

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

MoXynt 0,2 mg
MoXynt 0,3 mg
MoXynt 0,4 mg

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Moxonidín 0,2 mg; 0,3 mg alebo 0,4 mg v 1 filmom obalenej tablete.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Filmom obalená tableta (tableta).

MoXynt 0,2 mg

Svetloružové okrúhle bikonvexné filmom obalené tablety s vyrazeným označením „0,2“ na jednej strane.

MoXynt 0,3 mg

Ružové okrúhle bikonvexné filmom obalené tablety s vyrazeným označením „0,3“ na jednej strane.

MoXynt 0,4 mg

Staroružové okrúhle bikonvexné filmom obalené tablety s vyrazeným označením „0,4“ na jednej strane.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Liečba esenciálnej hypertenzie.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Obvyklá denná dávka je 0,2 mg moxonidínu. Maximálna denná dávka je 0,6 mg rozdelená do dvoch dávok. Maximálna jednotlivá dávka je 0,4 mg moxonidínu. Dávkovanie má byť prispôbené individuálnej potrebe pacienta.

Liečba sa obvykle začína dávkou 0,2 mg moxonidínu denne (1 tableta MoXyntu 0,2 mg ráno). Dávka sa má postupne upravovať v trojtýždenných intervaloch až do dosiahnutia optimálnej hodnoty krvného tlaku.

MoXynt 0,2 mg

Ak nie je účinok dávky 0,2 mg moxonidínu denne dostatočný, môže sa dávka po najmenej trojtýždennom intervale zvýšiť na 0,4 mg moxonidínu denne (2 tablety MoXyntu 0,2 mg ráno alebo 1 tableta MoXyntu 0,2 mg ráno a večer).

Ak je potrebná vyššia dávka, je možné užiť MoXynt 0,3 mg alebo MoXynt 0,4 mg tablety.

MoXynt 0,3 mg

V prípade dávky 0,3 mg moxonidínu denne sa užíva 1 tableta MoXyntu 0,3 mg ráno.

Ak nie je účinok dávky 0,3 mg moxonidínu denne dostatočný, môže sa dávka po najmenej trojtýždennom intervale zvýšiť na 0,6 mg moxonidínu denne (1 tableta MoXyntu 0,3 mg ráno a večer).

Ak je potrebná nižšia alebo vyššia dávka, je možné užiť MoXynt 0,2 mg alebo MoXynt 0,4 mg tablety.

MoXynt 0,4 mg

V prípade dávky 0,4 mg moxonidínu denne sa užíva 1 tableta MoXyntu 0,4 mg ráno.

Ak je potrebná nižšia dávka, je možné užiť MoXynt 0,2 mg alebo MoXynt 0,3 mg tablety.

Pacienti s poruchou funkcie obličiek

U pacientov so stredne ťažkou až ťažkou poruchou funkcie obličiek je začiatková dávka 0,2 mg denne.

Ak je to nevyhnutné a dobre tolerované, môže sa dávka zvýšiť na 0,4 mg moxonidínu denne u pacientov so stredne ťažkou poruchou funkcie obličiek a na 0,3 mg moxonidínu denne u pacientov s ťažkou poruchou funkcie obličiek (pozri časť 4.4).

U pacientov podstupujúcich hemodialýzu je začiatková dávka 0,2 mg denne. Ak je to nevyhnutné a dobre tolerované, môže sa denná dávka zvýšiť na 0,4 mg moxonidínu.

Pediatrická populácia

Liek je určený dospelým pacientom. Bezpečnosť a účinnosť užívania moxonidínu u detí a dospievajúcich nebola stanovená.

Spôsob podávania

Tablety sa užívajú pred jedlom, s jedlom alebo po jedle.

4.3 Kontraindikácie

- Precitlivenosť na moxonidín alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok, uvedených v časti 6.1;
- syndróm chorého sínusu;
- bradykardia (pod 50 tepov/min v pokoji);
- AV blok 2. alebo 3. stupňa;
- srdcová nedostatočnosť.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

U pacientov užívajúcich moxonidín boli počas sledovania po uvedení lieku na trh hlásené prípady rôznych stupňov AV blokad. Na základe týchto hlásení sa úloha moxonidínu v predĺžení átrioventrikulárneho vedenia nedá úplne vylúčiť. Pri liečbe pacientov s možnou predispozíciou pre vznik AV blokády je preto potrebná zvýšená opatrnosť.

Ak užívajú moxonidín pacienti s AV blokadou 1. stupňa, musí im byť venovaná zvláštna starostlivosť, aby sa predišlo bradykardii. Moxonidín sa nesmie užívať pri AV blokádach vyššieho stupňa (pozri časť 4.3).

