Симплаер



Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антагонист лейкотриеновых рецепторов. Монтелукаст селективно ингибирует CysLT1-рецепторы цистеиниловых лейкотриенов (LTC4, LTD4, LTE4) эпителия дыхательных путей, а также предотвращает у больных бронхиальной астмой бронхоспазм, обусловленный вдыханием цистеинилового лейкотриена LTD_4. Дозы 5 мг достаточно для купирования бронхоспазма, индуцированного LTD_4. Применение монтелукаста в дозах, превышающих 10 мг 1 раз/сут, не повышает эффективность препарата.

Монтелукаст вызывает бронходилатацию в течение 2 ч после приема внутрь и может дополнять бронходилатацию, вызванную бета$_2$-адреномиметиками.

Фармакокинетика

После приема внутрь монтелукаст быстро и практически полностью всасывается из ЖКТ. У взрослых при приеме в дозе 5-10 мг C_{max} в плазме крови достигается через 2-3 ч. Биодоступность при приеме внутрь составляет 64-73%.

Связывание монтелукаста с белками плазмы составляет более 99%. V_d в среднем составляет 8-11 л.

При однократном приеме в дозе 10 мг 1 раз/сут наблюдается умеренная (около 14%) кумуляция активного вещества в плазме.

Монтелукаст активно метаболизируется в печени. При применении в терапевтических дозах концентрация метаболитов монтелукаста в плазме в равновесном состоянии у взрослых и детей не определяется.

Предполагается, что в процессе метаболизма монтелукаста участвуют изоферменты CYP3A4 и CYP2C9, при этом в терапевтических концентрациях монтелукаст не ингибирует изоферменты CYP3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6.

$T_{1/2}$ монтелукаста у молодых здоровых взрослых составляет от 2.7 до 5.5 ч. Клиренс монтелукаста составляет у здоровых взрослых в среднем 45 мл/мин. После перорального приема монтелукаста 86% выводится с калом в течение 5 дней и менее 0.2% - с мочой, что подтверждает то, что монтелукаст и его метаболиты выводятся почти исключительно с желчью.

Фармакокинетика монтелукаста сохраняет практически линейный характер при приеме внутрь в дозах более 50 мг.

Показания к применению:

Профилактика и длительное лечение бронхиальной астмы, включая: предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания; лечение бронхиальной астмы у пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте; предупреждение бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой.

Купирование дневных и ночных симптомов сезонных аллергических ринитов.

Относится к болезням:

- Аллергический ринит
- Аллергия
- Бронхит
- Бронхоспазм
- Ринит

Противопоказания:

Детский возраст до 2 лет, повышенная чувствительность к монтелукасту.

Способ применения и дозы:

Дозу устанавливают индивидуально, в зависимости от возраста, показаний и применяемой лекарственной формы. Принимают внутрь в дозе 4-10 мг 1 раз/сут.

Терапевтическое действие монтелукаста на показатели, отражающие течение бронхиальной астмы, развивается в течение первого дня. Следует продолжать прием монтелукаста как в период достижения контроля симптомов бронхиальной астмы, так и в период обострения заболевания.

Монтелукст можно добавлять к лечению бронходилататорами и ингаляционными ГКС.

Побочное действие:

Со стороны свертывающей системы крови: повышение склонности к кровотечениям.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, в т.ч. анафилаксия; очень редко (<1/10 000) - эозинофильная инфильтрация печени.

Со стороны психики: ажитация (в т.ч. агрессивное поведение или враждебность), тревожность, депрессия, дезориентация, патологические сновидения, галлюцинации, бессонница, раздражительность, беспокойство, сомнамбулизм, суицидальные мысли и поведение (суицидальность), тремор.

Со стороны нервной системы: головокружение, сонливость, парестезия/гипестезия; очень редко (< 1/10 000) - судороги.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия.

Со стороны дыхательной системы: носовые кровотечения, инфекции верхних дыхательных путей.

