Алмонт



Код АТХ:

- R03DC03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Монтелукаст

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru

Форма выпуска:

Таблетки жевательные, 4 мг, 5 мг.

Таблетки, 4 мг: по 10 или 14 табл. в алюминий/алюминиевом блистере. По 3 бл. (по 10 табл.), по 2 или 7 бл. (по 14 табл.) помещают в картонную пачку.

Таблетки, 5мг: по 10 или 7 табл. в алюминий/алюминиевом блистере. По 3 бл. (по 10 табл.), по 4 или 14 бл. (по 7 табл.) помещают в картонную пачку.

Состав:

Таблетки жевательные	1 табл.
активное вещество:	
монтелукаст	4/5 мг
(в виде монтелукаста натрия — 4,16/5,2 мг)	

вспомогательные вещества: маннитол — 160,96/201,2 мг; МКЦ — 52,8/66 мг; гипролоза — 7,2/9 мг; кроскармеллоза натрия — 7,2/9 мг; краситель *Pigment Blend PB-24880* (лактозы моногидрат — 3,6/4,5 мг, краситель железа оксид красный — 0,4/0,5 мг) — 4/5 мг; магния стеарат — 2,4/3 мг; аспартам — 1,2/1,5 мг; ароматизатор вишневый (*Silarom Cherry Flavour* 1219813182) — 0,08/0,1 мг	

Описание:

Таблетки жевательные, 4 мг: овальные, двояковыпуклые, розового цвета, с вкраплениями и гравировкой «М4» на одной стороне.

Таблетки жевательные, 5 мг: круглые, двояковыпуклые, розового цвета, с вкраплениями и гравировкой «М5» на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — противоастматическое, блокирующее лейкотриеновые рецепторы.

Фармакодинамика

Цистеинил-ЛТ (LTC4, LTD4, LTE4) — сильные провоспалительные эйкозаноиды, которые высвобождаются из разных клеток, включая тучные клетки и эозинофилы. Эти важные проастматические медиаторы связываются с цистеинил-лейкотриеновыми рецепторами (CysLT), присутствующими в дыхательных путях человека и отвечающими за реакцию бронхоспазма, выделение мокроты, проницаемость сосудов и увеличение количества эозинофилов.

Монелукаст — активное при пероральном приеме соединение, которое обладает большим сродством и селективностью к $CysLT_1$-рецепторам. Монелукаст в дозе менее 5 мг купирует бронхоспазм, индуцированный ингаляцией LTD4. Бронходилатирующий эффект наблюдается в течение 2 ч после перорального применения. Бронходилатирующий эффект $бета_2$-адреномиметиков усиливается при приеме монелукаста. Монелукаст подавляет как раннюю, так и позднюю стадии бронхоспазма, вызванного воздействием антигенов. Монелукаст снижает число эозинофилов в периферической крови у взрослых и детей, а также значительно снижает число эозинофилов в дыхательных путях. У пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте, получающих ингаляционные и/или пероральные ГКС, добавление к терапии монелукаста обеспечивает лучший контроль заболевания.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь монелукаст быстро и почти полностью всасывается. У взрослых пациентов после приема таблеток жевательных в дозе 5 мг натощак C_{max} в плазме крови достигается через 2 ч. Среднее значение биодоступности - 73%, эта величина снижается до 63% при приеме монелукаста с пищей. После приема таблеток жевательных в дозе 4 мг натощак у пациентов в возрасте от 2 до 5 лет C_{max} достигается через 2 ч. Среднее значение C_{max} у данной группы пациентов на 66% выше, а среднее значение C_{min} ниже, чем у взрослых при приеме таблеток, покрытых пленочной оболочкой, в дозе 10 мг. У взрослых пациентов после приема натощак таблеток, покрытых пленочной оболочкой, в дозе 10 мг среднее значение C_{max} в плазме крови достигается через 3 ч. Среднее значение биодоступности - 64%; при приеме внутрь одновременно с пищей значения биодоступности и C_{max} не нарушаются.

Распределение

Связывание монелукаста с белками плазмы крови составляет более 99%. V_d в равновесном состоянии в среднем составляет 8-11 л. Доклинические исследования выявили минимальное проникновение монелукаста через ГЭБ. Через 24 ч после приема концентрация монелукаста минимальна и в других тканях.

Метаболизм

Монелукаст активно метаболизируется в печени. При применении в терапевтических дозах C_{ss} метаболитов монелукаста в плазме крови у взрослых и детей не определяется.

