Инструкция по применению
Экталуст Таблетки жевательные 4 мг 28 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки жевательные
Страна: Россия
Производитель: КАНОНФАРМА ПРОДАКШН
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Монтелукаст
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 4 мг

Описание

Таблетки круглые двояковыпуклые, белого или почти белого цвета со специфическим запахом земляники.

Действующее вещество

Монтелукаст

Форма выпуска

Таблетки жевательные

Фармакокинетика

Всасывание Монтелукаст быстро и практически полностью всасывается после приема внутрь. При приеме натощак таблеток жевательных 4 мг и 5 мг максимальная концентрация (Cmax) в плазме крови у взрослых достигается через 2 часа. Средняя биодоступность при приеме внутрь составляет 73%. Распределение Монтелукаст связывается белками плазмы крови более, чем на 99%. Объем распределения монтелукаста составляет в среднем 8-11 литров. Исследования, проведенные на крысах с радиоактивно меченым монтелукастом, указывают на минимальное проникновение через гематоэнцефалический барьер. Кроме того, концентрация меченого монтелукаста через 24 часа после введения была минимальной во всех других тканях. Метаболизм Монтелукаст активно метаболизируется. При применении терапевтических доз концентрация метаболитов монтелукаста в плазме крови в

равновесном состоянии у взрослых и у детей не определяется. Исследования in vitro с использованием микросом печени человека показали, что цитохромы P450, 3A4, 2C8 и 2C9 участвуют в метаболизме монтелукаста. Согласно дальнейшим результатам исследований, проведенным in vitro в микросомах печени человека, терапевтическая концентрация монтелукаста в плазме крови не ингибирует изофермен- ты цитохрома P450 CYP: 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6. Выведение Период полувыведения 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% от общего количества выводится через кишечник в течение 5 дней и менее 0,2% - почками, что подтверждает то, что монтелукаст и его метаболиты выводятся почти исключительно с желчью. Фармакокинетика монтелукаста сохраняет практически линейный характер при приеме внутрь доз свыше 50 мг. При приеме монтелукаста в утренние и вечерние часы различий фармакокинетики не наблюдается. При приеме 10 мг монтелукаста в сутки наблюдается умеренная (около 14%) кумуляция активного вещества в плазме крови. Особенности фармакокинетики у различных групп пациентов Пол Фармакокинетика монтелукаста у женщин и мужчин сходна. Возраст При однократном приеме внутрь 10 мг монтелукаста фармакокинетический профиль и биодоступность сходны у пожилых и пациентов молодого возраста. Период полувыведения монтелукаста из плазмы крови несколько больше у пожилых пациентов. Коррекция дозы препарата у пожилых пациентов не требуется. Этническая принадлежность Не выявлено различий в клинически значимых фармакокинетических эффектах у пациентов различных рас. Печеночная недостаточность. У пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести и клиническими проявлениями цирроза печени отмечено замедление метаболизма монтелукаста, сопровождающееся увеличением площади под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) приблизительно на 41% после однократного приема препарата в дозе 10 мг. Выведение монтелукаста у этих пациентов несколько увеличивается по сравнению со здоровыми субъектами (среднее время полувыведения —7,4 часа). Изменения дозы монтелукаста для пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести не требуется. Данных о характере фармакокинетики монтелукаста у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) нет. Почечная недостаточность. Поскольку монтелукаст и его метаболиты не выводятся почками, фармакокинетика монтелукаста у пациентов с почечной недостаточностью не оценивалась. Корректировка дозы препарата для этой группы пациентов не требуется.

Показания

профилактика и длительное лечение бронхиальной астмы, включая предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания; лечение бронхиальной астмы у пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте; профилактика бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой; купирование дневных и ночных симптомов сезонных аллергических ринитов и постоянных аллергических ринитов.

Способ применения и дозы

Препарат Экталуст® принимают внутрь 1 раз в сутки независимо от приема пищи. Таблетку можно проглатывать целиком или разжевать перед проглатыванием. Для лечения бронхиальной астмы монтелукаст следует принимать вечером. При лечении аллергических ринитов препарат можно принимать в любое время суток. При сочетанной патологии (бронхиальная астма и аллергический ринит) препарат следует принимать вечером. В возрасте от 2-х до 5 лет: одна жевательная таблетка в дозе 4 мг один раз в сутки перед сном. Подбора дозы для этой возрастной группы не требуется. В возрасте от 6 до 14 лет: одна жевательная таблетка в дозе 5 мг один раз в сутки. Подбора дозы для этой возрастной группы не требуется. Детям старше 15 лет и взрослые Доза для взрослых и детей старше 15 лет составляет 10 мг монтелукаста в сутки. Терапевтическое действие монтелукаста, на показатели, отражающие течение бронхиальной астмы, развивается в течение первого дня. Пациенту следует продолжать принимать монтелукаст как в период достижения контроля симптомов бронхиальной астмы, так и в период обострения заболевания. Для пожилых пациентов, пациентов с почечной недостаточностью, пациентов с легкими или среднетяжелыми нарушениями функции печени специального подбора дозы не требуется. Монтелукаст можно добавлять к лечению бронходилататорами и ингаляционными глюкокортикостероидами (ГКС).

