Инструкция по применению
Монлер Таблетки покрытые пленочной оболочкой 10 мг 14 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Хорватия
Производитель: Белупо
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Монтелукаст
Количество в упаковке: 14
Дозировка действующего вещества: 10 мг

Описание

Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой бежевого цвета.

Действующее вещество

Монтелукаст

Состав

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:Действующее вещество: монтелукаст натрия 10,4 мг (эквивалентно 10 мг монтелукаста).Вспомогательные вещества: маннитол – 163,10 мг, кроскармеллоза натрия – 10,00 мг, целлюлоза микрокристаллическая тип 102 – 6,00 мг, гипролоза низкозамещенная – 4,00 мг, магния стеарат – 4,00 мг, аспартам – 1,50 мг, ароматизатор банановый (ароматизирующие вещества, мальтодекстрин, крахмал модифицированный E1450, пропиленгликоль E1520) – 1,00 мг, оболочка таблетки: опадрай желтый 20A33251 (гипромеллоза 3cP – 1,35 мг, гипролоза – 1,35 мг, тальк – 0,80 мг, титана диоксид – 0,4844 мг, краситель железа оксид желтый (E 172) – 0,014 мг, краситель железа оксид красный (E 172) – 0,0016 мг) – 4,00 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

ВсасываниеМонтелукаст быстро и практически полностью всасывается после приема внутрь. Прием пищи не влияет на биодоступность и максимальную концентрацию в плазме (Cmax) препарата. У взрослых Cmax достигается через 3 часа после приема натощак таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 10 мг. Средняя биодоступность при приеме внутрь составляет 64 %.РаспределениеМонтелукаст практически полностью (более чем на 99 %) связывается с белками плазмы крови. Объем распределения монтелукаста в состоянии равновесной концентрации составляет в среднем 8-11 литров. Исследования с радиоактивно меченым монтелукастом, проведенные на крысах, указывают на минимальное проникновение через гематоэнцефалический барьер. Кроме того, концентрации меченого монтелукаста через 24 часа после введения были минимальными во всех других тканях. МетаболизмМонтелукаст активно метаболизируется в печени. При исследовании терапевтических доз концентрация метаболитов монтелукаста в плазме в равновесном состоянии у взрослых и детей не определяется.Исследования in vitro с использованием микросом печени человека показали, что в процесс метаболизма монтелукаста вовлечены изоферменты цитохрома P450: 3A4, 2C8 и 2C9. Согласно результатам исследований, проведенным in vitro в микросомах печени человека, монтелукаст в терапевтических концентрациях в плазме крови не ингибирует изоферменты цитохрома P450: 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6.ВыведениеПлазменный клиренс монтелукаста у здоровых взрослых составляет в среднем 45 мл/мин. После приема внутрь радиоактивно меченого монтелукаста 86 % его количества выводится через кишечник в течение 5 дней и менее 0,2 % - почками, что подтверждает выведение монтелукаста и его метаболитов путем экскреции в желчь.Период полувыведения монтелукаста у молодых здоровых взрослых составляет от 2,7 до 5,5 часов. 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 1 раз в сутки таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 10 мг наблюдается умеренная (около 14 %) кумуляция активного вещества в плазме.Особенности фармакокинетики у различных групп пациентовПолФармакокинетика монтелукаста у женщин и мужчин сходная. Пожилые пациентыПри приеме внутрь 1 раз в сутки таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 10 мг фармакокинетический профиль и биодоступность сходны у пожилых людей и пациентов молодого возраста. Период полувыведения монтелукаста из плазмы несколько длиннее у пожилых людей. Коррекция дозы препарата у пожилых пациентов не требуется.Печеночная недостаточностьУ 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. Период выведения монтелукаста у этих пациентов незначительно увеличивается по сравнению со здоровыми добровольцами (среднее время полувыведения - 7,4 часа). Коррекция дозы монтелукаста у 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 недостаточностьПоскольку монтелукаст и его метаболиты не экскретируются почками, фармакокинетика монтелукаста у пациентов с почечной недостаточностью не оценивалась. Коррекция дозы препарата в этой группе пациентов не требуется. РасаКлинически значимых различий фармакокинетических параметров у пациентов различных расово-этнических групп не выявлено.

Показания

Длительное лечение и профилактика бронхиальной астмы (в т.ч. предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания) у взрослых и детей старше 15 лет, лечение бронхиальной астмы у пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте и профилактика бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой.Купирование дневных и ночных симптомов аллергического ринита (сезонного и/или круглогодичного) у взрослых и детей старше 15 лет.