Исследования in vitro показали, что в процессе метаболизма монелукаста участвуют изоферменты цитохрома Р450 (3А4, 2А6 и 2С9), при этом в терапевтических концентрациях монелукаст не ингибирует изоферменты цитохрома

P450: 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6. Метаболиты обладают незначительным терапевтическим эффектом монтелукаста.

Выведение

$T_{1/2}$ монтелукаста у молодых здоровых взрослых добровольцев составляет от 2.7 до 5.5 ч. Плазменный клиренс монтелукаста у здоровых взрослых добровольцев составляет в среднем 45 мл/мин. После перорального приема монтелукаста 86% общего количества выводится через кишечник в течение 5 дней и менее 0.2% - почками, что наряду с данными о его биодоступности подтверждает выведение монтелукаста и его метаболитов преимущественно с желчью.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетика монтелукаста у женщин и мужчин одинакова.

У пациентов пожилого возраста или пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести не требуется коррекции режима дозирования монтелукаста.

Фармакокинетика монтелукаста у пациентов с почечной недостаточностью не оценивалась. Поскольку монтелукаст и его метаболиты не выводятся почками, коррекции дозы у этой категории пациентов не требуется. Данных о характере фармакокинетики монтелукаста у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) нет.

При приеме монтелукаста в высоких дозах (в 20 и 60 раз превышающих рекомендуемые дозы для взрослых) наблюдается снижение концентрации теофиллина в плазме крови. При приеме монтелукаста в рекомендуемых дозах (10 мг 1 раз/сут) данного эффекта не наблюдается.

Показания к применению:

Профилактика и длительное лечение бронхиальной астмы, включая:

— предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания у детей в возрасте от 2 лет и старше (для таблеток жевательных 4 мг и 5 мг) и у взрослых и подростков с 15 лет (для таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 10 мг);

— лечение бронхиальной астмы у детей в возрасте от 6 лет и старше (для таблеток жевательных 4 мг и 5 мг) и у взрослых и подростков с 15 лет (для таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 10 мг) с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте;

— предупреждение бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой, у детей в возрасте от 2 лет и старше (для таблеток жевательных 4 мг и 5 мг) и у взрослых и подростков с 15 лет (для таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 10 мг).

Облегчение симптомов сезонного и круглогодичного аллергического ринита у детей в возрасте от 2 лет (для таблеток жевательных 4 мг и 5 мг) и у взрослых и подростков с 15 лет (для таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 10 мг).

Относится к болезням:

- Аллергия
- Бронхит
- Бронхоспазм
- Ринит

Противопоказания:

— гиперчувствительность к активному веществу или какому-либо вспомогательному компоненту препарата;

— детский возраст до 2 лет (для таблеток жевательных 4 мг);

— детский возраст до 6 лет (для таблеток жевательных 5 мг);

— детский возраст до 15 лет (для таблеток 10 мг);

— редкие наследственные заболевания, такие как непереносимость галактозы, недостаточность лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— фенилкетонурия (для таблеток жевательных), т.к. таблетки содержат аспартам.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь.

Жевательные таблетки принимают за 1 ч до или через 2 ч после еды; таблетку следует разжевать.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, принимают внутрь, независимо от приема пищи, не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости.

Взрослым и подросткам с 15 лет назначают 10 мг (1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой) 1 раз/сут.

При *бронхиальной астме или бронхиальной астме и аллергическом рините* **детям в возрасте от 2 до 6 лет** назначают по 1 жевательной таблетке 4 мг 1 раз/сут вечером; **детям в возрасте от 6 до 14 лет** - по 1 жевательной таблетке 5 мг 1 раз/сут вечером.

При *аллергическом рините* **детям в возрасте от 2 до 6 лет** назначают по 1 жевательной таблетке 4 мг 1 раз/сут, **детям в возрасте от 6 до 14 лет -** по 1 жевательной таблетке 5 мг 1 раз/сут в индивидуальном режиме в зависимости от времени наибольшего обострения симптомов.

Не требуется коррекции дозы внутри данных возрастных групп.

Прием препарата детьми осуществляется под наблюдением взрослых.

Терапевтический эффект препарата Алмонт, позволяющий контролировать симптомы астмы, достигается в течение суток после приема. Пациенту рекомендуется продолжать прием препарата, как в периоды контролируемого течения бронхиальной астмы, так и в период обострения бронхиальной астмы.

