Инструкция по применению
Монте-Р таблетки 10 мг 14 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Индия
Производитель: Хетеро Лабс
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Монтелукаст натрия
Количество в упаковке: 14
Дозировка действующего вещества: 10 мг



Описание

Квадратные с закругленными углами таблетки, покрытые пленочной оболочкой бледно оранжевого с коричневатым оттенком цвета, с гравировкой "I" на одной стороне и "114" на другой. На поперечном разрезе ядро таблетки белого или почти белого цвета.

Действующее вещество

Монтелукаст натрия

Состав

Активные вещества:монтелукаста натрия, Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 106.7 мг, маннитол - 62.2 мг, кроскармеллоза натрия - 7.5 мг, гипролоза - 0.8 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 9 мг, магния стеарат - 3.4 мг.

Форма выпуска

Таблетки

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 с 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 изоферменты цитохрома P450 CYP: 3A4 2C9 1A2 2A6 2C19 и 2D6. Выведение Период полувыведения монтелукаста у молодых здоровых взрослых составляет от 27 до 55 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 02% - 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 - 74 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 монелукаст и его метаболиты не выводятся почками фармакокинетика монелукаста 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 Монте-Р® принимают внутрь 1 раз в сутки. Если приём препарата сочетается с приёмом пищи, монелукаст следует принимать за 1 час до еды или через 2 часа после еды. Препарат назначается детям под наблюдением взрослых. Для детей от 2 лет до 5 лет: одна жевательная таблетка в дозе 4 мг один раз в сутки, перед сном. Применение жевательных таблеток монелукаста 4 мг не рекомендуется в возрасте до 2 лет. Для детей от 6 до 14 лет: одна жевательная таблетка в дозе 5 мг один раз в сутки, перед сном. Применение жевательных таблеток Монелукаст 5 мг не рекомендуется в возрасте до 6 лет. Терапевтическое действие монелукаста развивается в течение первого дня приёма препарата. Пациенту следует продолжать принимать монелукаст как в период достижения контроля за симптомами бронхиальной астмы, так и в периоды обострения бронхиальной астмы. Для лечения бронхиальной астмы препарат монелукаст следует принимать вечером. При лечении аллергических ринитов доза может приниматься в любое время суток. Пациенты, страдающие бронхиальной астмой и аллергическими ринитами, должны принимать одну таблетку препарата монелукаст 1 раз в сутки вечером. Назначение препарата монелукаст одновременно с другими видами лечения бронхиальной астмы Препарат монелукаст можно добавлять к лечению пациента бронходилататорами и ингаляционными глюкокортикостероидами. Для лечения пациентов старше 15 лет и взрослых рекомендуется использовать другие лекарственные формы монелукаста (например, таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг). Для пациентов с почечной недостаточностью, пациентов с легкими или среднетяжелыми нарушениями функции печени, а также в зависимости от пола специального подбора дозы не требуется. Монелукаст не рекомендуется в качестве монотерапии пациентам с бронхиальной астмой средней тяжести постоянного течения.

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

Назначение препарата Монте-Р® при беременности и в период лактации возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка. В ходе пострегистрационного применения препарата монтелукаст сообщалось о развитии врожденных дефектов конечностей у новорожденных, матери которых принимали препарат монтелукаст в период беременности. Большинство этих женщин также принимали другие препараты для лечения бронхиальной астмы в период беременности. Причинно-следственная связь между приемом препарата монтелукаст и развитием врожденных дефектов конечностей не установлена.

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 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 у детей профилю безопасности у взрослых и пожилых пациентов. Наиболее частыми нежелательными явлениями были чувство жажды сопливость 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

Монтелукаст можно назначать вместе с другими лекарственными средствами, традиционно применяемыми для профилактики и длительного лечения бронхиальной астмы, такими как бронходилататоры и ингаляционные глюкокортикостероиды. Рекомендуемая терапевтическая доза монтелукаста не оказывала клинически значимого эффекта на фармакокинетику следующих препаратов: теофиллина, преднизона, преднизолона, пероральных контрацептивов (этинилэстрадиол /норэтистерон 35/1), терфенадина, дигоксина и варфарина. Значение показателя площади под кривой «концентрация-время» (AUC) уменьшается у лиц, одновременно получающих фенобарбитал (приблизительно на 40%), однако коррекции режима дозирования монтелукаста таким пациентам не требуется. В исследованиях in vitro показано, что монтелукаст является потенциальным ингибитором изофермента CYP2C8 системы цитохрома P450, однако данные клинических исследований взаимодействия «препарат-препарат», включающих монтелукаст и росиглитазон (предварительный субстрат представителя медицинских препаратов, первично метаболизирующихся изоферментом CYP2C8) показали, что дозы монтелукаста не ингибируют изофермент CYP2C8 in vivo. Следовательно, монтелукаст не оказывает заметного влияния на метаболизм медицинских препаратов, метаболизирующихся этим ферментом (например, паклитаксел, росиглитазон и репаглинид). 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 изофермента как CYP 2C8, так и 2C9) демонстрируют, что гемфиброзил повышает эффект системного воздействия монтелукаста в 4,4 раза. Совместный прием итраконазола, 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 применения монтелукаста в дозах, превышающих одобренную дозу 10 мг для взрослых пациентов (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). Таким образом, при совместном приеме вместе с гемфиброзилом корректировка дозы монтелукаста не требуется. По результатам исследований in vitro не предполагается клинически значимых лекарственных взаимодействий с другими известными изоферментами CYP2C8 (например, с триметопримом). Кроме того, совместный прием монтелукаста с одним только итраконазолом не приводил к существенному повышению эффекта системного воздействия монтелукаста. Комбинированное лечение с бронходилататорами. Препарат Монте-Р® является обоснованным дополнением к монотерапии бронходилататорами, если последние не обеспечивают адекватного контроля бронхиальной астмы. По достижении терапевтического эффекта (обычно после первой дозы) от лечения препаратом монтелукаст можно начать постепенное снижение дозы бронходилататоров. Комбинированное лечение с ингаляционными глюкокортикостероидами. Лечение препаратом Монте-Р® обеспечивает дополнительный терапевтический эффект пациентам, применяющим ингаляционные глюкокортикостероиды. По достижении стабилизации состояния можно начать постепенное снижение дозы глюкокортикостероида под наблюдением врача. В некоторых случаях допустима полная отмена ингаляционных глюкокортикостероидов, однако резкая замена ингаляционных глюкокортикостероидов на препарат Монте-Р® не рекомендуется. Поскольку монтелукаст метаболизируется изоферментом CYP 3A4, следует соблюдать осторожность, особенно у детей, если монтелукаст одновременно назначается с препаратами, индуцирующими изофермент CYP 3A4, такими как фенитоин, фенобарбитал и рифампицин.

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 бронхиальной астмы (ингаляционные #2-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 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 фенилкегонурией. Пациенты с фенилкетонурией должны быть проинформированы что каждая жевательная таблетка содержит аспартам в количестве: таб. 4 мг - 08 мг таб. 5 мг - 1 мг аспартама что соответствует 045 и 056 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 родителям/опекунам необходимо объяснить что в случае появления подобных симптомов необходимо сообщить об этом лечащему врачу. Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.: 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 выполнении действий требующих быстроты психомоторных реакций.

Срок хранения после открытия

3 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения

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