Способ применения и дозы

Внутрь, один раз в сутки вечером, независимо от приема пищи.Детям старше 15 лет и взрослым рекомендуется принимать 1 таблетку, покрытую пленочной оболочкой (10 мг) в сутки.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.Детский возраст до 15 лет.Фенилкетонурия.

Применение при беременности и кормлении грудью

Клинических исследований монтелукаста с участием беременных женщин не проводилось. Препарат можно применять при беременности и в период грудного вскармливания только в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка. В ходе пострегистрационного применения монтелукаста сообщалось о развитии врожденных дефектов конечностей у новорожденных, матери которых принимали монтелукаст во время беременности. Большинство этих женщин также принимали другие препараты для лечения бронхиальной астмы во время беременности. Причинно-следственная связь между приемом монтелукаста и развитием врожденных дефектов конечностей не установлена.Неизвестно, проникает ли монтелукаст в грудное молоко. Поскольку многие лекарственные препараты проникают в грудное молоко, необходимо учитывать это при назначении препарата Монлер® в период грудного вскармливания.

Побочные действия

В целом препарат хорошо переносится. Нежелательные реакции (НР) обычно бывают легкими и, как правило, не требуют отмены препарата. Общая частота НР при лечении препаратом сопоставима с их частотой при приеме плацебо.Дети в возрасте от 2 до 5 лет с бронхиальной астмойВ клинических исследованиях монтелукаста приняли участие 573 пациента в возрасте от 2 до 5 лет. В 12-недельном плацебо-контролируемом клиническом исследовании единственным нежелательным явлением (НЯ), оцененным как связанное с приемом препарата, наблюдавшимся у >1 % пациентов, принимавших монтелукаст, и чаще, чем в группе пациентов, принимавших плацебо, была жажда. Различия по частоте данного НЯ между двумя группами лечения были статистически незначимыми.В общей сложности 426 пациентов в возрасте от 2 до 5 лет получали лечение монтелукастом в течение как минимум 3 месяцев, 230 пациентов – в течение 6 месяцев или более длительно, и 63 пациента – в течение 12 месяцев или более длительно. При более длительном лечении профиль НЯ не изменился.Дети в возрасте от 2 до 14 лет с сезонным аллергическим ринитомВ 2-недельном плацебо-контролируемом клиническом исследовании с применением монтелукаста для лечения сезонного аллергического ринита приняли участие 280 пациентов в возрасте от 2 до 14 лет. Монтелукаст принимался пациентами 1 раз в день вечером и в целом хорошо переносился, профиль безопасности монтелукаста был схожим с профилем безопасности плацебо. В данном клиническом исследовании не были зарегистрированы НЯ, которые бы расценивались как связанные с приемом препарата, наблюдались бы у ≥1 % пациентов, принимавших монтелукаст, и чаще, чем в группе пациентов, принимавших плацебо.Дети в возрасте от 6 до 14 лет с бронхиальной астмойПрофиль безопасности монтелукаста у детей был в целом