Противопоказания

повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата; детский возраст до 2 лет (для дозировки 4 мг); детский возраст до 6 лет (для дозировки 5 мг); фенилкетонурия.

Применение при беременности и кормлении грудью

Экталуст® следует применять при беременности только в случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Сообщалось о развитии врожденных дефектов конечностей у новорожденных, матери которых принимали монтелукаст в период беременности. Большинство этих женщин также принимали другие препараты для лечения бронхиальной астмы в период беременности. Причинно-следственная связь между приемом монтелукаста и развитием врожденных дефектов конечностей не установлена. Неизвестно, проникает ли монтелукаст в грудное молоко, поэтому применение препарата в период грудного вскармливания возможно, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для ребенка.

Побочные действия

В целом монтелукаст хорошо переносится. Побочные эффекты обычно бывают легкими и, как правило, не требуют отмены лечения. Общая частота побочных эффектов при лечении препаратом сопоставима с их частотой при приеме плацебо. Инфекционные и паразитарные заболевания: инфекции верхних дыхательных путей. Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: повышение склонности к кровотечениям, тромбоцитопения. Нарушения со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, в том числе анафилаксия, эозинофильная инфильтрация печени. Нарушения психики: ажитация, в том числе агрессивное поведение или враждебность, тревожность, депрессия, дезориентация, тремор, нарушение внимания, необычные яркие сновидения, галлюцинации, нарушения памяти, психомоторная активность (включая раздражительность, беспокойство), утомляемость, сомнамбулизм, суицидальные мысли и суицидальное поведение (суицидальность), бессонница, тик. Нарушения со стороны нервной системы: головокружение, сонливость, парестезия/гипестезия, очень редко судороги. Нарушения со стороны сердца: учащенное сердцебиение. Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: носовые кровотечения, легочная эозинофилия. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, диарея, диспепсия, панкреатит. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: повышение активности аланинаминотрансферазы (АЛТ) и аспартатаминотрансферазы (АСТ), гепатит (включая холестатические, гепатоцеллюлярные и смешанные поражения печени). Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: склонность к формированию гематом, узловатая эритема, многоформная эритема, зуд, высыпания, крапивница, ангионевротический отек. Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: артралгия, миалгия, включая мышечные судороги. Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: энурез у детей. Прочие: отеки, астения (слабость)/усталость, пирексия. Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Данных о симптомах передозировки при приеме препарата Экталуст® пациентами с бронхиальной астмой в дозе, превышающей 200 мг/сутки, в течение 22 недель и в дозе 900 мг/сутки в течение 1 недели не выявлено. Имели место случаи острой передозировки (прием не менее 1000 мг монтелукаста в сутки) в пострегистрационный период и во время клинических исследований у взрослых и детей. Клинические и лабораторные данные при этом свидетельствуют о соответствии профиля безопасности препарата Экталуст® у детей профилю безопасности у взрослых и пожилых пациентов. Наиболее частыми нежелательными явлениями были чувство жажды, сонливость, рвота, психомоторное возбуждение, головная боль, мидриаз, гиперкинезы и боль в животе. Лечение симптоматическое.   Данных о возможности выведения монтелукаста путем перитонеального диализа или гемодиализа нет.

