

## Синглон



### Код АТХ:

- [R03DC03](#)

### Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Монтелукаст](#)

### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

**Таблетки жевательные** бледно-желтого цвета, чечевицеобразной формы, двояковыпуклые, с ярко выраженным вишневым запахом, допускаются вкрапления более темного цвета; на одной стороне гравировка "R13".

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

*Вспомогательные вещества:* маннитол - 161.34 мг, целлюлоза микрокристаллическая 101 - 52.8 мг, гипролоза - 7.2 мг, кроскармеллоза натрия - 7.2 мг, ароматизатор вишневый (порошок) - 3.6 мг, аспартам - 1.2 мг, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.1 мг, магния стеарат - 2.4 мг.

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

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

7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

**Таблетки жевательные** бледно-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с ярко выраженным вишневым запахом, допускаются вкрапления более темного цвета; на одной стороне гравировка "R14" (цифра "14" расположена под буквой "R").

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

*Вспомогательные вещества:* маннитол - 201.675 мг, целлюлоза микрокристаллическая 101 - 66 мг, гипролоза - 9 мг, кроскармеллоза натрия - 9 мг, ароматизатор вишневый (порошок) - 4.5 мг, аспартам - 1.5 мг, краситель железа оксид

желтый (E172) - 0.125 мг, магния стеарат - 3 мг.

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

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

7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

## Фармакотерапевтическая группа:

- [Интермедианты](#)

## Фармакологические свойства:

### Фармакодинамика

Монтелукаст обладает высокой степенью сродства и избирательностью связывания с рецепторами цистеиниловых лейкотриенов. Применение монтелукаста ингибирует раннюю и позднюю фазы бронхоспазма. Монтелукаст уменьшает бронхоспазм даже в весьма низких дозах (5 мг). Бронходилатация продолжается в течение 2-х часов после приема препарата внутрь. Эффект бронходилатации, вызванный бета-адреномиметиком, усиливает действие, вызванное монтелукастом. Монтелукаст снижает количество эозинофилов в периферической крови и в дыхательных путях (в мокроте) детей и взрослых и улучшает контроль над клиническим течением бронхиальной астмы.

У взрослых пациентов монтелукаст существенно улучшает утренний объем форсированного выдоха (ОФВ<sub>1</sub>) за 1 секунду. Монтелукаст усиливает клиническое воздействие ингаляционных ГКС. Монтелукаст уменьшает выраженность дневных (включая кашель, хрипы, затруднение дыхания и ограничение деятельности) и ночных симптомов бронхиальной астмы. Монтелукаст снижает потребность в бета-адреномиметиках и ГКС, применяемых при необходимости (при ухудшении состояния). У пациентов, получающих монтелукаст, отмечается более длительная ремиссия, чем у пациентов, его не принимавших. Терапевтический эффект отмечается уже после приема первой дозы. У детей в возрасте от 2 лет с бронхиальной астмой легкой степени тяжести и эпизодическими обострениями монтелукаст существенно снижает частоту эпизодов обострений бронхиальной астмы и улучшает дыхательную функцию. Ослабляется бронхоспазм, возникающий на фоне физической нагрузки. У пациентов с бронхиальной астмой, чувствительных к ацетилсалициловой кислоте и принимающих сопутствующую терапию ингаляционными и/или пероральными глюкокортикостероидами, лечение монтелукастом приводит к существенному улучшению контроля симптомов бронхиальной астмы.

### Фармакокинетика

#### Всасывание

$C_{\max}$  в плазме крови достигалась у детей в возрасте от 2 до 5 лет через 2 ч после приема натощак в дозе 4 мг. Средняя  $C_{\max}$  была на 66% выше, в то время как средняя  $C_{\min}$  была ниже, чем у взрослых после приема в дозе 10 мг.

У взрослых пациентов при приеме натощак в дозе 5 мг  $C_{\max}$  достигается через 2 ч после приема. В среднем биодоступность составляет 73%; она снижается до 63% при приеме препарата после обычного приема пищи.

#### Распределение

Монтелукаст более чем на 99% связывается с белками плазмы.  $V_d$  монтелукаста в равновесном состоянии составляет в среднем 8-11 л. Плохо проникает через ГЭБ.

#### Метаболизм

Монтелукаст подвергается активному метаболизму в печени. В равновесном состоянии после приема в терапевтических дозах концентрации метаболитов монтелукаста в плазме у детей и взрослых не определяются.

Изоферменты цитохрома 3A4, 2A6 и 2C9 вовлечены в метаболизм монтелукаста, но в терапевтических концентрациях монтелукаст не ингибирует изоферменты цитохрома 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6. Метаболиты монтелукаста обладают незначительной фармакологической активностью.

