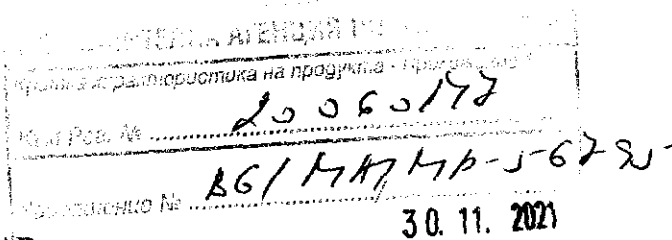


КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Моксогамма 0,4 mg филмирани таблетки
Moxogamma 0,4 mg film-coated tablets



2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 0,4 mg моксилидин (*Moxonidine*).

Помощно вещество с известно действие: Лактоза Монохидрат

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка

Външен вид на таблетките: Всички таблетки са кръгли, с диаметър около 6 mm.

Цветът на филмираните таблетки от 0,4 mg е тъмнорозов.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лека до среднотежка есенциална хипертония.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни

Лечението с моксилидин трябва да се започне с най-ниската дозировка. Това означава една дневна доза от 0,2 mg моксилидин сутрин. Ако терапевтичното действие е недостатъчно, дозата може да се увеличи до 0,4 mg, след три седмици. Тази доза може да се приема като една единична доза (сутрин) или да се назначи като две единични дози за деня (сутрин и вечер). Ако резултатите от лечението през следващите три седмици все още са незадоволителни, дозировката може да се повиши до максимум от 0,6 mg, при което тя трябва да се раздели на два приема – сутрин и вечер. Единичната доза от 0,4 mg моксилидин и дневната доза от 0,6 mg моксилидин не трябва да се превишават.

Педиатрична популация

Моксилидин не трябва да се прилага при деца и юноши на възраст до 16 години, тъй като не са налични достатъчно терапевтични данни за тази възрастова група.

Пациенти в старческа възраст:

В случай, че няма нарушение на бъбречната функция, важи дозировката препоръчвана за възрастни.

Нарушения на бъбречната функция:

При пациенти сумерено нарушение на бъбречната функция (гломерулна филтрация < 30 ml/min, но < 60 ml/min) не трябва да се превишава единичната доза от 0,2 mg и дневната доза от 0,4 mg моксилидин (вижте точка 4.4).



При пациенти с тежко нарушение на бъбречната функция (гломерулна филтрация < 30 ml/min), не трябва да се превишава единичната доза от 0,2 mg и дневната доза от 0,3 mg моксонидин (вижте точка 4.4).

Продължителност на лечението:

Лечението не трябва да се прекратява рязко, а постепенно, в продължение на период от две седмици (вижте също точка 4.4).

Начин на приложение:

Тъй като едновременният прием на храна не повлиява фармакокинетиката на моксонидин, то той може да се приема преди, по време или след хранене. Таблетките трябва да се поглъщат с достатъчно количество течност.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- Синдром на болния синусов възел;
- Брадикардия (под 50 удара/min в покой);
- Атриовентрикуларен блок II или III степен;
- Сърдечна недостатъчност.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

От постмаркетинговия опит са докладвани съобщения за случаи на AV блок в различна степен при пациенти лекувани с моксонидин. Изхождайки от тези съобщения не може да се изключи напълно ролята на моксонидин при забавяне на атриовентрикуларното състояние. Поради това се препоръчва внимание при лечение на пациенти с възможно предразположение за развитие на AV блок.

Когато моксонидин се прилага при пациенти с атриовентрикуларен блок I степен, трябва да се положат специални грижи и повишено внимание, за да се избегне брадикардия.

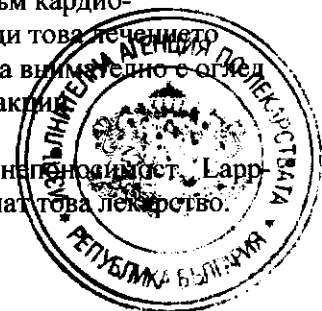
Когато моксонидин се прилага при пациенти с тежка коронарна болест на сърцето или нестабилна ангина пекторис, трябва да се поглежда много внимателно, тъй като терапевтичният опит при тази група пациенти е ограничен.

Препоръчва се повишено внимание, когато моксонидин се прилага при пациенти с бъбречни нарушения, тъй като моксонидинът се екскретира главно през бъбреците. При тези пациенти се препоръчва много внимателно титриране на дозата, особено в началото на терапията. Дозирането трябва да започне с 0,2 mg дневно и да бъде завишено до 0,4 mg дневно при пациенти с умерено нарушение на бъбречната функция (гломерулна филтрация >30 ml/min, но < 60 ml/min) и до максимум 0,3 mg дневно при пациенти с тежко нарушение на бъбречната функция (гломерулна филтрация < 30 ml/min), ако е клинично показано и има добра поносимост.

