

Состав

действующее вещество: montelukast;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит монтелукаста натрия эквивалентно монтелукаста 10 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактоза, натрия кроскармеллоза, гидроксипропилцеллюлоза, натрия эдетат, магния стеарат покрытие Instacoat Aqua Brown ICG-A-10310: гипромеллоза, гидроксипропилцеллюлоза, титана диоксид (E 171), железа оксид желтый (E172), железа оксид красный (E 172).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые пленочной оболочкой бежевого цвета, квадратной формы с закругленными краями, с гравировкой " CL 26 " с одной стороны и гладкие с другой.

Фармакотерапевтическая группа

Средства для системного применения при обструктивных заболеваниях дыхательных путей. Антагонисты лейкотриеновых рецепторов. Код АТХ R03D C03.

Фармакодинамика

Цистеиниллейкотриены (LTC₄, LTD₄, LTE₄) являются мощными эйкозаноидами воспаления, выделяемых различными клетками, в том числе тучных клеток и эозинофилов. Эти важные проагматични медиаторы связываются с цистеиниллейкотриеновыми рецепторами (CysLT), присутствующими в дыхательных путях человека (включая миоциты гладкой мускулатуры и макрофаги), и другими клетками воспаления (включая эозинофилы и некоторые миелоидные стволовые клетки). CysLT связанные с патофизиологией астмы и аллергического ринита. При астме лейкотриенопосередковани эффекты включают бронхоспазм, выделение мокроты, проницаемость сосудов и увеличение количества эозинофилов. При аллергическом рините после экспозиции с аллергеном CysLT высвобождается из носовой слизистой оболочки во время обеих фаз (ранней и поздней) и проявляется симптомами аллергического ринита. При интраназальном пробе с CysLT было

продемонстрировано увеличение резистентности воздухоносных носовых путей и симптомов назальной обструкции.

Монтелукаст является активным соединением, которая с высокой избирательностью и химическим сродством связывается с CysLT₁-рецепторами. Монтелукаст вызывает значительное блокировки цистеиниллейкотриеновых рецепторов дыхательных путей, что было подтверждено его способностью ингибировать бронхоконстрикцию в астматических пациентов, вызванную вдыханием LTD₄. Даже низкая доза 5 мг вызывает значительное блокаду стимулированной LTD₄ бронхоконстрикция. Монтелукаст вызывает бронходилатацию течение 2 часов после перорального применения; этот эффект был аддитивным к бронходилатации, вызванной β-агонистов.

Лечение монтелукастом подавляет бронхоспазм как на ранней, так и на поздней стадии, снижая реакцию на антигены. Монтелукаст по сравнению с плацебо, уменьшает число эозинофилов периферической крови у взрослых пациентов и детей. В отдельном исследовании прием монтелукаста значительно уменьшал число эозинофилов в дыхательных путях (определенных в мокроте).

Фармакокинетика

Абсорбция

После приема монтелукаст быстро и практически полностью всасывается. У взрослых при приеме натошак таблеток, покрытых оболочкой, в дозе 10 мг максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови достигается через 3 часа (T_{max}). Средняя биодоступность составляет 64%. Прием обычной пищи не влияет на C_{max} в плазме крови и биодоступность таблеток, покрытых оболочкой. Безопасность и эффективность были продемонстрированы в ходе клинических исследований в группах, где таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг принимали независимо от приема пищи.

Распределение

Более 99% монтелукаста связывается с белками плазмы крови. Объем распределения монтелукаста в стационарной фазе в среднем составляет от 8 до 11 л. При исследовании обозначенного монтелукаста прохождение через гематоэнцефалический барьер был минимальным. Во всех остальных тканях концентрации обозначенного радиоизотопом материала через 24 часа после приема дозы также оказались минимальными.

Метаболизм

Монтелукаст активно метаболизируется. В исследованиях с терапевтическими дозами концентрации метаболитов монтелукаста в стационарном состоянии плазмы крови у взрослых и пациентов детского возраста не определялись.

Во время исследований *in vitro* с использованием микросом печени человека доказано, что цитохромы P450 3A4, 2A6 и 2C9 участвуют в метаболизме монтелукаста. Результаты дальнейших исследований микросом печени человека *in vitro* свидетельствуют, что в терапевтических концентрациях монтелукаст не угнетает цитохромы P450 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6. Участие метаболитов в терапевтическом действии монтелукаста минимальна.

Выведение

Клиренс монтелукаста из плазмы крови здоровых взрослых добровольцев в среднем составляет 45 мл/мин. После приема внутрь меченого изотопом монтелукаста 86% выводится с калом в течение 5 дней и менее 0,2% - с мочой. Кроме биодоступности монтелукаста при пероральном применении, этот факт подтверждает то, что его метаболиты почти полностью выводятся с желчью.

