# Инструкция по применению
# Сингуляр Таблетки 10 мг 14 шт

## Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Акрихин
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Монтелукаст
Количество в упаковке: 14
Дозировка действующего вещества: 10 мг
Срок годности: 24.0




## Действующее вещество

Монтелукаст

## Состав

Действующее вещество: Монтелукаст (montelukast)Концентрация действующего вещества (мг): 10

## Форма выпуска

Таблетки

## Фармакокинетика

ВсасываниеПосле приема внутрь монтелукаст быстро и практически полностью всасывается из ЖКТ. У взрослых при приеме натощак таблеток, покрытых оболочкой, в дозе 10 мг Cmax в плазме крови достигается через 3 ч. Средняя биодоступность при приеме внутрь составляет 64%.Прием пищи не влияет на Cmax в плазме крови и биодоступность препарата.РаспределениеСвязывание монтелукаста с белками плазмы крови составляет более 99%. Vd в среднем составляет 8-11 л.Исследования с радиоактивно меченым монтелукастом, проведенные на крысах, указывают на минимальное проникновение через ГЭБ. Кроме того, концентрации меченого препарата через 24 часа после введения были минимальными во всех других тканях. При приеме монтелукаста в дозе 10 мг 1 раз/сут наблюдается умеренная (около 14%) кумуляция активного вещества в плазме.МетаболизмМонтелукаст активно

метаболизируется в печени. При применении в терапевтических дозах 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 метаболизме монтелукаста участвуют изоферменты цитохрома P450: 3A4, 2C8 и 2C9. Согласно результатам исследований, проведенным in vitro в микросомах печени человека, монтелукаст в терапевтической концентрации 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 с калом в течение 5 дней и менее 0.2% - с мочой, что подтверждает, что монтелукаст и его метаболиты экскретируются почти исключительно с желчью.T1/2 монтелукаста у молодых здоровых взрослых составляет от 2.7 до 5.5 ч.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.Фармакокинетика в особых клинических случаяхФармакокинетика монтелукаста у женщин и мужчин имеет сходный характер.Не выявлено различий клинически значимых фармакокинетических эффектов у пациентов в зависимости от расовой принадлежности.При приеме внутрь таблеток, покрытых оболочкой, в дозе 10 мг 1 раз /сут фармакокинетический профиль и биодоступность имеют сходный характер у пациентов пожилого и молодого возраста.У пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести и клиническими проявлениями цирроза печени отмечено замедление метаболизма монтелукаста, сопровождающееся увеличением AUC приблизительно на 41% после однократного приема препарата в дозе 10 мг. Выведение монтелукаста у этих пациентов несколько увеличивается по сравнению со здоровыми субъектами (T1/2 в среднем составляет 7.4 ч). Изменение 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.Поскольку монтелукаст и его метаболиты не выводятся с мочой, фармакокинетика монтелукаста у пациентов с почечной недостаточностью не оценивалась. Коррекция дозы у этой категории пациентов не требуется.

**Показания**

Профилактика и длительное лечение бронхиальной астмы у взрослых и детей, начиная с 6 лет, включая предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания, лечение аспиринчувствительных пациентов с бронхиальной астмой и предупреждение бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой.Купирование дневных и ночных симптомов сезонных аллергических ринитов (у взрослых и детей с 6 лет) и постоянных аллергических ринитов (у взрослых и детей с 6 лет)

**Способ применения и дозы**

Внутрь 1 раз в сутки независимо от приема пищи. Для лечения бронхиальной астмы Сингуляр следует принимать вечером. При лечении аллергических ринитов доза может приниматься в любое время суток по желанию пациента. Пациенты, страдающие бронхиальной астмой и аллергическими ринитами должны принимать одну таблетку Сингуляра один раз в сутки вечером. Взрослые в возрасте 15 лет и старше Доза для взрослых и детей старше 15 лет составляет одну таблетку покрытую оболочкой 10 мг в сутки. Дети в возрасте от 6 до 14 лет Дозировка для детей 6-14 лет составляет одну таблетку жевательную 5 мг в сутки. Подбора дозировки для этой возрастной группы не требуется. Общие рекомендации Терапевтическое действие СИНГУЛЯРа на показатели, отражающие течение бронхиальной астмы развивается в течение первого дня. Пациенту следует продолжать принимать СИНГУЛЯР как в период достижения контроля за симптомами бронхиальной астмы, так и в периоды обострения бронхиальной астмы. Для пожилых пациентов, пациентов с почечной недостаточностью, а также пациентам с легкими или среднетяжелыми нарушениями функции печени, а также в зависимости от пола специального подбора дозы не требуется. Назначение СИНГУЛЯРа одновременно с другими видами лечения бронхиальной астмы СИНГУЛЯР можно добавлять к лечению пациента бронходилататорами и ингаляционными глюкокортикостероидами (См. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