схожим с профилем безопасности у взрослых и сопоставим с профилем безопасности плацебо.В 8-недельном плацебо-контролируемом клиническом исследовании единственным НЯ, оцененным как связанное с приемом препарата, наблюдавшимся у >1 % пациентов, принимавших монтелукаст, и чаще, чем в группе пациентов, принимавших плацебо, была головная боль. Различие по частоте между двумя группами лечения было статистически незначимым.В исследованиях по оценке темпа роста профиль безопасности у пациентов данной возрастной группы соответствовал ранее описанному профилю безопасности монтелукаста.При более длительном лечении (более 6 месяцев) профиль НЯ не изменился. Взрослые и дети в возрасте 15 лет и старше с бронхиальной астмойВ двух 12-недельных плацебо-контролируемых клинических исследованиях с аналогичным дизайном единственными НЯ, оцененными как связанные с приемом препарата, наблюдавшиеся у ≥1 % пациентов, принимавших монтелукаст, и чаще, чем в группе пациентов, принимавших плацебо, были боль в животе и головная боль. Различия по частоте данных НЯ между двумя группами лечения были статистически незначимыми. При более длительном лечении (в течение 2 лет) профиль НЯ не изменился.Взрослые и дети в возрасте 15 лет и старше с сезонным аллергическим ринитомМонтелукаст принимался пациентами 1 раз в день утром или вечером и в целом хорошо переносился, профиль безопасности препарата был схожим с профилем безопасности плацебо. В плацебо-контролируемых клинических исследованиях не были зарегистрированы НЯ, которые бы расценивались как связанные с приемом препарата, наблюдались бы у ≥1 % пациентов, принимавших монтелукаст, и чаще, чем в группе пациентов, принимавших плацебо. В 4-недельном плацебо-контролируемом клиническом исследовании профиль безопасности монтелукаста был схожим с таковым в 2-недельных исследованиях. Частота возникновения сонливости при приеме монтелукаста во всех исследованиях была такой же, как при приеме плацебо.Взрослые и дети в возрасте 15 лет и старше с круглогодичным аллергическим ринитомМонтелукаст принимался пациентами 1 раз в день и в целом хорошо переносился. Профиль безопасности препарата был схожим с профилем безопасности, наблюдавшимся при лечении пациентов с сезонным аллергическим ринитом и при приеме плацебо. В данных клинических исследованиях не были зарегистрированы НЯ, которые бы расценивались как связанные с приемом препарата, наблюдались бы у ≥1 % пациентов, принимавших монтелукаст, и чаще, чем в группе пациентов, принимавших плацебо. Частота возникновения сонливости при приеме монтелукаста была такой же, как при приеме плацебо. Обобщенный анализ результатов клинических исследованийБыл проведен обобщенный анализ 41 плацебо-контролируемого клинического исследования (35 исследований с участием пациентов в возрасте 15 лет и старше, 6 исследований с участием пациентов в возрасте от 6 до 14 лет) с использованием утвержденных методов оценки суицидальности. Среди 9929

пациентов, принимавших монтелукаст, и 7780 пациентов, принимавших в данных исследованиях плацебо, был выявлен один пациент с суицидальной настроенностью в группе пациентов, принимавших монтелукаст. Ни в одной из групп лечения не было совершено ни одного самоубийства, суицидальной попытки или других подготовительных действий, указывавших на суицидальное поведение.Отдельно был проведен обобщенный анализ 46 плацебо-контролируемых клинических исследований (35 исследований с участием пациентов в возрасте 15 лет и старше, 11 исследований с участием пациентов в возрасте от 3 месяцев до 14 лет) для оценки неблагоприятных поведенческих эффектов (НПЭ). Среди 11673 пациентов, принимавших в этих исследованиях монтелукаст, и 8827 пациентов, принимавших плацебо, процент пациентов, имеющих как минимум один НПЭ, составил 2,73 % среди принимавших монтелукаст, и 2,27 % - среди принимавших плацебо, отношение шансов составило 1,12 (95 % доверительный интервал [0,93, l, 36]).НЯ, о которых сообщалось в период пострегистрационного применения препарата, перечислены в таблице ниже в соответствии с системно-органными классами и специфическими нежелательными явлениями. Категории частоты были оценены на основе соответствующих клинических исследований.

Передозировка

В ходе клинических исследований длительного (в течение 22 недель) лечения взрослых пациентов с бронхиальной астмой препаратом в дозах до 200 мг в сутки и после краткосрочного (в течение 1 недели) лечения пациентов в дозах до 900 мг в сутки симптомы передозировки не наблюдались.Имеются данные о случаях острой передозировки монтелукастом (прием не менее 1000 мг препарата в сутки) в пострегистрационный период и в клинических исследованиях у взрослых и детей. Клинические и лабораторные данные свидетельствовали о сопоставимости профилей безопасности препарата у детей, взрослых и пожилых пациентов.Симптомы: наиболее частые - чувство жажды, сонливость, рвота, психомоторное возбуждение, головная боль и боль в животе. Данные НР согласуются с профилем безопасности монтелукаста. Лечение в случае острой передозировки симптоматическое. Данных об эффективности перитонеального диализа или гемодиализа монтелукаста нет.

Взаимодействие с другими препаратами

Монтелукаст можно применять совместно с другими лекарственными препаратами для профилактики и длительного лечения бронхиальной астмы и/или аллергического ринита. Рекомендуемая терапевтическая доза монтелукаста не оказывает клинически значимого влияния на фармакокинетику таких препаратов, как теофиллин, преднизон, преднизолон, пероральные контрацептивы (этинил-эстрадиол / норэтистерон 35/1),

