Состав

действующее вещество: монтелукаст;

1 таблетка, покрытые пленочной оболочки, содержит 10 мг монтелукаста (в форме натрия монтелукаста - 10,4 мг)

вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, гидроксипропилцелюлоза, натрия кроскармеллоза, магния стеарат, гипромеллоза, титана диоксид (Е 171), полиэтиленгликоль, железа оксид желтый (Е 172).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочки.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые пленочной оболочки, круглые, двояковыпуклые, желтого цвета, с рельефной надписью «R 15» с одной стороны, диаметром примерно 8 мм.

Фармакотерапевтическая группа

Средства для системного применение при обструктивных заболеваниях дыхательных путей. Антагонисты лейкотриенов рецепторов.

Код АТС R03D C03.

Фармакодинамика

Цистеиниллейкотриени (LTC4, LTD4, LTE4) является мощного ейкозаноидами воспаленной, что отпочковываются разными клетками, в том числе тучных клетками и эозинофилами. ЭТИ Важные проастматични медиаторов связывают с цистеиниллейкотриеновими рецепторами (CysLT), имеющийся в дыхательных путях человека, и вызывают такой реакции как бронхоспазм, секреция слизи, проникність сосудов и увеличение количества эозинофилов.

Перорально введения монтелукаст является активной Состав, которая из Высоких вибирковистю и химическим сродством связывается с CysLT1-рецепторами. Известно, что монтелукаст подавляет бронхоспазм после ингаляции LTD4 в дозе 5 мг. Бронходилатация наблюдается течение 2:00 после приема! применения; цей эффект является аддитивной к бронходилатации, спричиненои β-агонистами. Лечение монтелукастом пригничувало как раннюю, так и позднюю фазы бронхоконстрикции, спричиненои антигенов стимуляции.

Монелукаст уменьшает Количество эозинофилов периферической крови у взрослых пациентов и детей по сравнению с плацебо. Известно, что прием монелукаста значений уменьшал Количество эозинофилов в дыхательных путях (по анализу мокроты) и в периферической крови при этом улучшал клинический контроль бронхиальной астмы.

Лечение монелукастом улучшает дневные и ночные симптомы астмы, дополняет клинический эффект ингаляционных кортикостероидов, снижает летнюю частоту эпизодов обострения астмы и необходимость! Применение бета-агониста.

Фармакокинетика

Всасывания

Монелукаст быстро всасывается после перорального приема. После применение взрослыми натощак таблеток 10 мг, покрытые оболочкой, средняя максимальная концентрация (Cmax) в плазме крови достижимыми через 3 часа (Tmax). Средняя биодоступность при пероральном применении составляла 64%. Употребление обычные пищи НЕ вплияло на биодоступность и на Cmax при пероральном применении препарата. Безопасность и эффективность были подтвержденные во время клинических исследований, проводимых с применением таблеток 10 мг, покрытые пленочной оболочки, вне зависимости от времени приема пищи.

Для таблеток жевательной 5 мг показатель Cmax у взрослых достигался через 2 часа после приема натощак. Средняя биодоступность при пероральном применение составляет 73% и снижается до 63% в случае приема с обычный пищей.

Распределение

Более 99% монелукаста связывается с белками плазмы крови. Объем распределения монелукаста в равновесном состоянии в среднем ставить от 8 до 11 литров. В процессе исследованийна крысах с применением радиоактивного меченого монелукаста проникновение через гематоэнцефалический барьер было минимальным. Кроме того, концентрации меченого радиоизотопом материала во всех других тканях через 24 часа после введения препарата также обнаружили минимальными.

Метаболизм

Монелукаст активно метаболизируется. Во время исследований с применением терапевтических доз метаболитов монелукаста не выявляются в плазме крови (в

равновесном состоянии) у взрослых пациентов и пациентов детского возраста.

Цитохром Р450 2С8 является основным ферментом в метаболизме монтелукаста. Кроме того, цитохромы CYP 3A4 и 2C9 играют незначительная роль в метаболизме монтелукаста, хотя итраконазол (ингибитор CYP 3A4) НЕ менял фармакокинетические показатели монтелукаста у здоровых добровольцев, которые приобреталась 10 мг монтелукаста в сутки. Согласно результатам исследований in vitro с использованием микросом печени человека, терапевтические плазменные концентрации монтелукаста не подавляет 450 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6. Участие метаболитов в терапевтическом действии монтелукаста минимальна.

Вывод

Клиренс монтелукаста из плазмы крови у здоровых взрослых добровольцев в среднем составляет 45 мл / мин. После приема монтелукаста, меченого изотопом, 86% вещества выводятся с калом в течение 5 дней и менее 0,2% - С мочой. Этот факт в сочетании с данноми о биодоступности монтелукаста при пероральном применении свидетельствует, что монтелукаст и его метаболиты почти полностью выводятся с желчью.

