

## Монтеласт



### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)  
[Госреестр](#) [Википедия](#)  
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

**Таблетки жевательные** овальные, двояковыпуклые, розового цвета с вкраплениями и с гравировкой "M4" на одной стороне.

|   |               |
|---|---------------|
|   | <b>1 таб.</b> |
| монтелукаст натрия                        | 4.16 мг,      |
| что соответствует содержанию монтелукаста | 4 мг          |

**Вспомогательные вещества:** маннитол - 160.96 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 52.8 мг, гипролоза - 7.2 мг, кроскармеллоза натрия - 7.2 мг, краситель Pigment Blend PB-24880 (лактозы моногидрат - 3.6 мг, краситель железа оксид красный - 0.4 мг) - 4 мг, магния стеарат - 2.6 мг, аспартам - 1.2 мг, ароматизатор вишневый (Silarom Cherry Flavour 1219813182) - 0.08 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

14 шт. - блистеры (7) - пачки картонные.

**Таблетки жевательные** круглые, двояковыпуклые, розового цвета с вкраплениями и с гравировкой "M5" на одной стороне.

|   |               |
|---|---------------|
|   | <b>1 таб.</b> |
| монтелукаст натрия                        | 5.2 мг,       |
| что соответствует содержанию монтелукаста | 5 мг          |

**Вспомогательные вещества:** маннитол - 201.2 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 66 мг, гипролоза - 9 мг, кроскармеллоза натрия - 9 мг, краситель Pigment Blend PB-24880 (лактозы моногидрат - 4.5 мг, краситель железа оксид красный - 0.5 мг) - 5 мг, магния стеарат - 3 мг, аспартам - 1.5 мг, ароматизатор вишневый (Silarom Cherry Flavour 1219813182) - 0.1 мг.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

7 шт. - блистеры (14) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

## Фармакологические свойства:

### Фармакодинамика

Антагонист лейкотриеновых рецепторов. Цистеинил-лейкотриены ( $LTC_4$ ,  $LTD_4$ ,  $LTE_4$ ) - сильные провоспалительные эйкозаноиды, которые высвобождаются из разных клеток, включая тучные клетки и эозинофилы. Эти важные проастрматические 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.

Монтелукаст - активное при пероральном приеме соединение, которое обладает высоким сродством и селективностью к CysLT<sub>1</sub>-рецепторам. Монтелукаст в дозе менее 5 мг купирует бронхоспазм, обусловленный индукцией LTD<sub>4</sub>. Бронходилатирующий эффект наблюдается в течение 2 ч после перорального применения. Бронходилатирующий эффект бета<sub>2</sub>-адреномиметиков усиливается при приеме монтелукаста. Монтелукаст подавляет как раннюю, так и позднюю стадии бронхоспазма, вызванного воздействием антигенов. Монтелукаст 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 монтелукаста обеспечивает лучший контроль заболевания.

### Фармакокинетика

#### Всасывание

После приема внутрь монтелукаст 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 часа. Среднее значение биодоступности - 73%, эта величина снижается до 63% при приеме монтелукаста 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.

#### Распределение

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

#### Метаболизм

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

Исследования *in vitro* показали, что в процессе метаболизма монтелукаста участвуют изоферменты CYP3A4, CYP2A6 и CYP2C9, при этом в терапевтических концентрациях монтелукаст не ингибирует изоферменты CYP3A4, CYP2C9, CYP1A2, CYP2A6, CYP2C19 и CYP2D6. 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% от 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 рекомендованные дозы для взрослых) наблюдается снижение концентрации теофиллина в плазме крови. При приеме монтелукаста в рекомендованных дозах 10 мг 1 раз/сут данного эффекта не наблюдается.

## Показания к применению:

Профилактика и длительное лечение бронхиальной астмы у детей, включая:

- предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания (для детей от 2 лет и старше);
- лечение бронхиальной астмы у пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте (для детей от 6 лет и старше);
- предупреждение бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой (для детей от 2 лет и старше).

Облегчение симптомов сезонного и круглогодичного аллергического ринита у детей с 2 лет.