#### Выведение

Клиренс монтелукаста из плазмы у здоровых взрослых людей составляет в среднем 45 мл/мин. После приема внутрь меченого монтелукаста 86% препарата выводилось в течение 5 дней через кишечник и менее 0.2% - почками. Это свидетельствует о том, что препарат и его метаболиты выводятся преимущественно с желчью.  $T_{1/2}$  монтелукаста у пациентов молодого возраста составляет от 2.7 до 5.5 ч. Фармакокинетика монтелукаста сохраняет практически линейный характер при приеме внутрь доз свыше 50 мг.

#### Фармакокинетика у особых групп пациентов

Исследования у пациентов с почечной недостаточностью не проводились. Поскольку монтелукаст и его метаболиты выводятся с желчью, коррекция дозы у пациентов с почечной недостаточностью не требуется.

Данные о фармакокинетике монтелукаста у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью (оценка > 9 по шкале Чайлд-Пью) отсутствуют.

## Показания к применению:

Детям 2-5 лет (таблетки жевательные 4 мг) и детям 6-14 лет (таблетки жевательные 5 мг) для:

— длительного лечения и профилактики бронхиальной астмы (в т.ч. предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания);

— лечения бронхиальной астмы у пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте и профилактики бронхоспазма физического усилия.

## Относится к болезням:

- [Бронхит](#)
- [Бронхоспазм](#)

## Противопоказания:

— тяжелые нарушения функции печени;

— фенилкетонурия (препарат содержит аспартам);

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

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

— повышенная чувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ.

С *осторожностью* следует применять препарат одновременно с индукторами CYP3A4.

## Способ применения и дозы:

**Детям в возрасте 2-5 лет** препарат Синглон назначают по 1 таб. жевательной 4 мг ежедневно вечером.

**Детям в возрасте 6-14 лет** препарат Синглон назначают по 1 таб. жевательной 5 мг ежедневно вечером.

Препарат Синглон следует принимать за 1 ч до или через 2 ч после приема пищи. Коррекции дозы в пределах данных возрастных групп не требуется.

Безопасность и эффективность таблеток жевательных 4 мг для **детей в возрасте до 2 лет** не установлена.

### *Общие рекомендации*

Терапевтический эффект препарата Синглон развивается в течение одних суток после приема. Пациенту следует продолжать прием препарата Синглон как в периоды контролируемого течения бронхиальной астмы, так и в периоды ухудшения течения заболевания.

У пациентов с **почечной недостаточностью, легкой или умеренной степенью печеночной недостаточности** коррекции дозы не требуется. Данные для пациентов с **тяжелой степенью печеночной недостаточности** отсутствуют.

Доза препарата не зависит от пола пациента.

*Терапия препаратом Синглон в комбинации с другими препаратами для лечения бронхиальной астмы*

Если препарат Синглон назначен на фоне приема ингаляционных ГКС, то не следует резко заменять ингаляционные ГКС препаратом Синглон.

## Побочное действие:

Ниже приведены неблагоприятные реакции по системно-органным классам в соответствии с классификацией MedDRA, которые часто (>1/100, <1/10) наблюдались у пациентов, получавших монтелукаст.

Для таблеток жевательных 5 мг:

*Со стороны нервной системы:* головная боль.

Для таблеток жевательных 4 мг:

*Со стороны ЖКТ:* боль в области живота.

*Общие расстройства:* жажда.

В ходе постмаркетингового исследования были выявлены следующие неблагоприятные проявления:

*Со стороны крови и лимфатической системы:* повышенная склонность к кровотечениям.

*Со стороны иммунной системы:* реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию; эозинофильные инфильтраты печени.

*Со стороны психики:* нарушения сна, включая ночные кошмары, галлюцинации, психомоторная гиперактивность (включая раздражительность, беспокойство, возбуждение, включая агрессивное поведение, и тремор), депрессия и бессонница, суицидальные мысли и суицидальное поведение.

*Со стороны нервной системы:* сонливость, головокружение, парестезия/гиперестезия, судорожные припадки.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* учащенное сердцебиение.

*Со стороны ЖКТ:* диарея, сухость во рту, диспепсия, тошнота и рвота.

*Со стороны гепатобилиарной системы:* повышение активности печеночных трансаминаз в сыворотке крови (АСТ, АЛТ), холестатический гепатит, панкреатит.

*Со стороны кожи и подкожной клетчатки:* ангионевротический отек, появление экхимозов, крапивница, зуд, сыпь, узловатая эритема, склонность к формированию кровоподтеков.

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

*Общие расстройства:* астения/усталость, дискомфорт, отек.

В очень редких случаях на фоне приема монтелукаста у пациентов с бронхиальной астмой развивается синдром Чарга-Стросса.

## **Передозировка:**

Отсутствует специфическая информация по лечению передозировки препаратом Синглон. В клинических исследованиях взрослые пациенты с бронхиальной астмой принимали препарат в дозах до 200 мг/сут в течение 22 недель, а в кратковременных исследованиях - в дозах до 900 мг/сут примерно в течение недели, без клинически значимых неблагоприятных проявлений.

