Монтеласт



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

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

	1 таб.
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.

	1 таб.
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 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.

Монтелукаст - активное при пероральном приеме соединение, которое обладает высоким сродством и селективностью к $CysLT_1$ -рецепторам. Монтелукаст в дозе менее 5 мг купирует бронхоспазм, обусловленный индукцией LTD_4. Бронходилатирующий эффект наблюдается в течение 2 ч после перорального применения. Бронходилатирующий эффект бета$_2$-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, 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 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, AUC 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.

Монелукаст 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 монелукаст является сильным ингибитором изофермента CYP2C8. Однако при исследовании лекарственного взаимодействия in vivo монелукаста и росиглитазона (маркерный субстрат, представитель препаратов, первично метаболизирующихся изоферментом CYP2C8) не получено подтверждения ингибирования монелукастом изофермента CYP2C8. Таким образом, в клинической практике не предполагается влияние монелукаста на CYP2C8-опосредованный метаболизм ряда лекарственных препаратов, в т.ч. паклитаксела, росиглитазона, репаглинида.

Исследования in vitro показали, что монелукаст является субстратом изофермента CYP2C8, и в меньшей степени изоферментов CYP2C9 и CYP3A4. Данные клинического исследования лекарственного взаимодействия в отношении монелукаста и гемфиброзила (ингибитора как CYP2C8, так и CYP2C9) демонстрируют, что гемфиброзил повышает эффект системного воздействия монелукаста в 4.4 раза. Совместный прием итраконазола, сильного ингибитора изофермента CYP3A4, вместе с гемфиброзилом и монелукастом не приводил к дополнительному повышению эффекта системного воздействия монелукаста. Влияние гемфиброзила на системное воздействие монелукаста 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 монелукаста 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 монелукаста с одним только итраконазолом не приводил к существенному повышению эффекта системного воздействия монелукаста.

Комбинированное лечение с бронходилататорами

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

Комбинированное лечение с ингаляционными ГКС

Лечение препаратом Монеласт 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 Монеласт не рекомендуется

Особые указания и меры предосторожности:

Монеласт 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 Монеласт терапией ингаляционными или пероральными ГКС. Отсутствуют данные, доказывающие возможность снижения дозы пероральных ГКС на фоне одновременного приема монелукаста.

В редких случаях у пациентов, которые получают антиастматические препараты, включая монелукаст, может развиться 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 Монеласт не приводит к профилактике развития бронхоспазма у пациентов, с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте, при применении ацетилсалициловой кислоты и других НПВС.

Препарат Монеласт 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.

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