Ak užívajú moxonidín pacienti s ťažkým koronárnym arteriálnym ochorením alebo nestabilnou angínou pectoris, musí im byť venovaná zvláštna starostlivosť kvôli obmedzeným skúsenostiam v patientskej populácii.

Pozornosť sa odporúča pri podávaní moxonidínu u pacientov s poškodením funkcie obličiek pretože moxonidín sa vylučuje hlavne obličkami. U týchto pacientov je hlavne na začiatku liečby potrebné opatrne vytitrovať dávku. Dávkovanie sa má začať s 0,2 mg denne a dávka môže byť zvýšená na maximálne 0,4 mg denne u pacientov so stredne ťažkým poškodením funkcie obličiek (GFR > 30 ml/min, ale < 60 ml/min) a na maximálne 0,3 mg denne u pacientov s ťažkým poškodením funkcie obličiek (GFR < 30 ml/min), ak je liečba klinicky indikovaná a dobre tolerovaná.

Ak sa moxonidín užíva v kombinácii s β -blokátorom a liečba musí byť prerušená, β -blokátor sa vysadí ako prvý a moxonidín potom po niekoľkých dňoch.

Doteraz nebol pozorovaný „rebound“ účinok na krvný tlak po prerušení liečby moxonidínom. Jednako sa neodporúča náhle ukončenie liečby, namiesto toho sa má dávka znižovať postupne počas dvoch týždňov.

Starší pacienti môžu byť citlivejší na kardiovaskulárne účinky liekov znižujúcich krvný tlak. Liečba sa má preto začať najnižšou dávkou a dávka sa má zvyšovať s opatrnosťou, aby sa zabránilo možným závažným následkom týchto účinkov.

Liek obsahuje laktózu. Liek sa nemá podávať pacientom so zriedkavými dedičnými poruchami: intoleranciou galaktózy, (laponského) deficitu laktázy alebo s poruchou absorpcie glukózy a galaktózy.

4.5 Liekové a iné interakcie

Súbežné podávanie s inými antihypertenzívami: podávanie moxonidínu je bezpečné s tiazidovými diuretikami a blokátormi kalciových kanálov. Súbežné podávanie týchto a iných antihypertenzív zvyšuje hypotenzívne pôsobenie moxonidínu.

Tricyklické antidepresíva môžu znižovať účinnosť centrálnych antihypertenzív, preto sa neodporúča súbežné podávanie tricyklických antidepresív s moxonidínom. Moxonidín môže zosilniť sedatívny účinok tricyklických antidepresív (vyhnúť sa súbežnému predpisaniu), trankvilizérov, alkoholu, sedatív a hypnotík.

Moxonidín mierne zhoršuje kognitívne funkcie u jedincov užívajúcich lorazepam. Moxonidín môže pri súbežnom užívaní zvýšiť sedatívny účinok benzodiazepínov.

Moxonidín sa vylučuje tubulárnou sekréciou. Nemožno vylúčiť interakcie s inými liekmi, ktoré sa vylučujú tubulárnou sekréciou.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Nie sú k dispozícii dostatočné údaje o použití moxonidínu u gravidných žien. Štúdie na zvieratách preukázali embryotoxické účinky (pozri časť 5.3). Nie je známe potenciálne riziko u ľudí. Moxonidín má byť užívaný počas gravidity iba v nevyhnutných prípadoch.

Dojčenie

Moxonidín sa vylučuje do materského mlieka, nemá sa preto užívať počas dojčenia. Ak je liečba moxonidínom nevyhnutná, dojčenie sa má ukončiť.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Neuskutočnili sa žiadne štúdie o účinkoch na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje. Bola hlásená ospalosť a závraty. Toto je potrebné zobrať do úvahy pri užívaní MoXyntu.

4.8 Nežiaduce účinky

Na začiatku liečby sa najčastejšie môže objaviť sucho v ústach, bolesť hlavy, závraty, celková slabosť, pocit slabosti a ospalosť. Vo väčšine prípadov však tieto účinky ustúpia po niekoľkých týždňoch liečby.

Nežiaduce účinky podľa organových systémov:

Orgánový systém podľa databázy MedDRA	Veľmi časté	Časté	Menej časté
---------------------------------------	-------------	-------	-------------

	$\geq 1/10$	$\geq 1/100$ až $< 1/10$	$\geq 1/1\,000$ až $< 1/100$
Poruchy srdca a srdcovej činnosti			bradykardia
Poruchy ucha a labyrintu			tinnitus
Poruchy nervového systému		bolesť hlavy*, závrat, vertigo, somnolencia	synkopa*
Poruchy ciev			hypotenzia* (vrátane ortostatickej)
Poruchy gastrointestinálneho traktu	suchosť v ústach	hnačka, nauzea, vracanie, dyspepsia	
Poruchy kože a podkožného tkaniva		vyrážka, svrbenie	angioedém
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania		asténia	edém
Poruchy kostrovej a svalovej sústavy a spojivového tkaniva		bolesť chrbta	bolesť krku
Psychické poruchy		nespavosť	nervozita

* V porovnaní s placebom nebola vyššia frekvencia

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na [národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V](#).