Ако моксонидин се използва в комбинация с бета-блокери и поради някаква причина лечението с двата медикамента трябва да се спре, първо трябва да се преустанови лечението с бета-блокери и след няколкодневен период – лечението с моксонидин. До сега не е наблюдаван рибанунд-ефект върху кръвното налягане след прекратяване на лечение с моксонидин. Въпреки това не е препоръчително рязко спиране на моксонидиновото лечение. Дозата трябва да се намалява постепенно в продължение на период от две седмици.

Популацията пациенти в старческа възраст може да бъде по-чувствителна към кардио-васкуларните ефекти на лекарствата, понижаващи кръвното налягане. Поради това лечението трябва да започва с най-ниската доза и покачването на дозата трябва да става внимателно, за да се избегнат сериозните усложнения, които може да се причинят от тези реакции.

Пациенти, които страдат от редки вродени проблеми, като галактозна непоносимост, Lapp-лактазен дефицит, или глюкозо-галактозна малабсорбция, не трябва да приемат това лекарство.



4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Едновременната употреба на моксонидин с други антихипертензивни средства има адитивен ефект.

Тъй като трицикличните антидепресанти могат да намалят ефективността на централно действащите антихипертензивни лекарствени продукти, не се препоръчва едновременна употреба на трициклични антидепресанти с моксонидин.

Моксонидинът може да потенцира ефекта на трицикличните антидепресанти (избягвайте едновременното им предписване), транквилизаторите, алкохола, седативните и сънотворни средства.

Моксонидинът умерено засилва нарушенията на когнитивните функции при пациенти, които едновременно приемат лоразепам. Седативният ефект на бензодиазепините може да се засили при едновременна употреба на моксонидин.

Моксонидинът се екскретира от организма чрез тубулна секреция. Не могат да бъдат изключени взаимодействия с други лекарствени продукти, които също се излъчват от организма чрез тубулна секреция.

Толазолинът може да намали дозозависимо действието на моксонидин.

4.6 Фертилитет, Бременност и кърмене

Бременност

Не са налице достатъчно данни за приложението на моксонидин при бременни жени. В експерименти с животни, при високи дози, е показан ембриотоксичен ефект (виж т. 5.3). Не е известно какъв е потенциалният риск при хора. Не се препоръчва употребата на моксонидин през бременността, освен в случай на безусловна необходимост.

Кърмене

Моксонидинът преминава в майчиното мляко и затова не трябва да се приема по време на кърмене. Ако провеждането на терапия с моксонидин е наложително, то кърменето по време на лечението трябва да се спре.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма данни, които сочат, че моксонидин повлиява способността за шофиране и работа с машини. Докладвани са случаи на сомнолентост и световъртеж. Това трябва да се има предвид при извършването на тези дейности.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Най-честите докладвани нежелани реакции при приемане на моксонидин включват сухота в устата, замаяност, астения и сомнолентност.

Тези симптоми често намаляват след първите няколко седмици от започване на лечението.

Честотата на нежеланите реакции е представена по-долу, подредени по системно-органна класификация (проявени по време на плацебо-контролирани клинични проучвания с n=886 пациенти, приемали моксонидин):

Много чести ($\geq 1/10$)

Чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$)

Нечести ($\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$)

Редки ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$)

Много редки ($< 1/10\ 000$)

С неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка)



MedDRA системно-органна класификация	Много чести	Чести	Нечести
Нарушения на метаболизма и храненето			Задържане на течности, Анорексия
Психични нарушения		Нарушения в мисловните процеси, Безсъние	Тревожност, Нервност, Загуба на либидо
Нарушения на нервната система		Главоболие, Замайност/световъртеж, Сомнолентност	Седиране, синкоп**, Парестезии по крайниците
Нарушения на очите			Чувство за сърбеж или парене в окото
Нарушения на ухото и лабиринта			Тинитус
Сърдечни нарушения			Брадикардия
Съдови нарушения		Вазодилатация	Хипотония* (включително ортостатична хипотония), , Нарушения на периферната циркулация
Стомашно-чревни нарушения	Сухота в устата	Диария, Гадене/Повръщане, Диспепсия*, Запек и други стомашно-чревни нарушения	Болка в паротироидните жлези
Нарушения на кожата и подкожната тъкан		Алергични реакции, включващи Обрив/пруритус	Ангиоедем
Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан		Болка в гърба	Болка в шията, Слабост в краката
Нарушения на възпроизводителната система и гърдата			Гинекомастия, Импотентност
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение		Астения	Отоци

* няма увеличение на честотата на проявление в сравнение с плацебо.

