

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

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

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта Приложение 1	
Към Рег. №	20060177
Разрешение №	13-01-2025
BG/MA/MP	- 67471
Одобрение №	

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 0,4 mg моксонидин (*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.
Цвятът на филмираните таблетки от 0,4 mg е тъмнорозов.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Моксогамма е показан за лечение на хипертония.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни

Обичайната начална доза моксонидин е 0,2 mg дневно с максимална дневна доза от 0,6 mg, приета, като две отделни дози. Максималната еднократна доза, която може да се приема е 0,4 mg.

Дневната доза се определя съобразно индивидуалния отговор на пациента.

Моксонидин може да се приема с или без храна.

Лечението с моксонидин трябва да се започне с най-ниската дозировка. Това означава една дневна доза от 0,2 mg моксонидин сутрин. Ако терапевтичното действие е недостатъчно, дозата може да се увеличи до 0,4 mg моксонидин дневно, 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 максимума от 0,6 mg, при което тя трябва да се раздели на два приема – сутрин и вечер.

Единичната доза от 0,4 mg моксонидин и дневната доза от 0,6 mg моксонидин не трябва да се превишават.

Пациенти с бъбречно увреждане:

При пациенти с умерено до тежко бъбречно увреждане (гломерулна филтрация < 30 ml/min, но > 60 ml/min) началната доза е 0,2 mg дневно. Ако е необходимо и се понася добре, дозата може да



бъде увеличена до 0,4 mg дневно при пациенти с умерено бъбречно увреждане и до 0,3 mg дневно при пациенти с тежко бъбречно увреждане (вижте точка 4.4).

При пациенти на хемодиализа началната доза е 0,2 mg дневно. Ако е необходимо и се понася добре, дозата може да бъде увеличена до 0,4 mg дневно.

Педиатрична популация

Моксонидин не се препоръчва за употреба при деца и юноши под 18 - годишна възраст, поради липса на данни за ефикасност и безопасност.

4.3 Противопоказания

Моксогамма е противопоказан при пациенти с:

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

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Докладвани са постмаркетингови случаи на различни степени AV блок при пациенти лекувани с моксонидин. Въз основа на тези доклади, ролята на моксонидин в забавяне на атрио-вентрикуларното провеждане не може да се изключи напълно. Следователно се препоръчва повишено внимание при лечение на пациенти с възможна предразположеност за развитие на AV блок. Когато моксонидин се използва при пациенти с AV блок първа степен, трябва да се положат специални грижи, за избягване на брадикардия. Моксонидин не трябва да се използва при висока степен на AV блок (вж. точка 4.3).

Когато моксонидин се прилага при пациенти с тежка коронарна болест на сърцето или нестабилна стенокардия е необходимо повишено внимание поради факта, че има ограничен опит с тази пациентска популация.

Препоръчва се повишено внимание при приложение на моксонидин при пациенти с бъбречно увреждане, тъй като моксонидинът се екскретира предимно през бъбреците. При тези пациенти се препоръчва внимателно титриране на дозата, особено в началото на лечението.

Лечението трябва да започне с 0,2 mg дневно и да се повиши до максимум 0,4 mg дневно при пациенти с умерено бъбречно увреждане (гломерулна филтрация >30 ml/ min, но < 60 ml/ min) и максимално 0,3 mg дневно при пациенти с тежко бъбречно нарушение (гломерулна филтрация < 30 ml/min), ако е клинично показан и се понася добре.

Ако моксонидин се използва в комбинация с бета-блокери и поради някаква причина лечението с двата медикамента трябва да се преустанови, първо трябва да се спре приемът на бета-блокери, а след няколко дни – и този на моксонидин.

Досега не е наблюдаван рибанд ефект върху кръвното налягане след прекратяване на лечението с моксонидин. Въпреки това не се препоръчва рязкото спиране на терапията. Дозата трябва да се намалява постепенно в продължение на период от две седмици.

Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към галактоза, пълен лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция, не трябва да приемат това лекарство.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Едновременното приложение на моксонидин с други антихипертензивни средства може да даде адитивен ефект.



Тъй като трицикличните антидепресанти могат да намалят ефективността на централно-действащи антихипертензивни лекарствени средства, не се препоръчва трицикличните антидепресанти да се приемат едновременно с моксонидин.

Моксонидин може да засили седативния ефект на трицикличните антидепресанти (да се избягва едновременното предписване), транквиланти, алкохол, седативи и хипнотици.