терфенадин, дигоксин и варфарин.Площадь под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) монелукаста при одновременном приеме с фенобарбиталом снижается примерно на 40 %, что не требует изменений режима дозирования монелукаста.Исследования in vitro показали, что монелукаст ингибирует изофермент CYP 2C8 системы цитохрома P450. Однако при исследовании лекарственного взаимодействия in vivo монелукаста и росиглитазона (метаболизируется с участием изофермента CYP 2C8 системы цитохрома P450) не подтвердилось ингибирование монелукастом изофермента CYP 2C8. Таким образом, не предполагается влияние монелукаста на CYP 2C8-опосредованный метаболизм лекарственных препаратов, в том числе паклитаксела, росиглитазона, репаглинида и др.Исследования in vitro показали, что монелукаст является субстратом изоферментов CYP 2C8, 2C9 и 3A4. Данные клинического исследования лекарственного взаимодействия в отношении монелукаста и гемфиброзила (ингибитора как CYP 2C8, так и 2C9) демонстрируют, что гемфиброзил повышает эффект системного воздействия монелукаста в 4,4 раза. Влияние гемфиброзила на системное воздействие монелукаста не может считаться клинически значимым на основании данных по безопасности при применении монелукаста в дозах, превышающих одобренную дозу 10 мг для взрослых пациентов (например, при применении в дозе 200 мг/день для взрослых пациентов в течение 22 недель и до 900 мг/день в течение примерно одной недели не наблюдалось клинически значимых отрицательных эффектов). Поэтому при совместном приеме вместе с гемфиброзилом коррекция дозы монелукаста не требуется. Совместный прием итраконазола, мощного ингибитора CYP 3A4, вместе с гемфиброзилом и монелукастом не приводил к дополнительному повышению эффекта системного воздействия монелукаста. По результатам исследований in vitro не предполагается клинически значимых лекарственных взаимодействий с другими известными ингибиторами CYP 2C8 (например, с триметопримом). Совместный прием монелукаста с одним только итраконазолом также не приводил к дополнительному повышению эффекта системного воздействия монелукаста.Комбинированное лечение с бронходилататорами: монелукаст является обоснованным дополнением к монотерапии бронходилататорами, если последние не обеспечивают эффективного контроля бронхиальной астмы. При достижении терапевтического эффекта (обычно после первой дозы) от лечения монелукастом можно начать постепенное снижение дозы бронходилататоров.Комбинированное лечение с ингаляционными глюкокортикостероидами: лечение монелукастом обеспечивает дополнительный терапевтический эффект пациентам, применяющим ингаляционные глюкокортикостероиды. По достижении стабилизации можно начать постепенно и под

наблюдением врача снижать дозы глюкокортикостероида. В некоторых случаях допустима полная отмена ингаляционных глюкокортикостероидов, однако резкая замена ингаляционных глюкокортикостероидов на монтелукаст не рекомендуется.

Особые указания

Эффективность препарата в отношении лечения острых приступов бронхиальной астмы не установлена, поэтому препарат не рекомендуется применять при острых приступах бронхиальной астмы.Пациенты должны всегда иметь при себе препараты экстренной помощи для купирования приступов бронхиальной астмы (ингаляционные бета2-агонисты короткого действия). Не следует прекращать прием монтелукаста в период обострения 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 больных аллергической бронхиальной астмой, тем не менее, не может полностью предотвратить вызванную у них НПВП бронхоконстрикцию.Дозу ингаляционных глюкокортикостероидов, применяемых одновременно с монтелукастом, можно постепенно снижать под наблюдением врача, однако резкая замена ингаляционных или пероральных глюкокортикостероидов на монтелукаст не рекомендуется. У пациентов, принимавших 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 данные НЯ с пациентами и/или их родителями /опекунами. Пациентам и/или их родителям/опекунам необходимо объяснить, что в случае появления подобных симптомов необходимо сообщить об этом лечащему врачу.В редких случаях пациенты, получавшие противоастматические препараты, включая блокаторы лейкотриеновых рецепторов, испытывали одно или несколько следующих НЯ: эозинофилию, сыпь, ухудшение легочных симптомов, кардиологические осложнения и/или нейропатию, иногда диагностируемую как синдром Чарджа-Стросса, системный эозинофильный васкулит. Эти случаи иногда были связаны со снижением дозы или отменой терапии пероральными глюкокортикостероидами. 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 глюкокортикостероидов у пациентов, принимающих монтелукаст.В состав препарата входит аспартам, который является источником фенилаланина, поэтому препарат не рекомендован к применению пациентам с фенилкетонурией.Применение у пожилых пациентовРазличий в профилях эффективности и безопасности монтелукаста, связанных с возрастом пациентов, не выявлено.

Условия хранения

При температуре не выше 25 С, в защищенном от света месте.Хранить в недоступном для детей месте!