов и препарата Моксарел сначала отменяют бета-адреноблокаторы, и лишь через несколько дней моксонидин.

Во время лечения необходим регулярный контроль АД, ЧСС и регистрация ЭКГ. Прекращать прием препарата Моксарел следует постепенно.

Во время лечения препаратом Моксарел следует исключить употребление алкоголя.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами

Влияние препарата Моксарелна способность к вождению транспортными средствами или управлению техникой изучено не было. Однако, принимая во внимание возможное возникновение головокружения и сонливости, пациентам следует соблюдать осторожность при занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания, таких как вождение автотранспорта или управление техникой, требующей повышенной концентрации внимания.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелой почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин), включая пациентов, находящихся на гемодиализе.

С осторожностью при нарушениях функции почек (КК более 30 мл/мин).

При нарушениях функции печени

С осторожностью при тяжелой печеночной недостаточности (более 9 баллов по классификации Чайлд-Пью).

Применение в пожилом возрасте

Противопоказан пациентам старше 75 лет

Применение в детском возрасте

Противопоказан пациентам младше 18 лет, т.к эффективность и безопасность моксонидина не установлены.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Moksarel