Пациентам с почечной недостаточностью и пациентам с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести специального подбора дозы не требуется. Нет данных о применении монтелукаста у пациентов с **тяжелыми нарушениями функции печени**.

Пациентам пожилого возраста коррекция дозы не требуется.

Не требуется коррекции дозы в зависимости от пола пациента.

Побочное действие:

Инфекционные и паразитарные заболевания: инфекции верхних дыхательных путей.

Со стороны системы крови и лимфатической системы: повышение склонности к кровотечениям, тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, в т.ч. анафилаксия, эозинофильная инфильтрация печени.

Со стороны психики: патологические сновидения (включая ночные кошмары), галлюцинации, бессонница, сомнамбулизм, раздражительность, тревога, беспокойство, ажитация (включая агрессивное поведение или враждебность), тремор, депрессия, дезориентация, суицидальные мысли и поведение (суицидальность).

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, сонливость, парестезия/гипестезии, судороги.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ощущение сердцебиения.

Со стороны дыхательной системы: носовое кровотечение.

Со стороны ЖКТ: диарея, сухость во рту, диспепсия, тошнота, рвота, боль в животе, панкреатит.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: увеличение активности АЛТ и АСТ, гепатит (включая холестатические, гепатоцеллюлярные и смешанные поражения печени).

Со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, склонность к появлению гематом, крапивница, кожный зуд, сыпь, узловатая эритема, многоформная эритема.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия, включая мышечные судороги.

Прочие: астения/усталость, недомогание, отеки, пирексия, жажда; в очень редких случаях во время лечения монтелукастом сообщалось о развитии синдрома Черджа-Стросса.

Передозировка:

Симптомы передозировки препарата у пациентов с хронической бронхиальной астмой при применении в дозе, превышающей 200 мг/сут, в течение 22 недель и в дозе 900 мг/сут в течение 1 недели, не выявлены.

Имеются сообщения об острой передозировке монтелукаста (при приеме не менее 1 г/сут) в постмаркетинговом периоде и в клинических исследованиях у взрослых и детей. Клинические и лабораторные данные при этом свидетельствуют о соответствии профиля безопасности препарата у детей, взрослых и пациентов пожилого возраста. Наиболее частыми симптомами были чувство жажды, сонливость, рвота, психомоторное возбуждение, головная боль и боль в животе.

Лечение: проведение симптоматической терапии. Данные о возможности выведения монтелукаста путем перитонеального диализа или гемодиализа отсутствуют.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Алмонт при беременности возможно в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Решение об отмене грудного вскармливания на период применения препарата Алмонт принимается на основании оценки о предполагаемой пользе для матери и потенциального риска для ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

У пациентов, одновременно получавших фенобарбитал, AUC монтелукаста уменьшалась примерно на 40%, однако коррекция режима дозирования у таких пациентов не требуется.

Поскольку монтелукаст метаболизируется изоферментом CYP3A4, следует соблюдать осторожность, особенно у детей, если монтелукаст одновременно применяется с индукторами изофермента CYP3A4, такими как фенитоин, фенобарбитал и рифампицин.

Монтелукаст можно назначать вместе с другими лекарственными средствами, традиционно применяемыми для профилактики и длительного лечения бронхиальной астмы и/или аллергического ринита.

Монтелукаст в рекомендуемой терапевтической дозе не оказывал клинически значимого эффекта на фармакокинетику следующих препаратов: теофиллин, преднизон, преднизолон, пероральные контрацептивы (этинилэстрадиол/норэтинодрел 35/1), терфенадин, дигоксин и варфарин.

В исследованиях in vitro установлено, что монтелукаст является сильным ингибитором изофермента CYP2C8. Однако при исследовании лекарственного взаимодействия in vivo монтелукаста и росиглитазона (маркерный субстрат, представитель препаратов, первично метаболизирующихся изоферментом CYP2C8) не получено подтверждения ингибирования монтелукастом изофермента CYP2C8. Таким образом, в клинической практике не предполагается влияние монтелукаста на CYP2C8-опосредованный метаболизм ряда лекарственных препаратов, в т.ч. паклитаксела, росиглитазона, репаглинида.