4.9 Predávkovanie

Symptómy

V niekoľkých prípadoch predávkovania, ktoré boli oznámené, dávka až do 19,6 mg užitá naraz nemala za následok smrť. Oznámené znaky a príznaky zahŕňali: bolesti hlavy, útlm, ospalosť, hypotenziu, závraty, asténiu, bradykardiu, suchosť v ústach, vracanie, únavu a abdominálne bolesti.

V prípade závažného predávkovania sa odporúča starostlivo sledovať poruchy vedomia a útlm dýchania.

Okrem toho, vychádzajúc zo štúdií vysokých dávok u zvierat, sa môže vyskytnúť dočasná hypertenzia, tachykardia a hyperglykémia.

Liečba

Moxonidín nemá špecifické antidotum. V prípade hypotenzie sa môžu na podporu cirkulácie doplniť tekutiny a zvážiť podanie dopamínu. Bradykardia sa lieči atropínom.

Antagonisty α -receptorov môžu znížiť alebo zrušiť paradoxný hypertenzný účinok predávkovania moxonidínom.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: antihypertenzíva, ATC kód: CO2AC05

Údaje z experimentov na rôznych zvieracích modeloch preukázali antihypertenzný účinok moxonidínu. Dostupné experimentálne údaje ukazujú, že moxonidín je centrálné pôsobiace

antihypertenzívum. Mechanizmus spočíva v selektívnej väzbe moxonidínu na I₁-imidazolínové receptory, ktoré sú lokalizované v mozgovom kmeni, a to v rostrálnej ventrálnu-laterálnej oblasti predĺženej miechy. Táto oblasť je považovaná za centrum pre reguláciu periférneho sympatikového nervového systému. Stimulácia imidazolínových receptorov sa prejaví znížením aktivity sympatiku a nižším krvným tlakom.

Väzbou moxonidínu na I₁-imidazolínové receptory sa znižuje aktivita sympatiku (preukázané na sympatikových nervových zakončeníach kardiálnych, intestinálnych a renálnych). Zníženie aktivity sympatiku vedie ku zníženiu systémovej periférnej rezistencie ciev a následne ku zníženiu krvného tlaku.

Moxonidín sa líši od ostatných dostupných, centrálne pôsobiacich antihypertenzív predovšetkým nižšou afinitou k centrálnym α_2 -adrenoreceptorom v porovnaní s I₁-imidazolínovými receptormi. Nežiaduce účinky centrálne pôsobiacich antihypertenzív, ako napr. sucho v ústach a únava, sú spôsobené interakciou s α_2 -adrenoreceptormi. Z dôvodu vysokej selektivity moxonidínu pre imidazolínové receptory majú tieto nežiaduce účinky (sucho v ústach a útlm), v prípade moxonidínu, nízky výskyt.

U ľudí moxonidín vedie k redukcii systémovej cievnej rezistencie a následkom toho k zníženiu krvného tlaku. Antihypertenzívny účinok moxonidínu bol potvrdený v dvojito zaslepených placebom kontrolovaných randomizovaných štúdiách. Publikované údaje preukázali, že u hypertonikov s hypertrofiou ľavej komory (*left ventricular hypertrophy*; LVH) sa, pri porovnateľnej redukcii krvného tlaku, pri užívaní antagonistu angiotenzínu II (*angiotensin II antagonist*, AIIA) súběžne s moxonidínom dosiahlo zlepšenie regresie LVH v porovnaní s voľnou kombináciou tiazidu s blokátorom kalciového kanála.

Pri terapeutických skúškach trvajúcich dva mesiace, moxonidín zvýšil index citlivosti na inzulín o 21 % v porovnaní s placebom u obéznych a pacientov s inzulínovou rezistenciou s miernou hypertenziou.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia

Po perorálnom podaní je moxonidín rýchlo a skoro úplne vstrebaný z hornej časti gastrointestinálneho traktu ($t_{\max}$ asi 1 h).

Biologická dostupnosť je približne 88 %, nepodlieha významne efektu prvého prechodu pečeňou.

Prijem potravy nemá vplyv na farmakokinetiku.

Distribúcia

Väzba na plazmatické bielkoviny zistená *in vitro* bola okolo 7,2 %.