Фармакокинетика в разных групп пациентов

Пациентам с нарушениями функции печени легкой и средней степени тяжести и у пациентов пожилого возраста коррекция дозы не требуется. Исследований при участии пациентов с нарушениями функции почек не проводили. Поскольку монтелукаст и его метаболиты выводятся с желчью, коррекция дозы для пациентов с нарушениями функции почек не считается необходимой. Данные по фармакокинетике монтелукаста у пациентов с нарушениями функции печени тяжелой степени (более 9 баллов по классификации Чайлд-Пью) отсутствуют.

В случае приема высоких доз монтелукаста (в 20 и 60 раз выше дозу, рекомендованную для взрослых) наблюдалось снижение концентрации теофиллина в плазме крови. Этот эффект не отмечался при приеме рекомендованной дозы 10 мг 1 раз в сутки.

Показания

Препарат Синглон®, таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг, показан взрослым и подросткам старше 15 лет.

- Лечение бронхиальной астмы: в качестве дополнительного средства лечения бронхиальной астмы у пациентов с персистирующей астмой легкой

и средней степени тяжести, которая недостаточно контролируется ингаляционными кортикостероидами, а также в случае недостаточного контроля астмы короткодействующими β-агонистов, применяемых в случае необходимости.
- Профилактика астмы, основным компонентом которой является бронхоспазм, вызванный физической нагрузкой.
- Облегчение симптомов сезонного и круглогодичного аллергического ринита.

Противопоказания

- Чувствительность к монтелукасту или к любой из вспомогательных веществ препарата;
- детский возраст до 15 лет (для дозировки 10 мг).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Синглон® можно назначать вместе с другими препаратами, которые обычно применяются для профилактики или длительного лечения бронхиальной астмы. Во время исследований взаимодействия между лекарственными средствами клиническая доза монтелукаста не имела важного клинического влияния на фармакокинетику следующих препаратов: теофиллин, преднизон, преднизолон, пероральные контрацептивы (этинилэстрадиол / норэтиндрон 35/1), терфенадин, дигоксин и варфарин.

У пациентов, которые одновременно принимали фенобарбитал, площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) для монтелукаста снижалась примерно на 40%. Поскольку монтелукаст метаболизируется с помощью CYP 3A4, 2C8 и 2C9, необходимо соблюдать осторожность, особенно в отношении детей, если монтелукаст назначать одновременно с индукторами CYP 3A4, 2C8 и 2C9, например фенитоином, фенобарбиталом и рифампицином.

Исследования in vitro показали, что монтелукаст является мощным ингибитором CYP 2C8. Однако данные клинического исследования взаимодействия лекарственных средств, включающих монтелукаст и розиглитазон (маркерный субстрат; препарат, метаболизируется с помощью CYP 2C8), показали, что монтелукаст не является ингибитором CYP 2C8 in vivo. Таким образом, монтелукаст не влияет в значительной степени на метаболизм препаратов, метаболизирующихся с помощью этого фермента (например, паклитаксела, росиглитазона и репаглинида).

Во время исследований in vitro было установлено, что монтелукаст является субстратом CYP 2C8 и в меньшей степени 2C9 и 3A4. В процессе клинического исследования взаимодействия лекарственных средств с применением монтелукаста и гемфиброзила (ингибитора CYP2C8 и 2C9) гемфиброзил повышал системное влияние монтелукаста в 4,4 раза. В случае одновременного применения с гемфиброзилом или другими мощными ингибиторами CYP 2C8 коррекция дозы монтелукаста не нужна, но врач должен учитывать повышенный риск возникновения побочных реакций.

По результатам исследований in vitro не ожидается возникновения клинически важных взаимодействий с менее мощными ингибиторами CYP2C8 (например, с триметопримом). Одновременное применение монтелукаста с итраконазолом, мощным ингибитором CYP 3A4, не приводил к существенному повышению системного влияния монтелукаста.

Особенности применения

Пациентов следует предупредить, что Синглон® для перорального применения никогда не следует применять для лечения острых приступов бронхиальной астмы, а также о том, что они должны всегда иметь при себе соответствующий препарат неотложной помощи. В случае острого приступа следует применять ингаляционные β-агонисты короткого действия. Пациенты должны как можно быстрее проконсультироваться с врачом, если они нуждаются в большем количестве β-агониста короткого действия, чем обычно.

Не следует резко заменять монтелукастом терапию ингаляционными или пероральными кортикостероидами.

Отсутствуют данные в подтверждение того, что дозу пероральных кортикостероидов можно уменьшать в случае одновременного применения монтелукаста.