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез национална система за съобщаване:

България

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев“ № 8

1303 София

Тел.: +35 928903417

уебсайт: www.bda.bg



4.9 Предозиране

Симптоми при предозиране

В малкото на брой докладвани случаи на предозиране, доза от 19,6 mg е била погълната без фатален изход. Признаците и симптомите, които бяха докладвани, включват: главоболие, седиране, сомнолентност, хипотония, замаяност, астения, брадикардия, сухота в устата, повръщане, умора и болка в горната част на корема.

При тежки случаи на предозиране се препоръчва внимателно проследяване, особено занарушения в съзнанието и подтискане на дишането.

В допълнение, въз основа на някои проучвания върху животни с високи дози, е възможно да се проявят преходна хипертония, тахикардия и хипергликемия.

При случай на непреднамерено предозиране при 2-годишно дете е наблюдавано следното:

Не е известно какво количество моксонидин е погълнало детето. Максималната доза, която би могла да бъде погълната е 14 mg. Детето показва следните симптоми:

Седиране, кома, хипотония, миоза и диспнея. Стомашна промивка, инфузии с глюкоза, контролирано дишане и положение на покой са довели до пълно отзвучаване на симптомите в течение на 11 часа.

Въз основа на фармакодинамичните свойства на моксонидина могат да се очакват следните реакции при възрастни: седиране, хипотония, ортостатична дисрегулация, брадикардия, сухота в устата. В редки случаи могат да се наблюдават повръщане и парадоксално повишаване на кръвното налягане.

Лечение на предозирането

Не е познат специфичен антидот. В случай на хипотония може да се счита, че вливането на течности и допамин ще подкрепи циркулацията. Брадикардията може да бъде лекувана с атропин.

α -рецепторните антагонисти може да намалят или да премахнат парадоксалните хипертензивни ефекти от предозирането с моксонидин.

Лечението се състои от мерки за намаляване на резорбцията, като стомашна промивка (само ако поемането на моксонидина е станало съвсем скоро), прилагане на активен въглен и слабителни средства, и други симптоматични мерки.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

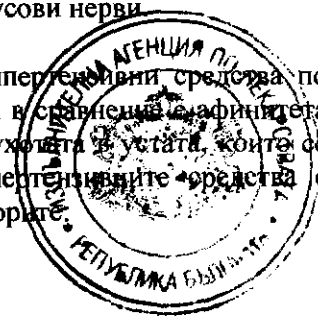
Фармакотерапевтична група: Антихипертензивни, антиадренергични средства с централно действие, агонисти на имидазолиновите рецептори.

АТС-код: C02AC05

При много животински модели моксонидинът е показал силно хипотензивно действие. Наличните експериментални данни сочат, че мястото на действие на моксонидин е в централната нервна система (ЦНС).

Моксонидинът се свързва селективно с I_1 -имидазолиновите рецептори в мозъчния ствол. Тези чувствителни към имидазолин рецептори се намират особено във вентролатералната *Medulla oblongata* - една област, която играе важна роля в централния контрол на симпатиковата нервна система. Влиянието на това взаимодействие с I_1 -имидазолиновите рецептори очевидно се изразява в намаляване активността на симпатиковите нерви. Това бе доказано при симпатиковите нерви на сърцето, висцералните и ренални симпатикови нерви.

Моксонидинът се различава от другите централнодействащи антихипертензивни средства по това, че афинитета му към централните α_2 -адренорецептори е оскъден в сравнение с афинитета му към I_1 -имидазолиновите рецептори. Приема се, че седирането и сухотата в устата, които се срещат най-често като нежелани лекарствени реакции на антихипертензивните средства с централно действие, са резултат от въздействие върху α_2 -адренорецепторите.



При хората, Моксогамма води до намаляване на системното съдово съпротивление и съответно, на артериалното кръвно налягане.

Средното систолно и диастолно артериално налягане, както в покой, така и при упражняване на усилия са снижени.

До този момент не са налични данни относно въздействието на моксонидина върху смъртността и сърдечносъдовата заболеваемост.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Моксонидинът се резорбира бързо след орално приложение. При хора, се резорбира около 90 % от пероралната доза. Приемът на храна не оказва влияние върху фармакокинетиката на моксонидин.

Няма ефект на първо преминаване през черния дроб и бионаличността възлиза на 88 %.

Разпределение

Само около 7 % от моксонидина се свързват с човешките плазмени протеини ($Vd_{ss} = 1,8 \pm 0,4$ l/kg). Максималните плазмени нива на моксонидин се достигат за 30-180 минути след приема на филмираната таблетка.