Фармакокинетика у различных групп пациентов

Для пациентов пожилого возраста, а также пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести коррекция дозы не требуется. Исследования по пациентам с почечной недостаточностью не проводились. Поскольку монтелукаст и его метаболиты выводятся с желчью, коррекция дозы для пациентов с почечной недостаточностью считается необходимой. Данных о характере фармакокинетики монтелукаста у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) нет.

При приеме больших доз монтелукаста (что в 20 и 60 раз превышали дозу, рекомендованную для взрослых) наблюдалось снижение концентрации теофиллина в плазме. Этот эффект не наблюдается при приеме рекомендованной дозы 10 мг 1 раз в сутки.

Показания

Дополнительное лечение бронхиальной астмы у пациентов с персистирующей астмой легкой и средней степени, что недостаточно контролируется ингаляционными ГКС, а также при недостаточном клиническом контроле астмы с помощью β -агонистов краткосрочного действия, применяемые при необходимости. Симптоматическое лечение сезонного аллергического ринита у больных бронхиальной астмой.

Профилактика астмы, доминирующим компонентом которой является бронхоспазм, индуцированный физическими нагрузками.

Облегчение симптомов сезонного и круглогодичного аллергического ринита.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к компонентам препарата. Возраст до 15 лет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Монтемак 10 можно назначать вместе с другими препаратами для профилактики или длительного лечения астмы и лечения аллергического ринита. Во время исследования взаимодействия между лекарственными средствами рекомендуется клиническая доза монтелукаста не имела значительного 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) монтелукаста снижалась примерно на 40%. Поскольку монтелукаст метаболизируется CYP 3A4, необходимо быть осторожным, особенно в отношении детей, если монтелукаст назначают одновременно с индукторами CYP 3 A4, например фенитоином, фенобарбиталом и рифампицином.

В исследованиях *in vitro* было показано, что монтелукаст является мощным ингибитором CYP 2C8. Однако результаты исследований взаимодействия лекарственных средств, включающих монтелукаст и розиглитазон (препарат, метаболизируется с помощью CYP 2C8), показали, что монтелукаст не является ингибитором CYP 2C8 *in vivo*. Таким образом, монтелукаст значительно не влияет на метаболизм препаратов, метаболизирующихся с помощью этого фермента (например паклитаксела, росиглитазона и репаглинида)

Особенности применения

Пациентов следует предупредить, что Монтемак 10 не следует применять для снятия острых астматических приступов. Рекомендуется продолжать лечение соответствующими лекарственными средствами для снятия приступов. В случае острого приступа следует применять ингаляционные β -агонисты короткого действия. Пациентам необходимо как можно быстрее проконсультироваться с врачом в случае, если им нужна больше, чем обычно, количество ингаляций β -

агонистов короткого действия. Не следует резко заменять монтелукастом терапию ингаляционными или пероральными ГКС. В редких случаях у пациентов, получающих противоастматические средства, в том числе монтелукаст, может наблюдаться системная эозинофилия, иногда вместе с клиническими проявлениями васкулита, так называемый синдром Чарга-Страуса (гранулематозный аллергический ангииты), лечение которого проводится с помощью системной ГКС терапии. Такие случаи обычно были связаны с уменьшением дозы или отменой терапии ГКС. Вероятность того, что антагонисты лейкотриеновых рецепторов связаны с появлением синдрома Чарга-Страуса, невозможно ни опровергнуть, ни подтвердить, потому врачам необходимо предупредить о возможности возникновения у пациентов эозинофилии, Васкулитно сыпи, ухудшение легочной симптоматики, осложнения со стороны сердца и нейропатии. Пациентам, у которых развивались вышеупомянутые симптомы, необходимо пройти повторное исследование, а схему их лечения следует пересмотреть.

Общие рекомендации по применению препарата.

Терапевтическое действие препарата по контролю астматических параметров продолжается в течение дня. Действие препарата не связана с приемом пищи. Пациентам следует рекомендовать продолжать прием препарата, даже если астма является контролируемой, а также во время обострения астматического статуса. Не следует принимать препарат вместе с лекарственными средствами, также содержат монтелукаст.

Препарат можно добавлять к уже назначенного курса лечения пациента.

Ингаляционные кортикостероиды

Монтемак 10 можно применять как дополнительное лечение пациентам, у которых ингаляционные кортикостероиды вместе с β -агонистов краткосрочного действия, применяемые при необходимости, не обеспечивают удовлетворительный клинический контроль заболевания.

Не следует заменять ингаляционные кортикостероиды препаратом Монтемак 10.

Ограничения сопутствующей терапии

Лечение бронхолитиками: Монтемак 10 можно добавить в схему лечения пациентов, состояние которых не контролируется должным образом только бронхолитиками. Когда наступит клинический эффект (как правило, после первой дозы), бронхолитическое терапию пациента можно ограничить к применению при необходимости.