## Относится к болезням:

- [Аллергия](#)
- [Бронхит](#)
- [Бронхоспазм](#)
- [Ринит](#)

## Противопоказания:

- повышенная чувствительность к активному или какому-либо вспомогательному веществу препарата;
- пациенты с редкими наследственными заболеваниями: непереносимость галактозы, недостаточность лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- фенилкетонурия (содержит аспартам);
- детский возраст до 2 лет (для дозировки 4 мг);
- детский возраст до 6 лет (для дозировки 5 мг).

## Способ применения и дозы:

Принимают внутрь за 1 ч до или через 2 ч после еды. Таблетку следует разжевать.

Прием препарата детьми осуществляется под наблюдением взрослых.

*Бронхиальная астма или бронхиальная астма и аллергический ринит*

Для **детей в возрасте от 2 до 6 лет** - 1 жевательная таблетка 4 мг 1 раз/сут вечером.

Для **детей в возрасте от 6 до 14 лет** - 1 жевательная таблетка 5 мг 1 раз/сут вечером.

*Аллергический ринит*

Для **детей в возрасте от 2 до 6 лет** - 1 жевательная таблетка 4 мг 1 раз/сут и для **детей в возрасте от 6 до 14 лет** - 1 жевательная таблетка в дозе 5 мг 1 раз/сут в индивидуальном режиме в зависимости от времени наибольшего обострения симптомов.

Не требуется коррекции дозы внутри данных возрастных групп.

Терапевтический эффект препарата Монтеласт, 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**.

Не требуется коррекции дозы в зависимости от пола пациента.

Для лечения пациентов других возрастных групп доступна иная лекарственная форма и доза препарата — таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг.

## Побочное действие:

*Инфекционные и паразитарные заболевания:* инфекции верхних дыхательных путей.

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

*Со стороны иммунной системы:* реакции повышенной чувствительности, в т.ч. анафилаксия, эозинофильная инфильтрация печени.

*Со стороны психики:* патологические сновидения (включая ночные кошмары), галлюцинации, бессонница, сомнамбулизм, раздражительность, тревога, беспокойство, агитация (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 пищеварительной системы:* 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 и соединительной ткани:* артралгия, миалгия, включая мышечные судороги.

*Общие расстройства:* астения/усталость, недомогание, отеки, пирексия, жажда.

*Прочие:* в очень редких случаях во время лечения монтелукастом сообщалось о развитии синдрома Чардж-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 Монтеласт при беременности возможно в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

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

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

У пациентов, одновременно получавших фенобарбитал, АУС монтелукаста уменьшалась примерно на 40%, однако коррекции 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 Монтеласт является обоснованным дополнением к монотерапии бронходилататорами, если последние не обеспечивают адекватного контроля бронхиальной астмы. По достижении терапевтического эффекта от лечения препаратом Монтеласт можно начать постепенное снижение дозы бронходилататоров.

#### *Комбинированное лечение с ингаляционными ГКС*

Лечение препаратом Монтеласт 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 Монтеласт не рекомендуется.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

Монтеласт 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<sub>2</sub>-адреномиметики короткого действия. Пациенты должны как можно быстрее проконсультироваться со своим врачом, если им необходимо большее количество ингаляций бета<sub>2</sub>-адреномиметиков короткого действия, чем обычно.

Не следует резко заменять препарат Монтеласт 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 антиастматические препараты, включая монтелукаст, может развиваться системная эозинофилия, что иногда сопровождается клиническими признаками васкулита, так называемый синдром Чардж-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 Чардж-Стросса. Поэтому врачей необходимо предупредить о возможности возникновения эозинофилии, васкулярной сыпи, увеличения выраженности лёгочных 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 Монтеласт не приводит к профилактике развития бронхоспазма у пациентов, с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте, при применении ацетилсалициловой кислоты и других НПВС.

Препарат Монтеласт содержит аспартам, источник фенилаланина. Данный препарат может причинить вред здоровью пациентам с фенилкетонурией.

Препарат содержит лактозу моногидрат и его не следует принимать пациентам с редкими наследственными заболеваниями: непереносимость галактозы, недостаточность лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

## **Монтеласт**

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

---

### *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:**

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 30°C.

### **Срок годности:**

3 года.

### **Условия отпуска в аптеке:**

По рецепту.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Montelast>