Исследования in vitro показали, что монтелукаст является субстратом изофермента CYP2C8, и в меньшей степени изоферментов CYP2C9 и CYP3A4. Данные клинического исследования лекарственного взаимодействия в отношении монтелукаста и гемфиброзила (ингибитора как CYP2C8, так и CYP2C9) демонстрируют, что гемфиброзил повышает эффект системного воздействия монтелукаста в 4.4 раза. Совместный прием итраконазола, сильного ингибитора изофермента CYP3A4, вместе с гемфиброзилом и монтелукастом не приводил к дополнительному повышению эффекта системного воздействия монтелукаста. Влияние гемфиброзила на системное воздействие монтелукаста не может считаться клинически значимым на основании данных по безопасности при применении в дозах, превышающих одобренную дозу 10 мг для взрослых пациентов (например, 200 мг/сут для взрослых пациентов в течение 22 недель и до 900 мг/сут для пациентов, принимающих препарат в течение примерно 1 недели, не наблюдалось клинически значимых отрицательных эффектов). Таким образом, при совместном приеме вместе с гемфиброзилом коррекции дозы монтелукаста не требуется. По результатам исследований in vitro не предполагается клинически значимого лекарственного взаимодействия с другими известными ингибиторами изофермента CYP2C8 (например, с триметопримом). Кроме того, совместный прием монтелукаста с одним только итраконазолом не приводил к существенному повышению эффекта системного воздействия монтелукаста.

Комбинированное лечение с бронходилататорами

Препарат Алмонт является обоснованным дополнением к монотерапии бронходилататорами, если последние не обеспечивают адекватного контроля бронхиальной астмы. По достижении терапевтического эффекта от лечения препаратом Алмонт можно начать постепенное снижение дозы бронходилататоров.

Комбинированное лечение с ингаляционными ГКС

Лечение препаратом Алмонт обеспечивает дополнительный терапевтический эффект пациентам, применяющим

ингаляционные ГКС. По достижении стабилизации состояния можно начать постепенное снижение дозы ГКС под наблюдением врача. В некоторых случаях допустима полная отмена ингаляционных ГКС, однако резкая замена ингаляционных ГКС на препарат Алмонт не рекомендуется.

Особые указания и меры предосторожности:

Алмонт не рекомендуется назначать для лечения острых приступов бронхиальной астмы. Пациентам с бронхиальной астмой рекомендуется всегда иметь при себе препараты экстренной помощи. При наступлении острого приступа следует применять ингаляционные бета$_2$-адреномиметики короткого действия. Пациенты должны как можно быстрее проконсультироваться со своим врачом, если им необходимо большее количество ингаляций бета$_2$-адреномиметиков короткого действия, чем обычно.

Не следует резко заменять препарат Алмонт терапией ингаляционными или пероральными ГКС. Отсутствуют данные, доказывающие возможность снижения дозы пероральных ГКС на фоне одновременного приема монтелукаста.

В редких случаях у пациентов, которые получают противоастматические препараты, включая монтелукаст, может развиться системная эозинофилия, что иногда сопровождается клиническими признаками васкулита, так называемый синдром Черджа-Стросса, состояние, которое устраняют с помощью приема системных ГКС. Эти случаи, как правило, ассоциируются с уменьшением дозы или отменой терапии пероральными ГКС. Нельзя исключить или установить вероятность того, что антагонисты лейкотриеновых рецепторов могут ассоциироваться с развитием синдрома Черджа-Стросса. Поэтому врачей необходимо предупредить о возможности возникновения эозинофилии, васкулярной сыпи, увеличения выраженности легочных симптомов, сердечных осложнений и/или невропатии у пациентов. Пациентам, у которых развивались вышеупомянутые симптомы, необходимо пройти повторное обследование, а схему их лечения пересмотреть. Лечение препаратом Алмонт не приводит к профилактике развития бронхоспазма у пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте при применении ацетилсалициловой кислоты и других НПВС.

Препарат Алмонт в форме жевательных таблеток 4 мг и 5 мг содержит аспартам - источник фенилаланина. Данный препарат может причинить вред здоровью пациентам с фенилкетонурией.

Алмонт содержит лактозы моногидрат, поэтому не следует принимать препарат пациентам с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, недостаточность лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Как правило, монтелукаст не влияет на способность к управлению транспортными средствами или работу с другими механизмами, но очень редко у некоторых пациентов отмечали сонливость и головокружение. При появлении этих признаков пациентам не рекомендуется управлять транспортными средствами и заниматься другими видами деятельности, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения:

Таблетки жевательные следует хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 30°C.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, следует хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25°C.

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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