Ингаляционные кортикостероиды: лечение Монтемаком 10 обеспечивает дополнительные клинические преимущества для пациентов, получающих ингаляционные кортикостероиды. Дозы кортикостероидов можно снизить при наличии контроля над заболеванием. Дозу снижать постепенно под контролем. Для некоторых больных ингаляционные кортикостероиды можно полностью отменить. Монтемаком 10 не следует резко заменять ингаляционные кортикостероиды.

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

Не ожидается влияние монтелукаста на способность управлять автомобилем или другими механизмами. Однако в редких случаях у отдельных пациентов может возникать головокружение или сонливость, поэтому во время приема препарата следует воздержаться от управления автомобилем или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Применение препарата во время беременности не изучалось.

Неизвестно, выводится ли препарат в грудное молоко. Назначая препарат женщинам в период беременности и кормления грудью, необходимо учитывать соотношение польза/риск.

По данным мирового маркетингового опыта, у детей, матери которых принимали во время беременности, изредка наблюдались врожденные дефекты конечностей. Большинство этих женщин принимали также и другие препараты от бронхиальной астмы. Причинная связь между этими случаями и приемом препарата не доказана.

Способ применения и дозы

Препарат применяют взрослым и детям старше 15 лет. Пациентам с бронхиальной астмой и аллергическим ринитом (сезонным и круглогодичным) необходимо принимать по 1 таблетке 10 мг 1 раз в сутки. Для лечения бронхиальной астмы или астмы в сочетании с сезонным аллергическим ринитом взрослым и детям старше 15 лет необходимо принимать 1 таблетку по 10 мг 1 раз в сутки вечером. Для облегчения симптомов аллергического ринита время приема подбирают индивидуально. Корректировка дозы для пациентов пожилого возраста, а также у пациентов с печеночной недостаточностью легкой или средней степени или почечной недостаточностью не требуется. Данные по коррекции дозы для пациентов с тяжелой степенью печеночной недостаточности

отсутствуют. Данных о характере фармакокинетики монтелукаста у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) нет, поэтому рекомендации по коррекции дозы отсутствуют. Дозировка препарата является одинаковой для пациентов мужского и женского пола.

Дети

Препарат применяют детям в возрасте от 15 лет. Детям в возрасте до 15 лет следует применять препарат в виде жевательных таблеток.

Передозировка

Никакой специальной информации по лечению передозировки препаратом нет.

В длительных исследованиях пациентов с хронической астмой монтелукаст назначали в дозах до 200 мг/сут взрослым пациентам в течение 22 недель, а в кратковременных исследованиях - до 900 мг/сут в течение примерно 1 недели, при этом клинически значимые побочные реакции отсутствовали.

Поступали сообщения о острой передозировке препарата. В частности, сообщалось о применении препарата взрослыми и детьми в дозах, превышающих 1000 мг (примерно 61 мг/кг, ребенок в возрасте 42 месяцев). Полученные клинические и лабораторные данные соответствовали профилю безопасности для взрослых пациентов и детей.

В большинстве сообщений о случаях передозировки никаких побочных эффектов не наблюдалось. Чаще всего наблюдались побочные эффекты, соответствовали профилю безопасности препарата и включали боль в животе, сонливость, жажду, головную боль, рвоту и психомоторную гиперактивность.

Неизвестно, выводится монтелукаст с помощью перитонеального диализа или гемодиализа. Лечение симптоматическое.

Побочные реакции

Инфекции и инвазии: инфекции верхних дыхательных путей.

Со стороны нервной системы: головная боль, вялость и головокружение, парестезии/гипоэстезия, приступы.

Со стороны пищеварительного тракта: боль в животе, диарея, сухость во рту, диспепсия, тошнота, рвота.

Со стороны крови: тенденция к усилению кровоточивости.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, в том числе анафилаксия; эозинофильная инфильтрация печени.

Со стороны психики: нарушение сна, в том числе ночные кошмары; галлюцинации бессонница раздражительность; гнев нетерпеливость; возбуждение, включая агрессивное поведение или враждебность; тремор депрессии; дезориентация; суицидальные намерения и поведение (суицидальность).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение.

Со стороны пищеварительной системы: повышение уровня трансаминаз сыворотки (АЛТ, АСТ), гепатит (холестатический гепатит, печеночноклеточного нарушения, смешанное поражение).

Со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, гематома, крапивница, зуд, сыпь, нодозная узловатая эритема.

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

Общие расстройства: астения/усталость, ощущение дискомфорта, отек, лихорадка, жажда.

В редких случаях при лечении монтелукастом больных бронхиальной астмой описано возникновение носового кровотечения, синдрома Чарга-Страуса.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 ° С в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 3 блистера в картонной упаковке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Маклеодс Фармасьютикалс Лимитед.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Виледж Тхеда, ПО Лодхимайра, Техсил Бадди, Дистрикт Солан, Химачал-Прадеш, 174101, Индия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).