Наблюдались случаи острой передозировки монтелукаста у взрослых и детей при приеме в дозе выше 1000 мг (примерно 61 мг/кг для ребенка в возрасте 42 месяцев). Полученные клинические и лабораторные результаты согласовывались с профилем безопасности для взрослых и пациентов детского возраста. В большинстве отчетов по передозировке отсутствовали указания на неблагоприятные проявления. Наиболее часто встречающиеся неблагоприятные проявления соответствовали профилю безопасности монтелукаста и включали боль в животе, сонливость, жажду, головную боль, рвоту, психомоторную гиперактивность, мидриаз.

Отсутствуют данные о возможности выведения монтелукаста при перитонеальном диализе или гемодиализе.

## **Применение при беременности и кормлении грудью:**

Препарат применяется у детей.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

Препарат Синглон может назначаться совместно с другими препаратами, традиционно назначаемыми для профилактики и длительного лечения бронхиальной астмы. В рекомендованных дозах препарат не оказывал клинически значимого влияния на фармакокинетику следующих препаратов: теофиллин, преднизон, преднизолон, пероральные контрацептивы (этинилэстрадиол/норэтистерон 35/1), терфенадин, дигоксин и варфарин.

AUC монтелукаста в плазме крови снижалась примерно на 40% у пациентов, которые принимали монтелукаст и фенобарбитал. Поскольку в метаболизме монтелукаста принимает участие изофермент CYP3A4, следует проявлять осторожность, особенно у детей, при применении монтелукаста с такими индукторами CYP3A4 как фенитоин, фенобарбитал и рифампицин.

В исследованиях *in vitro* было установлено, что монтелукаст является мощным ингибитором изофермента CYP2C8. Однако результаты исследования клинического взаимодействия монтелукаста и росиглитазона (пример маркерных субстратов для препаратов, основной метаболизм которых осуществляется изоферментом CYP2C8) не выявили ингибирующего действия монтелукаста на изофермент CYP2C8 *in vivo*. Поэтому ожидается, что монтелукаст не будет существенно изменять превращения препаратов, которые метаболизируются с участием данного фермента (например, паклитаксел, росиглитазон и репаглинид). При приеме высоких доз монтелукаста (при 20- и 60-кратном превышении рекомендованной дозы для взрослых) наблюдается снижение концентрации теофиллина в плазме. Этот эффект не отмечается при приеме препарата в рекомендованных дозах.

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

Не следует принимать таблетки жевательные препарата Синглон для купирования острых приступов бронхиальной астмы. При возникновении приступа рекомендуется применять ингаляционные бета-адреномиметики. При увеличении потребности в бета-адреномиметиках кратковременного действия пациентам следует как можно быстрее обратиться к врачу.

Нельзя резко заменять ингаляционные или пероральные ГКС препаратом Синглон.

Отсутствуют данные, свидетельствующие о возможности снижения дозы пероральных ГКС при сопутствующем применении препарата Синглон.

В редких случаях у пациентов, принимающих препараты для лечения бронхиальной астмы, включая монтелукаст, может возникнуть системная эозинофилия, иногда сопровождающаяся клиническими проявлениями васкулита и синдрома Чарга-Стросса; это является показанием для применения системных ГКС. Такие случаи обычно, но не всегда, связаны с уменьшением дозы или отменой пероральных ГКС. Нельзя ни исключить, ни подтвердить вероятность того, что прием антагонистов лейкотриеновых рецепторов может быть связан с возникновением синдрома Чарга-Стросса. Врачи должны быть информированы о возможности возникновения у их пациентов эозинофилии, васкулитной сыпи, нарастания легочных симптомов, осложнений со стороны сердца и/или невропатии. Пациенты, у которых возникли вышеперечисленные симптомы, должны быть обследованы повторно, а режимы их лечения пересмотрены.

Таблетки жевательные препарата Синглон содержат аспартам - источник фенилаланина. Пациентам с фенилкетонурией следует иметь в виду, что каждая таблетка жевательная 4 мг содержит 1.2 мг аспартама, а каждая таблетка жевательная 5 мг содержит 1.5 мг аспартама.

### *Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

При приеме таблеток жевательных 5 мг препарата Синглон могут развиваться головокружение и сонливость, что следует учитывать при необходимости управления автотранспортными средствами или работе с механизмами.

Таблетки жевательные 4 мг назначают детям 2-5 лет.

### **При нарушениях функции почек**

У пациентов с почечной недостаточностью коррекции дозы не требуется.

### **При нарушениях функции печени**

У пациентов с легкой или умеренной степенью печеночной недостаточности коррекции дозы не требуется. Данные для пациентов с тяжелой степенью печеночной недостаточности отсутствуют

### **Применение в детском возрасте**

Таблетки жевательные 4 мг назначают детям в возрасте 2-5 лет, а таблетки жевательные 5 мг - детям в возрасте 6-14 лет

## **Условия хранения:**

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

**Срок годности:**

2 года.

**Условия отпуска в аптеке:**

По рецепту.

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