**Противопоказания**

Повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.Детский возраст до 6 лет.

**Применение при беременности и кормлении грудью**

Клинических исследований препарата Сингуляр с участием беременных женщин не проводилось. Сингуляр следует применять при беременности и в период грудного вскармливания только в тех случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.В ходе пострегистрационного применения препарата Сингуляр сообщалось о развитии врожденных дефектов конечностей у новорожденных, матери которых принимали Сингуляр при беременности. Большинство этих женщин также принимали другие препараты для лечения бронхиальной астмы при беременности. Причинно-следственная связь между приемом препарата Сингуляр и развитием врожденных дефектов конечностей не установлена.Неизвестно, выделяется ли монтелукаст с грудным молоком. Поскольку многие лекарственные препараты выделяются с грудным молоком, необходимо учитывать это при назначении препарата Сингуляр кормящим грудью матерям.

**Побочные действия**

Реакции гиперчувствительности (включая анафилаксию, ангионевротический отек, сыпь, зуд, крапивницу и очень редко эозинофильные инфильтраты печени); узелклвую эритему, необычные яркие сновидения; галлюцинации; сонливость; раздражительность; возбуждение, включая агрессивное поведение; утомляемость; суицидальные мысли и суицидальное поведение (суицидальность); бессонница; парестезия/гипестезия и очень редко – судорожные припадки; тошнота, рвота, диарея, боли в животе; головная боль; артралгия; миалгия; мышечные судороги; тенденция к усилению кровоточивости, образованию подкожных кровоизлияний; сердцебиение; отеки.

**Передозировка**

Симптомы передозировки не выявлены в ходе клинических исследований длительного (22 недели) лечения препаратом Сингуляр взрослых пациентов с бронхиальной астмой в дозах до 200 мг/сут, либо в ходе коротких (около 1 недели) клинических исследований при приеме препарата в дозах до 900 мг/сут.Имели место случаи острой передозировки препарата Сингуляр (прием не менее 1000 мг/сут) в пострегистрационном периоде и во время клинических исследований у взрослых и детей. Клинические и лабораторные данные свидетельствовали о сопоставимости профилей безопасности препарата Сингуляр у детей, взрослых и пациентов пожилого возраста. Наиболее частыми симптомами были чувство жажды, сонливость, рвота, психомоторное возбуждение, головная боль и боль в животе. Данные побочные эффекты согласуются с профилем безопасности препарата Сингуляр.Лечение: проведение симптоматической терапии. Специальной информации о лечении передозировки препарата Сингуляр нет. Данных об эффективности перитонеального диализа или гемодиализа монтелукаста не имеется.

