Моксонидин Канон



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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивное средство. Механизм действия моксонидина связывают главным образом с его влиянием на центральные звенья регуляции АД. Моксонидин является агонистом преимущественно имидазолиновых рецепторов.

Возбуждая указанные рецепторы нейронов солитарного тракта, моксонидин через систему тормозных интернейронов способствует угнетению активности сосудодвигательного центра и таким образом - уменьшению нисходящих симпатических влияний на сердечно-сосудистую систему. АД (систолическое и диастолическое) снижается постепенно. Моксонидин отличается от других симпатолитических гипотензивных средств более низким сродством к α_2-адренорецепторам, что объясняет меньшую вероятность развития седативного эффекта и сухости во рту.

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

Фармакокинетика

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 моксонидина. Связывание с белками плазмы крови составляет 7.2%. Основной метаболит моксонидина - дегидрированный моксонидин и производные гуанидина. Фармакодинамическая активность дегидрированного моксонидина - около 10% по сравнению с моксонидином.

$T_{1/2}$ 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.

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.

Выведение моксонидина в значительной степени коррелирует с КК. У пациентов с почечной недостаточностью средней степени (КК 30-60 мл/мин) C_{ss} 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 больных с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин), C_{ss} в плазме крови и конечный $T_{1/2}$ в 3 раза выше, чем у пациентов с нормальной функцией почек. Применение моксонидина в многократных дозах приводит к предсказуемой кумуляции в организме у пациентов с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени. У пациентов с терминальной почечной недостаточностью (КК менее 10 мл/мин), находящихся на гемодиализе, C_{ss} 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 нарушениями функции почек дозу следует подбираться индивидуально. Моксонидин в незначительной степени выводится при проведении гемодиализа.

Показания к применению:

Артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Гипертензия

Противопоказания:

Выраженная брадикардия (менее 50 уд./мин), СССУ, AV-блокада II и III степени, острая и хроническая сердечная недостаточность, период лактации (грудного вскармливания), детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к моксонидину.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Начальная доза составляет в среднем 200 мкг внутрь 1 раз/сут. *Максимальная разовая доза* - 400 мкг. Необходима индивидуальная коррекция суточной дозы в зависимости от переносимости терапии. Максимальная суточная доза - 600 мкг в 2 приема.

Для пациентов с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени, а также находящихся на гемодиализе начальная доза - 200 мкг/сут. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза может быть увеличена до максимальной 400 мкг.

Побочное действие:

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.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований безопасности моксонидина при беременности не проводилось, поэтому его не следует применять у этой категории пациентов.

Не следует применять в период лактации, поскольку моксонидин выделяется с грудным молоком. При необходимости применения моксонидина в период лактации, грудное вскармливание следует прекратить.

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

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, поэтому 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.

Моксонидин может усиливать седативный эффект производных бензодиазепина при их одновременном назначении.

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

Особые указания и меры предосторожности:

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.

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

В настоящее время нет подтверждений того, что прекращение приема моксонидина приводит к повышению АД. Однако не рекомендуется резкое прекращение приема моксонидина, дозу следует уменьшать постепенно, в течение 2 недель.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения пациентам следует соблюдать осторожность при необходимости занятий потенциально опасными видами деятельности, требующей концентрации внимания и высокой скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелых нарушениях функций почек.

С осторожностью применяют моксонидин у пациентов с нарушениями функции почек, в таких случаях требуется коррекция режима дозирования с учетом значений КК.

В процессе лечения больных с нарушением функции почек необходим тщательный контроль их состояния.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функций печени.

Применение в детском возрасте

В связи с отсутствием клинического опыта моксонидин не следует применять у детей и подростков в возрасте до 16 лет.

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