

Физиотенз®

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

Владелец регистрационного удостоверения

ABBOTT LABORATORIES (Германия)

Регистрационный номер

П N015691/01

Латинское название

Physiotens®

Действующее вещество

моксонидин (moxonidine)

АТХ

C02AC05 Моксонидин

Фармакологическая группа

Гипотензивное средство центрального действия

Нозологическая классификация (МКБ-10)

I10.. Эссенциальная [первичная] гипертензия

Состав

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

1 таб.

моксонидин

0.2 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 95.8 мг, повидон K25 - 0.7 мг, кросповидон - 3 мг, магния стеарат - 0.3 мг.

Состав оболочки: этилцеллюлозы водная дисперсия 30% - 4 мг (в пересчете на сухое вещество - 1.2 мг), смесь для покрытия пленочной оболочкой розового цвета [гипромеллоза - 1.3 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. 14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные. 14 шт. - блистеры (7) - пачки картонные. 28 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Описание лекарственной формы

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

Фармакологические свойства

Моксонидин является гипотензивным 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 гипотензивных 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 (ГЛЖ) продемонстрировали, что при сходном снижении АД применение комбинации антагонистов рецепторов ангиотензина II с моксонидином позволяет в большей степени уменьшить ГЛЖ 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 (в сравнении с плацебо) у пациентов с ожирением, инсулинорезистентностью и умеренной степенью артериальной гипертензии.

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 дегидрированного моксонидина, другие метаболиты в моче не превышают 8% от принятой дозы). Менее 1% дозы выводится через кишечник.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Пациенты с артериальной гипертензией: по сравнению со здоровыми добровольцами у пациентов с артериальной гипертензией не отмечается изменений фармакокинетики моксонидина.

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

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

Пациенты с почечной недостаточностью: выведение моксонидина в значительной степени коррелирует с КК. У пациентов с умеренной почечной недостаточностью (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 $\geq$ 90 мл/мин). У пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК $\leq$ 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 умеренной и тяжелой степени. У пациентов с терминальной почечной недостаточностью (КК $\leq$ 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 умеренной почечной недостаточностью 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

артериальная гипертензия.

Противопоказания

повышенная чувствительность к активному веществу и другим компонентам препарата; ангионевротический отек в анамнезе; СССУ или синоатриальная блокада; выраженная брадикардия (ЧСС в покое менее 50 уд./мин); АВ-блокада II или III степени; острая и хроническая сердечная недостаточность; тяжелая печеночная недостаточность; наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или мальабсорбция глюкозы/галактозы; период грудного вскармливания; возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по безопасности и эффективности); с осторожностью Атриовентрикулярная блокада I степени (риск развития брадикардии); заболевания коронарных артерий (в т.ч. ИБС, нестабильная стенокардия, ранний постинфарктный период); заболевания периферического кровообращения (в т.ч. перемежающаяся хромота, синдром Рейно); эпилепсия; болезнь Паркинсона; депрессия; глаукома; умеренная почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин, креатинин сыворотки 105-160 мкмоль/л); печеночная недостаточность; беременность.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи.

В большинстве случаев начальная доза препарата Физиотенз® составляет 0.2 мг/сут. Максимальная разовая доза составляет 0.4 мг. Максимальная суточная доза, которую следует разделить на 2 приема, составляет 0.6 мг.

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 - 0.2 мг/сут. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза может быть увеличена до максимальной 0.4 мг.

Пациентам с почечной недостаточностью рекомендуется осторожный подбор дозы, особенно в начале лечения. Начальная доза должна составлять 0.2 мг/сут. В случае необходимости и при хорошей переносимости суточная доза препарата может быть увеличена до максимальной - 0.4 мг для пациентов с умеренной почечной недостаточностью (КК более 30-60 мл/мин).

При необходимости применения моксонидина в дозе 0.3 мг/сут следует назначать лекарственные препараты других производителей в дозировке 0.3 мг.

Побочные действия

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, бессонница; нечасто - обморок*, повышенная возбудимость.

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

Со стороны скелетно-мышечной системы и соединительной ткани: 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: специфического антидота 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.

Особые указания

Во время лечения необходим регулярный контроль АД.

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

У пациентов пожилого возраста может быть повышен риск развития сердечно-сосудистых осложнений вследствие применения гипотензивных препаратов, поэтому терапию препаратом Физиотенз® следует начинать с минимальной дозы.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами 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.

Форма выпуска

таб, покр. пленочной оболочкой, 0.2 мг: 14, 28 или 98 шт.

Производитель

НОБЕЛ АЛМАТИНСКАЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ФАБРИКА (Казахстан) или ВЕРОФАРМ (Россия)

Условия выпуска из аптек

Отпускается по рецепту.

Срок годности препарата Физиотенз®

Срок годности - 2 года (для дозировки 0.2 мг). Срок годности - 3 года (для дозировки 0.4 мг).

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения препарата Физиотенз®

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.