Со стороны пищеварительной системы: диарея, диспепсия, тошнота, рвота, панкреатит, увеличение активности АЛТ и АСТ в крови; очень редко (<1/10 000) - гепатит (включая холестатические, гепатоцеллюлярные и смешанные поражения печени).

Со стороны кожи и подкожных тканей: склонность к формированию гематом, узловатая эритема, многоформная эритема, зуд, сыпь.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, крапивница.

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

Со стороны организма в целом: астения (слабость)/усталость, отеки, пирексия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований безопасности применения монтелукаста при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) не проводилось. Неизвестно, выделяется ли монтелукаст с грудным молоком.

Монтелукаст следует применять при беременности и в период грудного вскармливания только в тех случаях, когда

ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с фенобарбиталом AUC монтелукаста уменьшалась примерно на 40% (коррекция режима монтелукаста не требуется).

В исследованиях in vitro установлено, что монтелукаст ингибирует изофермент CYP2C8, однако при исследовании лекарственного взаимодействия in vivo монтелукаста и росиглитазона (метаболизируется с участием изофермента CYP2C8) не получено подтверждения ингибирования монтелукастом изофермента CYP2C8. Поэтому в клинической практике не предполагается влияние монтелукаста на CYP2C8-опосредованный метаболизм ряда лекарственных препаратов, в т.ч. паклитаксела, росиглитазона, репаглинида.

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

Применение монтелукаста обеспечивает дополнительный терапевтический эффект у пациентов, получающих 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 кортикостероидов на монтелукаст не рекомендуется.

Особые указания и меры предосторожности:

Эффективность монтелукаста для приема внутрь в отношении лечения острых приступов бронхиальной астмы не установлена. Поэтому монтелукаст для приема внутрь не рекомендуется применять для лечения острых приступов бронхиальной астмы. Пациентам должны быть даны инструкции всегда иметь при себе препараты экстренной помощи для купирования приступов бронхиальной астмы (ингаляционные бета$_2$-агонисты короткого действия).

Не следует прекращать прием монтелукаста в период обострения астмы и необходимости применения для купирования приступов препаратов экстренной помощи (ингаляционных бета$_2$-агонистов короткого действия).

Пациенты с подтвержденной аллергией к ацетилсалициловой кислоте и другим НПВС не должны принимать эти препараты в период лечения монтелукастом, поскольку монтелукаст, улучшая дыхательную функцию у пациентов с аллергической бронхиальной астмой, тем не менее, не может полностью предотвратить вызванную у них НПВС бронхоконстрикцию.

Дозу ингаляционных ГКС, применяемых одновременно с монтелукастом, можно постепенно снижать под наблюдением врача, однако резкой замены ингаляционных или пероральных ГКС монтелукастом проводить нельзя.

У пациентов, принимавших монтелукаст, были описаны психоневрологические нарушения. Учитывая, что эти симптомы могли быть вызваны другими факторами, неизвестно, связаны ли они с приемом монтелукаста. Врачу необходимо обсудить данные побочные эффекты с пациентами и/или их родителями/опекунами. Пациентам и/или их опекунам необходимо объяснить, что в случае появления подобных симптомов необходимо сообщить об этом лечащему врачу.

Уменьшение дозы системных ГКС у пациентов, получающих противоастматические средства, включая блокаторы лейкотриеновых рецепторов, сопровождалось в редких случаях появлением одной или нескольких следующих реакций: эозинофилия, сыпи, ухудшение легочных симптомов, кардиологические осложнения и/или невропатия, иногда диагностируемая как синдром Чарджа-Стросс, системный эозинофильный васкулит. Хотя причинно-следственной связи этих побочных реакций с терапией антагонистами лейкотриеновых рецепторов не было установлено, при снижении дозы системных ГКС у пациентов, получающих монтелукаст, необходимо соблюдать осторожность и проводить со ответствующее клиническое наблюдение.

Использование в педиатрии

Не следует применять монтелукаст у детей младше 2 лет.

У детей старше 2 лет монтелукаст следует применять в соответствующей лекарственной форме.

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