Моксонидин умерено усилва нарушените когнитивни функции при пациенти, приемащи лоразепам. Моксонидин би могъл да засили седативния ефект на бензодиазепини при едновременен прием.

Моксонидин се екскретира от организма чрез тубуларната екскреция. Взаимодействието с други вещества, които също се екскретират по същия начин не може да бъде изключено.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Няма подходящи данни за използването на моксонидин при бременни жени. Изпитванията при животни показват ембриотоксичен ефект (виж т. 5.3). Потенциалният риск при хора е неизвестен. Моксонидин не трябва да се прилага по време на бременност, освен при категорична необходимост.

Кърмене

Моксонидин се отделя в майчиното мляко и следователно не трябва да се прилага по време на кърмене. Ако лечението с моксонидин е абсолютно необходимо, кърменето трябва да се спре.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са проведени проучвания върху способността за шофиране и работа с машини. Съобщава се за сънливост и замаяност. Това трябва да се има предвид при изпълнението на тези дейности.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Най-често съобщаваните нежелани реакции при прием на моксонидин включват сухота в устата, замаяност, обща отпадналост и сънливост. 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 съгласно честотата по-долу):

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-органни класове	Много чести ($\geq 1/10$)	Чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$)	Нечести ($\geq 1/1\,000$ до $< 1/100$)
Психични нарушения		Безсъние	Нервност
Нарушения на нервната система		Главоболие*, Замаяност/ световъртеж (вертиго), Сомнолентност (сънливост)	Синкоп
Нарушения на ухото и лабиринта			Тинитус

Сърдечни нарушения			Брадикардия
Съдови нарушения			Хипотония* (включително ортостатична хипотония)
Стомашно-чревни нарушения	Сухота в устата	Диария, гадене/повръщане, диспепсия	
Нарушения на кожата и подкожната тъкан		Кожен обрив, пруритус (сърбеж)	Ангиедем
Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан		Болки в гърба	Болки във врата
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение		Астения	Едем

* 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 9 28903417

уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Симптоми при предозиране

Има съобщения за някои случаи на предозиране, при погълната доза от 19,6 mg без фатален изход. Съобщените признаци и симптоми включват: главоболие, седация, сомнолентност, хипотония, замаяност, астения (обща отпадналост), брадикардия, сухота в устата, повръщане, умора и болка в горната част на корема.

В случаи на тежко предозиране се препоръчва внимателно наблюдение за нарушения в съзнанието и потискане на дишането.

Като допълнение, според данните от няколко изпитвания с високи дози върху животни, могат да се появят преходна хипертония, тахикардия и хипергликемия.

Лечение на предозирането

Не е известен специфичен антидот. В случаи на хипотония може да се обмисли поддържане на циркулацията чрез прилагане на течности и допамин. Брадикардията може да бъде лекувана с атропин.

α-рецепторните антагонисти биха могли да намалят или да премахнат парадоксалния хипертензивен ефект от предозирането с моксонидин.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Имидазолинови рецепторни антагонисти, моксонидин
АТС-код: C02AC05



Механизъм на действие

При различни животински модели моксонидин се проявява като ефикасно антихипертензивно средство. Налични експериментални данни показват, че мястото на анти-хипертензивното действие на моксонидин е централната нервна система (ЦНС). В мозъчния ствол моксонидинът стимулира избирателно I_1 -имидазолиновите рецептори. Тези чувствителни към имидазолин рецептори са съсредоточени във рostrалната вентро-латерална медула (*Medulla oblongata*), място критично за централния контрол на периферната симпатикусова нервна система. Стимулирането на I_1 -имидазолиновите рецептори води до намаляване на симпатикусовата активност и понижава кръвното налягане.

Фармакодинамични ефекти

Моксонидинът се различава от другите симпатиколитични антихипертензивни лекарствени средства по това, че проявява много слаб афинитет към известни α_2 -адренорецептори, в сравнение с I_1 -имидазолиновите рецептори. На този слаб афинитет към α_2 -адренорецепторите се дължи ниската степен на нежелани лекарствени реакции на седация и сухота в устата, при лечение с моксонидин.