В редких случаях у пациентов, получающих противоастматические средства, в том числе монтелукаст, может наблюдаться системная эозинофилия, иногда сопровождаемая клиническими проявлениями васкулита (так называемый синдром Чарга-Стросса), лечение которого осуществляется путем системной ГКС терапии. Такие случаи обычно (но не всегда) были связаны с уменьшением дозы или прекращением применения перорального ГКС препарата. Возможную взаимосвязь между антагонистами лейкотриеновых рецепторов и появлением синдрома Чарга-Стросса невозможно опровергнуть или подтвердить. Врачи должны помнить о возможности возникновения у пациентов эозинофилии, васкулитной сыпи, ухудшение легочной симптоматики, осложнений со стороны

сердца и / или нейропатии. Пациентов, у которых возникли такие симптомы, следует повторно обследовать и просмотреть их схему лечения.

Лечение монтелукастом не позволяет пациентам с аспиринзависимой бронхиальной астмой применять ацетилсалициловую кислоту или другие нестероидные противовоспалительные средства.

Сообщалось о возникновении психоневрологических реакций у взрослых, детей и подростков, принимавших Синглон® (см. Раздел «Побочные реакции»). Врачи и пациенты должны помнить о возможности возникновения психоневрологических реакций. Пациентам и / или сиделки следует дать указания о том, чтобы они сообщали врачу о возникновении таких изменений. Врачи должны внимательно оценить риски и пользу продолжения лечения Синглон® при развитии таких реакций.

Одна таблетка, покрытая оболочкой, препарата Синглон® по 10 мг содержит 89,3 мг лактозы моногидрата.

Пациентам с редкими наследственными заболеваниями как непереносимость галактозы, полная лактазная недостаточность или нарушение всасывания глюкозы-галактозы, не следует применять этот препарат.

Это лекарственное средство содержит менее 1 ммоль (23 мг) в таблетку, покрытую оболочкой натрия, то есть почти свободный от натрия.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Не ожидается влияния монтелукаста на способность управлять автомобилем или другими механизмами. Однако у отдельных пациентов может возникать сонливость и / или головокружение, таким пациентам во время приема препарата Синглон® следует воздержаться от управления автомобилем или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Исследования на животных не демонстрируют вредного влияния на беременность или эмбриональное / фетальное развитие.

Ограниченная информация базы данных по беременностей не указывает на причинно-следственную взаимосвязь между применением лекарственного средства Синглон® и возникновением мальформаций (таких как дефекты конечностей), о которых редко сообщалось в процессе всемирного

постмаркетингового опыта применения.

Синглон® можно применять в период беременности, только если это считается безусловно необходимым.

Кормления грудью. Исследования на крысах показали, что монтелукаст проникает в молоко. Неизвестно, выводится монтелукаст в грудное молоко у женщин.

Синглон® можно применять в период кормления грудью, только если это считается безусловно необходимым.

Способ применения и дозы

Доза для пациентов (в возрасте от 15), страдающих бронхиальной астмой или бронхиальной астмой с сопутствующим сезонным аллергическим ринитом, составляет 10 мг (1 таблетка) 1 раз в сутки, вечером, независимо от приема пищи. Для облегчения симптомов аллергического ринита время применения препарата следует подбирать индивидуально.

Общие рекомендации

- Терапевтический эффект препарата Синглон® на показатели контроля бронхиальной астмы длится 1 сутки. Пациентам необходимо рекомендовать продолжать принимать Синглон® даже в случае достижения контроля симптомов бронхиальной астмы, а также в периоды обострения бронхиальной астмы;
- Синглон® не следует применять с другими средствами, содержащими ту же действующее вещество - монтелукаст;
- пациенты пожилого возраста, пациенты с почечной недостаточностью или печеночной недостаточностью легкой или средней степени тяжести не требуют коррекции доз. Данные о пациентах с печеночной недостаточностью тяжелой степени отсутствуют. Дозы препарата для мужчин и женщин одинаковы.

Лечение препаратом Синглон® зависимости от других способов лечения бронхиальной астмы.

- Синглон® можно добавлять к уже существующему курсу лечения пациента.
- Ингаляционные кортикостероиды: Синглон® можно применять как дополнительное средство лечения пациентов, не достигают удовлетворительного клинического контроля заболевания путем применения ингаляционных кортикостероидов в комплексе с

короткодействующими β-агонистов, применяемых в случае необходимости.
- Синглон® не имеет резко заменять ингаляционные кортикостероиды.

Дети

Препарат Синглон®, таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг, применять детям в возрасте от 15 лет. Безопасность и эффективность применения препарата Синглон®, таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг, детям и подросткам в возрасте до 15 лет не установлены.