**Взаимодействие с другими препаратами**

Сингуляр можно назначать вместе с другими лекарственными средствами, традиционно применяемыми для профилактики и длительного лечения бронхиальной астмы и/или лечения аллергического ринита. Монтелукаст в рекомендуемой терапевтической дозе не оказывал клинически значимого эффекта на фармакокинетику следующих препаратов: теофиллин, преднизон, преднизолон, пероральные контрацептивы (этинилэстрадиол/норэтиндрон 35/1), терфенадин, дигоксин и варфарин.При одновременном приеме фенобарбитала значение AUC монтелукаста снижается примерно на 40%, но это не требует изменений режима дозирования препарата Сингуляр.В исследованиях in vitro установлено, что монтелукаст ингибирует изофермент CYP2C8. Однако при исследовании лекарственного взаимодействия in vivo монтелукаста и росиглитазона (метаболизируется при участии изофермента CYP2C8) не получено подтверждения ингибирования монтелукастом изофермента CYP2C8. Поэтому в клинической практике не предполагается влияние монтелукаста на CYP2C8-опосредованный метаболизм ряда лекарственных препаратов, в т.ч. паклитаксела, росиглитазона, репаглинида. Исследования in vitro показали, что монтелукаст является субстратом CYP2C8, 2C9 и 3A4. Данные клинического исследования лекарственного взаимодействия в отношении монтелукаста и гемфиброзила (ингибитора как CYP2C8, так и 2C9) демонстрируют, что гемфиброзил повышает эффект системного воздействия монтелукаста в 4.4 раза. Совместный прием итраконазола, мощного ингибитора CYP3A4, 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/сут для взрослых пациентов в течение 22 недель и до 900 мг/сут для пациентов, принимающих препарат в течение примерно одной недели, не наблюдалось клинически значимых отрицательных эффектов). Таким образом, при совместном приеме вместе с гемфиброзилом коррекция дозы монтелукаста не требуется. По результатам исследований in vitro, не предполагается клинически значимого лекарственного взаимодействия с другими известными ингибиторами 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 бронходилататорамиСингуляр является обоснованным дополнением к монотерапии бронходилататорами, если последние не обеспечивают адекватного контроля бронхиальной астмы. По достижении терапевтического эффекта от лечения препаратом Сингуляр, можно начать постепенное снижение дозы бронходилататоров.Комбинированное лечение с ингаляционными ГКСЛечение препаратом Сингуляр обеспечивает дополнительный терапевтический эффект у пациентов, применяющих ингаляционные ГКС. По достижении стабилизации состояния, можно начать постепенное снижение дозы ГКС под наблюдением врача. В некоторых случаях допустима полная отмена ингаляционных ГКС, однако резкая замена ингаляционных кортикостероидов на Сингуляр не рекомендуется.

**Особые указания**

Эффективность препарата Сингуляр для перорального приема в отношении лечения острых приступов бронхиальной астмы не установлена. Поэтому Сингуляр в таблетках не рекомендуется назначать для лечения острых приступов бронхиальной астмы. Пациентам должны быть даны инструкции всегда иметь при себе препараты экстренной помощи для купирования приступов бронхиальной астмы (ингаляционные бета2-агонисты короткого действия).Не следует прекращать прием препарата Сингуляр в период обострения астмы и необходимости применения для купирования приступов препаратов экстренной помощи (ингаляционных бета2-агонистов короткого действия).Пациенты с подтвержденной аллергией к ацетилсалициловой кислоте и другим НПВС не должны принимать эти препараты в период лечения препаратом Сингуляр, поскольку Сингуляр, улучшая дыхательную функцию у больных аллергической бронхиальной астмой, тем не менее, не может полностью предотвратить вызванную у них НПВС бронхоконстрикцию.Дозу ингаляционных ГКС, применяемых одновременно с препаратом Сингуляр, можно постепенно снижать под наблюдением врача, однако резкой замены ингаляционных или пероральных ГКС препаратом Сингуляр проводить нельзя.У пациентов, принимавших Сингуляр, были описаны психоневрологические нарушения. Учитывая, что эти симптомы могли быть вызваны другими факторами, неизвестно, связаны ли они с приемом препарата Сингуляр. Врачу необходимо обсудить данные побочные эффекты с пациентами и/или их родителями/опекунами. Пациентам и/или их опекунам необходимо объяснить, что в случае появления подобных симптомов необходимо сообщить об этом лечащему врачу.Уменьшение дозы системных ГКС у больных, получающих противоастматические средства, включая блокаторы лейкотриеновых рецепторов, сопровождалось в редких случаях появлением одной или нескольких следующих реакций: эозинофилия, сыпи, ухудшение легочных симптомов, кардиологические осложнения и/или невропатия, иногда диагностируемая как синдром Чарджа-Стросс, системный эозинофильный васкулит. Хотя причинно-следственной связи этих побочных реакций с терапией антагонистами лейкотриеновых рецепторов не было установлено, при снижении дозы системных ГКС у больных, получающих Сингуляр, необходимо соблюдать осторожность и проводить соответствующее клиническое наблюдение.Влияние на способность к управлению автотранспортом и работе с механизмамиДанных, свидетельствующих о том, что прием препарата Сингуляр влияет на способность управлять автомобилем или движущимися механизмами не выявлено.

**Условия хранения**

Беречь от детей