Клинична ефикасност и безопасност

При хора, моксонидин води до намаляване на системната съдова резистентност и последващо понижение на артериалното налягане. Антихипертензивният ефект на моксонидин е демонстриран при двойно-слепи, плацебо-контролирани рандомизирани проучвания. Публикуваните данни показват, че при хипертонични пациенти с лява вентрикуларна хипертрофия (LVH), за едно и също намаляване на кръвното налягане, при употребата на ангиотензин II антагонист едновременно с моксонидин, се достига по-добра регресия на лявата вентрикуларна хипертрофия сравнено със свободната комбинация от тиазид и инхибитор на калциевите канали.

В терапевтично проучване с двумесечна продължителност моксонидин подобрява индекса на чувствителност на инсулина с 21% в сравнение с плацебо при пациенти със затлъстяване, инсулинова резистентност и умерена хипертония.

Педиатрична популация

Моксонидин не се препоръчва за употреба при деца и юноши под 18-годишна възраст, поради липса на данни за ефикасност и безопасност.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

След перорален прием моксонидинът се резорбира бързо (t_{max} около час) и почти напълно от горния гастроинтестинален тракт. Абсолютната му бионаличност е около 88 % показваща first-pass метаболизъм. Приемът на храна не оказва влияние върху фармакокинетиката на моксонидин.

Разпределение

Свързването с плазмените протеини, определено *in vitro*, е около 7,2 %.

Биотрансформация

В проби от човешка плазма се идентифицира само дехидрогениран моксонидин. Фармакодинамичната активност на дехидрогениран моксонидин е около 1/10 в сравнение с моксонидин.

Елиминиране

За 24 часов период седемдесет и осем процента от общата доза се екскретират в урината като моксонидин и 13 % - като дехидрогениран моксонидин. Други незначителни метаболити, които се намират в урината са 8% от дозата. Под 1 % се елиминира чрез изпражненията. Средните полуживоти на моксонидин и неговите метаболити са около 2,5 и 5 часа.

Фармакокинетика при пациенти с хипертония

При тази група пациенти не са наблюдавани фармакокинетични промени в сравнение с фармакокинетиката при здрави доброволци.



Фармакокинетика при пациенти в старческа възраст

Наблюдавани са промени във фармакокинетиката, свързани с възрастта и те най-вероятно са поради намалена метаболитна активност и/или леко по-висока бионаличност при пациенти в старческа възраст. Въпреки това тези разлики не са приети за клинично значими.

Фармакокинетика при деца

Тъй като моксонидин не се препоръчва при деца, не са провеждани проучвания в тази субпопулация.

Фармакокинетика при бъбречни увреждания

Елиминирането на моксонидин е значимо свързано с креатининовия клирънс. При пациенти с умерено увредена бъбречна функция (GFR 30–60 ml/min), равновесните плазмени концентрации и крайният полуживот са около 2 пъти и 1,5 пъти по-високи, съответно, в сравнение с пациенти с нормална бъбречна функция (GFR > 90 ml/min). При пациенти с тежко бъбречно увреждане (GFR < 30 ml/min) равновесните концентрации и крайният полуживот са около 3 пъти по-високи. Не е наблюдавано неочаквано натрупване на продукта след многократно дозиране. При пациенти с краен стадий на увреждане (GFR > 10 ml/min) на хемодиализа, AUC и крайният полуживот са съответно 6 пъти и 4 пъти по-високи, съответно, сравнено с хипертоници с нормална бъбречна функция. При пациенти с умерено бъбречно увреждане максималните плазмени концентрации на моксонидин са само 1,5–2 пъти по-високи.

Следователно, при пациенти с бъбречно увреждане дозата трябва да се титрира според индивидуалните изисквания.

Моксонидин се елиминира в малка степен при хемодиализа.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Неклиничните данни не показват особен риск за хора, базирайки се на конвенционални проучвания за безопасността, токсичност при многократен прием, карциногенен потенциал и репродуктивна токсичност.

Изследвания при животни са показали ембрио-токсични ефекти при токсични дози за майката.

Изследвания върху репродуктивната токсичност не са показали ефект върху фертилността и тератогенен потенциал.

Ембрио-токсикологични ефекти са наблюдавани при плъхове при дози от и над от 9 mg/kg/дневно и при зайци при дози над 0,7 mg/kg/дневно. При пери- и пост-натално проучване при плъхове е наблюдавано влияние върху развитието и жизнеността на поколенията при дози от и над 3 mg/kg/дневно.

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 Сепехі, 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 разрешаване: 03 Април 2006

Дата на последно подновяване: 29 Октомври 2010

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

11/2024