Биотрансформация

10-20 % от моксонидина се метаболизира: основно до 4,5-дехидромоксонидин, както и до аминометанамидинов дериват, чрез отваряне на имидазолиновия пръстен. Антихипертензивното действие на 4,5-дехидромоксонидина възлиза само на 1/10, а действието на аминометанамидиновия дериват е по-малко от 1/100 от ефекта на моксонидина.

Елиминиране

Моксонидинът и неговите метаболити почти напълно се излъчват чрез бъбреците. Повече от 90 % от дозата се елиминира ренално през първите 24 часа, докато около 1 % се изхвърлят чрез изпражненията. Кумулативната екскреция на моксонидин в непроменен вид възлиза на около 50-75 %.

Средните стойности на плазмения елиминационен полуживот са 2,2 - 2,3 часа, а на реналния елиминационен полуживот - 2,6 - 2,8 часа.

Фармакокинетика при пациенти в старческа възраст

Малките разлики между фармакокинетичните свойства на моксонидин при здрави пациенти в старческа възраст и при по-млади възрастни е малко вероятно да бъдат клинично значими. Тъй като няма натрупване на моксонидин, при условие, че бъбречната функция е нормална, адаптиране на дозата не е необходимо.

Фармакокинетика при пациенти с нарушение на бъбречната функция

При пациенти с умерено нарушение на бъбречната функция (гломерулна филтрация 30–60 ml/min) площта под кривата (AUC) е увеличена с 85 %, а клирънсът е намален с 52 %. При тези пациенти е необходимо адаптиране на дозата, като максималната дневна доза не трябва да е по-висока от 0,4 mg, а максималната единична доза – не по-висока от 0,2 mg.

При пациенти с тежко нарушение на бъбречната функция (гломерулна филтрация < 30 ml/min) клирънсът е намален с 68% и времето на полуживот е удължено до 7 часа. При тези пациенти е необходимо адаптиране на дозата, като максималната дневна доза не трябва да е по-висока от 0,3 mg, а максималната единична доза – не по-висока от 0,2 mg.

Фармакокинетика при деца

Не са провеждани фармакокинетични изследвания при деца.



5.3 Предклинични данни за безопасност

Неклиничните данни не показват особен риск за хора на базата на конвенционалните фармакологични проучвания за безопасност, токсичност при многократно прилагане, генотоксичност, карциногенен потенциал, репродуктивна токсичност и токсичност за развитието.

Продължителното перорално лечение на плъхове в продължение на 52 седмици (с дози от 0.12-4 mg / kg) и на кучета (с дози от 0.04-0.4 mg/kg) показва значителни ефекти на моксонидин само при най-високите дози. Незначителни нарушения на електролитния баланс (намаляване на натрий в кръвта и увеличение на калия, уреята и креатинина) са открити при най-високата доза при плъхове и повръщане и обилно слюноотделяне само за високата доза при кучета. В допълнение, леко повишение на теллото на черния дроб беше проявено и при двата вида за високите дози.

Изследванията върху репродуктивната токсичност не показват нито въздействие върху фертилитета, нито тератогенен потенциал.

Ембриотоксични ефекти са били наблюдавани при плъхове в дози по-високи от 3 mg/kg/дневно и при зайци, в дози по-високи от 0,7 mg/kg/дневно. Повишена честота на загуба на ембриона или плода и забавено развитие на плода бяха наблюдавани при плъхове в дози по-високи от 2 mg/kg/дневно и при зайци в дози по-високи от 0.7 mg/kg/дневно. При перинатално и постнатално изследване при плъхове, с приложени дози от над 1 mg/kg/дневно, е било повлияно развитието и жизнеността на потомството.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Ядро на таблетката

лактоза монохидрат
кросповидон
повидон К 25
магнезиев стеарат

Филмиращо покритие

хипромелоза
титанов диоксид (Е 171)
макрогол 400
червен железен диоксид (Е 172).

6.2 Несъвместимости

Не е приложимо.

6.3 Срок на годност

Моксогамма 0,4 mg филмирани таблетки опаковани в непрозрачни PVC/PVDC/Al-блистери - 3 години

За Моксогамма 0,4 mg филмирани таблетки, произвеждани от производител CENEXI SAS,

Франция и опаковани в прозрачни PVC/PVDC/Al-блистери – 2 години.

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 30°C.



6.5 Вид и съдържание на опаковката

PVC/PVDC/Al-блистери в опаковки по 30, 50 и 100 филмирани таблетки.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Wörwag Pharma GmbH & Co. KG
Flugfeld-Allee 24
71034 Böblingen
Германия

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20060147

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ / ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешване: 03 Април 2006
Дата на последно подновяване: 29 Октомври 2010

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

10/2021