Таблетки жевательные, по 5 мг применять детям в возрасте от 6 до 14 лет.

Таблетки жевательные, по 4 мг применять детям в возрасте от 2 до 5 лет.

Препарат Синглон® не следует применять детям до 2 лет. Безопасность и эффективность у детей до 2-х лет не установлены.

Передозировка

Специальная информация о передозировке препарата Синглон® отсутствует. В процессе исследований хронической бронхиальной астмы монтелукаст назначали в дозах до 200 мг / сут взрослым пациентам в течение 22-х недель, а в кратковременных исследованиях - в дозах до 900 мг / сут в течение примерно 1 недели; эти дозы не совершали каких-либо клинически важных побочных реакций.

В течение периода послерегистрационного применения и во время клинических исследований поступали сообщения о острая передозировка препарата Синглон®. Они включали прием препарата взрослыми и детьми в дозах, превышающих 1000 мг (примерно 61 мг / кг в ребенка в возрасте 42 месяца). Полученные клинические и лабораторные данные соответствовали профилю безопасности у взрослых пациентов и детей. В большинстве случаев передозировки о побочных реакциях не сообщалось. Чаще всего наблюдались побочные реакции, соответствовали профилю безопасности препарата Синглон®, которые включали боль в животе, сонливость, жажду, головную боль, рвоту и психомоторную гиперактивность.

Неизвестно, выводится монтелукаст с помощью перитонеального диализа или гемодиализа.

Побочные реакции

Таблица частоты побочных реакций

Класс систем органов	Побочные реакции	Частота *
Инфекции и инвазии	Инфекции верхних дыхательных путей †	очень часто
Со стороны системы крови и лимфатической системы	Повышенная склонность к кровотечениям	единичные
	тромбоцитопения	редкие
Со стороны иммунной системы	Реакции гиперчувствительности, в том числе анафилаксия	редкие
	Эозинофильная инфильтрация печени	редкие
Со стороны психики	Нарушение сна, включая ночные кошмары, бессонница, сомнамбулизм, тревожность, возбуждение, в том числе агрессивное поведение или враждебность, депрессия, психомоторная гиперактивность (включая раздражительность, беспокойство, тремор§)	редкие
	Нарушение внимания, ухудшение памяти, тик	единичные

Галлюцинации, дезориентация, суицидальные мысли и поведение (суицидальность), обсессивно-компульсивное расстройство, дисфемия	редкие	
Со стороны нервной системы	Головная боль	частые
	Головокружение, вялость, парестезии / гипоэстезия, судороги	редкие
Со стороны сердца	сердцебиение	единичные
Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостение	носовое кровотечение	редкие
	Синдром Чарга - Стросс (см. Раздел «Особенности применения»)	редкие
	легочная эозинофилия	редкие
Со стороны ЖКТ	Диарея ‡, тошнота ‡, рвота ‡, боль в животе	частые
	Сухость во рту, диспепсия	редкие
Со стороны пищеварительной системы	Повышение уровня трансаминаз сыворотки (АЛТ, АСТ)	частые
	Гепатит (включая холестатическое, гепатоцеллюлярной и смешанное поражение печени)	редкие
Со стороны кожи и подкожных тканей	сыпь ‡	частые

Склонность к появлению синяков, крапивница, зуд	редкие	
ангионевротический отек	единичные	
Узловатая эритема, мультиформная эритема	редкие	
Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани	Артралгия, миалгия, в том числе мышечные спазмы	редкие
Со стороны почек и мочевыводящих путей	Энурез у детей	редкие
Общие нарушения и побочные реакции, вызванные приемом лекарственного средства	гипертермия ‡	частые
	Астения / повышенная утомляемость, н едомогание, отеки	редкие

Частота определена по частоте сообщений в базе данных клинических исследований: очень часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100 до <1/10), нечастые (от ≥ 1/1000 до <1/100), единичные (от ≥ 1/10000 до <1/1000), редкие (<1/10000).

† Об этом побочную реакцию сообщалось с частотой «очень часто» у пациентов, получавших монтелукаст, а также у пациентов, получавших плацебо, во время клинических исследований.

‡ Об этом побочную реакцию сообщалось с частотой «частые» у пациентов, получавших монтелукаст, а также у пациентов, получавших плацебо, во время клинических исследований.

§Частота «единичные»

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° С в оригинальной упаковке для защиты от воздействия света и влаги. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 14 таблеток в блистерах, по 2 блистера в картонной упаковке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ООО «Гедеон Рихтер Польша».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

ул. кн. Ю. Понятовского, 5, Гродзиск Мазовецкий, 05-825, Польша.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника —

Государственного реестра лекарственных средств Украины.