Metabolizmus

V plazme bol pozitívne zistený len dehydrogenovaný moxonidín. Farmakodynamická účinnosť dehydrogenovaného moxonidínu je asi 1/10 v porovnaní s moxonidínom.

Eliminácia

Počas 24 hodín 78 % celkovej dávky bolo v nezmenenej forme vylúčených močom a 13 % bolo vylúčených ako dehydrogenovaný moxonidín. Iné menej významné metabolity v moči tvorili asi 8 %. Menej ako 1 % bolo vylúčené stolicou.

Vylučovanie moxonidínu a jeho metabolitov je rýchle (polčas eliminácie asi 2,5 až 5 hodín).

Farmakokinetika u pacientov s hypertenziou

Žiadne farmakokinetické zmeny neboli pozorované v porovnaní so súborom zdravých dobrovoľníkov.

Farmakokinetika u starších osôb

Boli pozorované vekom podmienené zmeny farmakokinetiky. Pravdepodobne sú spôsobené zníženou metabolickou aktivitou a/alebo slabo zvýšenou biologickou dostupnosťou. Tieto farmakokinetické rozdiely nie sú klinicky významné.

Farmakokinetika u detí

Podanie moxonidínu sa u detí neodporúča. Neboli robené žiadne farmakokinetické štúdie u detí.

Farmakokinetika pri poškodení funkcie obličiek

Vylučovanie moxonidínu signifikantne koreluje s klírensom kreatinínu. U pacientov so stredne ťažkým poškodením funkcie obličiek (GFR 30-60 ml/min) ustálené plazmatické koncentrácie a polčas eliminácie sú približne 2-krát a 1,5-krát vyššie v porovnaní s hypertonikmi s normálnou funkciou obličiek (GFR viac ako 90 ml/min). U pacientov s ťažkým poškodením funkcie obličiek (GFR menej ako 30 ml/min) ustálená hladina plazmatickej koncentrácie a polčas eliminácie sú 3-krát vyššie.

U týchto pacientov po viacnásobnom podaní nedochádzalo ku akumulácii moxonidínu. V konečných štádiách renálnej insuficiencie u hemodialyzovaných pacientov (GFR menej ako 10 ml/min) plazmatická koncentrácia a polčas eliminácie sú 6-krát a 4-krát vyššie. U pacientov so stredne ťažkým poškodením funkcie obličiek maximálne plazmatické koncentrácie moxonidínu sú len 1,5 až 2-krát vyššie vo všetkých skupinách.

U pacientov s poškodením funkcie obličiek má byť dávkovanie individuálne prispôbené.

Moxonidín sa v malom množstve eliminuje hemodialýzou.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Predklinické údaje získané na základe obvyklých farmakologických štúdií bezpečnosti, toxicity po opakovanom podaní, genotoxicity, karcinogénneho potenciálu, reprodukčnej toxicity a vývinu neodhalili žiadne osobitné riziko pre ľudí.

Štúdie reprodukčnej toxicity neodhalili žiadne účinky na fertilitu a žiadny teratogénny potenciál. Embryotoxický účinok bol pozorovaný u potkanov pri dávke 9 mg/kg/deň a vyššej a u králikov pri dávke viac ako 0,7 mg/kg/deň. V perinatálnej a postnatálnej štúdii s potkanmi bol ovplyvnený vývin ako aj životaschopnosť mláďat pri dávke 3 mg/kg/deň a vyššej.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

monohydrát laktózy
povidón
krospovidón
stearát horečnatý
hypromelóza
etylcelulóza
makrogol 6000
mastenec
červený oxid železitý, (E 172)
oxid titaničitý (E 171)

6.2 Inkompatibility

Nie sú známe.

6.3 Čas použiteľnosti

MoXynt 0,2 mg: 2 roky
MoXynt 0,3 mg: 3 roky
MoXynt 0,4 mg: 3 roky

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

MoXynt 0,2 mg: Uchovávať pri teplote 15 °C – 25 °C.

MoXynt 0,3 mg a MoXynt 0,4 mg: Uchovávať pri teplote do 30 °C.

Uchovávať v pôvodnom obale.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

PVC/PVDC/Al alebo PVC/Al blister, písomná informácia pre používateľa, papierová škatuľa.

Veľkosť balenia: 30 tabliet, 98 tabliet

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Žiadne zvláštne požiadavky.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII:

BIOMIN a.s.

Potočná 1/1

919 43 Cífer

Slovensko

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLA

MoXynt 0,2 mg: 58/0372/03-S

MoXynt 0,3 mg: 58/0373/03-S

MoXynt 0,4 mg: 58/0374/03-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE / PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 19. december 2003

Dátum posledného predĺženia registrácie: 06. august 2009

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

12/2025