Взаимодействие с другими препаратами

Экталуст® можно назначать вместе с другими лекарственными средствами, традиционно применяемыми для профилактики и длительного лечения бронхиальной астмы и/или аллергического ринита. Рекомендуемая терапевтическая доза монтелукаста не оказывала клинически значимого эффекта на фармакокинетику следующих препаратов: теофиллина, преднизона, преднизолона, пероральных контрацептивов (этинилэстрадиол/норэтиндрон 35/1), терфенадина, дигоксина и варфарина. AUC уменьшается у лиц, одновременно получающих фенобарбитал (примерно на 40%), однако коррекции режима дозирования препарата Экталуст® таким пациентам не требуется. В исследованиях in vitro установлено, что монтелукаст ингибирует изофермент CYP 2C8 системы цитохрома P450, однако при исследовании лекарственного взаимодействия in vivo монтелукаста и росиглитазона (метаболизируется с участием изофермента CYP 2C8 системы цитохрома) не получено подтверждения ингибирования монтелукастом CYP 2C8 опосредованного метаболизма ряда лекарственных препаратов, в том числе, паклитаксела, росиглитазона, репаглинида. Исследования in vitro показали, что монтелукаст является субстратом изоферментов CYP 2C8, 2C9 и 3A4. Данные клинического исследования лекарственного взаимодействия в отношении монтелукаста и гемфиброзила (ингибитора как CYP 2C8, так и 2C9) демонстрируют, что гемфиброзил повышает эффект системного воздействия монтелукаста в 4,4 раза. Совместный прием интраконазола, сильного ингибитора изофермента CYP 3A4, вместе с гемфиброзилом и монтелукастом не приводил к дополнительному повышению эффекта системного воздействия монтелукаста. Влияние гемфиброзила на системное воздействие монтелукаста 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/день для взрослых пациентов в течение 22 недель и до 900 мг/день для взрослых пациентов в течение 22 недель и до 900 мг/день для пациентов, принимающих препарат в течение примерно одной недели, не наблюдалось клинически значимых отрицательных эффектов). Таким образом, при совместном приеме с гемфиброзилом корректировка дозы монтелукаста не требуется. По результатам исследований in vitro не предполагается клинически значимых лекарственных взаимодействий с другими известными ингибиторами CYP 2C8 (например, с триметопримом). Кроме того, совместный прием монтелукаста с одним только итраконазолом не приводил к существенному повышению эффекта системного воздействия монтелукаста. Лечение бронходилататорами Экталуст® можно добавить к лечению пациентов, у которых бронхи- альная астма не контролируется применением одних бронходилататоров. При достижении терапевтического эффекта (обычно после первой дозы) на фоне терапии препаратом Экталуст®, дозу бронходилататоров можно постепенно снижать. Ингаляционные ГКС Лечение препаратом Экталуст® обеспечивает дополнительный терапевтический эффект пациентам, получающим лечение ингаляционными ГКС. При достижении стабилизации состояния пациента возможно снижение дозы ГКС. Дозу ГКС нужно снижать постепенно, под наблюдением врача. У некоторых пациентов прием ингаляционных ГКС может быть полностью отменен. Не рекомендуется резкая замена терапии ингаляционными ГКС назначением препарата Экталуст®.

Особые указания

Эффективность монтелукаста для приема внутрь в отношении лечения острых приступов бронхиальной астмы не установлена, поэтому монтелукаст не рекомендуется назначать для лечения острых приступов бронхиальной астмы. Пациенты должны всегда иметь при себе препараты экстренной помощи для купирования приступов брон- хиальной астмы (ингаляционные β2-агонисты короткого действия). Не следует прекращать прием монтелукаста в период обострения бронхиальной астмы и необходимости применения препаратов экстренной помощи для купирования приступов. Пациенты с подтвержденной аллергией к ацетилсалициловой кислоте и другим нестероидным противовоспалительным препаратам (НПВП) 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 НПВП бронхоконстрикцию. Дозу применяемых одновременно с препаратом Экталуст® ингаляционных ГКС

можно постепенно снижать под наблюдением врача. Однако резкой замены ГКС препаратом Экталуст®   проводить нельзя. Снижение дозы системных ГКС у пациентов, получающих противоастматические средства, включая блокаторы лейкотриеновых рецепторов, сопровождалось в редких случаях появлением эозинофилии, сыпи, ухудшением легочных симптомов, кардиологических осложнений и/или нейропатии, иногда диагностируемых как синдром Черджа-Стросса - системный эозинофильный васкулит. Причинно-следственная связь развития этих нежелательных явлений с терапией антагонистами лейкотриеновых рецепторов не была доказана, тем не менее, необходимо соблюдать осторожность и проводить соответствующее клиническое наблюдение при снижении дозы системных ГКС у пациентов, принимающих монтелукаст. В состав препарата входит аспартам, который является источником фенилаланина, поэтому препарат не рекомендован к применению пациентам с фенилкетонурией. Пациенты с фенилкетонурией должны быть проинформированы, что каждая жевательная таблетка содержит аспартам в количестве: таб. 4мг - 0,8 мг, таб. 5 мг - 1 мг аспартама, что соответствует 0,45 и 0,56 мг фенилаланина соответственно. У пациентов, принимающих монтелукаст, были описаны психоневрологические нарушения (см. раздел «Побочное действие»). Учитывая, что эти симптомы могли быть вызваны другими факторами, неизвестно, связаны ли они с приемом монтелукаста. Врачу необходимо обсудить данное нежелательное явление с пациентами и/или их родителями /опекунами. Пациентам и/или их родителями/опекунами необходимо объяснить, что в случае появления подобных симптомов необходимо сообщить об этом лечащему врачу. Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами Данных, свидетельствующих о том, что прием монтелукаста влияет на способность управлять транспортными средствами или движущимися механизмами не выявлено. Однако при применении препарата могут возникнуть такие побочные эффекты, как головокружение и сонливость. Ввиду этого, следует соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и выполнений действий, требующих быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С во вторичной упаковке (пачке картонной). Хранить в недоступном для детей месте.