

МОНТЕЛИЗ

ИНСТРУКЦИЯ по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Монтелиз.

Международное непатентованное название: Левоцетиризин + Монтелукаст.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав: каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Монтелукаст натрия ВР экв. монтелукасту	10 мг.
Левосетиризина гидрохлорид USP	5 мг;
Вспомогательные вещества q.s.	

Краситель: диоксид титана

Фармакотерапевтическая группа: Лейкотриеновых рецепторов блокатор в комбинации с антигистаминным препаратом.

Код АТХ: R03DC53.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Левосетиризин - энантиомер цетиризина, конкурентный антагонист гистамина, блокирует H-гистаминовые рецепторы, средство к которым в 2 раза выше, чем у цетиризина. Оказывает влияние на гистаминозависимую стадию аллергических реакций, уменьшает миграцию эозинофилов, сосудистую проницаемость, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противозудное действие, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах седативное действие очень слабо выражено. Действие начинается через 12 мин после приема однократной дозы у 50 % пациентов, через 1 ч - у 95 % и продолжается в течение 24 часов.

Монтелукаст - ингибирует цистеинил лейкотриеновых рецепторов эпителии дыхательных путей, обладая тем самым одновременно способностью ингибировать бронхоспазм, обусловленный вдыханием дыма, цистеинил-лейкотриена LTD4 у пациентов с бронхиальной астмой. Дозы 5 мг достаточно для купирования бронхоспазма, индуцированного LTD4. Использование монтелукаста в дозах, превышающих 10 мг в день, принимаемых однократно, эффективность препарата не повышает. Монтелукаст вызывает бронходилатацию в течение 2-х часов после приема внутрь; и может дополнять бронходилатацию, вызванную β_2 -адреномиметиками.

Фармакокинетика:

Левосетиризин - после приема внутрь препарат быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на полную абсорбцию, хотя скорость ее уменьшается. У взрослых после однократного приема препарата в терапевтической дозе (5 мг) максимальная концентрация (Сmax) в плазме крови достигается через 0,9 ч и составляет 270 нг/мл, после повторного приема в дозе 5 мг в сутки- 308 нг/мл. Постоянный уровень концентрации достигается через 2 суток.

Левосетиризин на 90 % связывается с белками плазмы крови. Объем распределения (Vd) составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100 %. Метаболизм. В небольших количествах (< 14 %) метаболизируется в организме путем N- и O-деалкилирования (в отличие от других антагонистов H-гистаминовых рецепторов, которые метаболизируются в печени с помощью системы цитохромов) с образованием фармакологически неактивного метаболита. Из-за низкого уровня метаболизма и отсутствия метаболитического потенциала взаимодействие левосетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным.

У взрослых период полувыведения (T1/2) составляет (7,9 ± 1,9) ч; у маленьких детей T1/2 укорочен. У взрослых общий клиренс составляет 0,63 мл/мин/кг. Около 85,4 % принятой дозы препарата выводится почками в неизменном виде путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции; около 12,9 % - через кишечник.

У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина (КК) < 40 мл/мин) клиренс препарата уменьшается, а (T1/2) удлиняется (так, у больных, находящихся на гемодиализе, общий клиренс снижается на 80 %), что требует соответствующего изменения режима дозирования. Менее 10 % левосетиризина удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.

Монтелукаст быстро и практически полностью всасывается после приема внутрь. Прием обычной пищи не влияет на биодоступность и максимальную концентрацию в плазме (Сmax) таблеток покрытых оболочкой и жевательных таблеток. У взрослых при приеме натощак таблеток покрытых оболочкой 10 мг Сmax достигается через 3 часа. Биодоступность при приеме внутрь составляет 64%.

При приеме натощак таблеток жевательных 5 мг Сmax у взрослых достигается через 2 часа. Биодоступность составляет 73%.

Монтелукаст связывается с белками плазмы крови более, чем на 99%. Объем распределения монтелукаста составляет в среднем 8-11 литров. Монтелукаст активно метаболизируется в печени. При использовании терапевтических доз концентрация метаболитов монтелукаста в плазме в равновесном состоянии у взрослых и детей не определяется.

Предполагается, что в процесс метаболизма монтелукаста вовлечены изоферменты цитохрома P450 CYP (3A4 и 2C9), при этом в терапевтических концентрациях монтелукаста не ингибируют изоферменты цитохрома P450 CYP: 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6.

Клиренс монтелукаста составляет у здоровых взрослых в среднем 45 мл/мин. После перорального приема монтелукаста, 86% его количества выводится с калом в течение 5 дней и менее 0,2% - с мочой, что подтверждает то, что монтелукаст и его метаболиты экскретируются исключительно с желчью.

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 10 мг наблюдается умеренная (около 14%) кумуляция активного вещества в плазме.

Показания к применению:

- лечение симптомов круглогодичного и сезонного аллергического ринита (включая персистирующий аллергический ринит) и аллергического конъюнктивита, чихания, ринореи, слезотечения, гиперемии конъюнктивы;
- профилактика и длительное лечение бронхиальной астмы.

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к составу препарата;
- тяжелая почечная недостаточность с клиренсом креатинина менее 10 мл/мин;
- непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа, синдром мальабсорбции глюкозы и галактозы;
- детский возраст до 2 лет;
- беременность и период лактации.

Способ применения и дозы:

Внутрь 1 раз в сутки независимо от приема пищи.

Взрослые и дети старше 15 лет:

Доза для взрослых и детей старше 15 лет составляет 1 таблетку в сутки.

Для лечения бронхиальной астмы Монтелиз следует принимать вечером. При лечении аллергических заболеваний доза может приниматься в любое время суток по желанию пациента.

Дети в возрасте от 6 до 14 лет:

Дозировка для детей 6-14 лет составляет ½ таблетки в сутки. Подбора дозировки для этой возрастной группы не требуется.

Общие рекомендации:

Терапевтическое действие препарата Монтелиз на показатели, отражающие течение бронхиальной астмы развивается в течение первого дня. Пациенту следует продолжать принимать Монтелиз как в период достижения контроля за симптомами бронхиальной астмы, так и в периоды обострения бронхиальной астмы.

Для пожилых пациентов, пациентов с легкими или среднетяжелыми нарушениями функции печени, а также в зависимости от пола специального подбора дозы не требуется.

Пациентам с почечной недостаточностью: Коррекция дозы для пациентов с умеренной почечной недостаточностью (клиренс креатинина >79мл/мин) не требуется. Для пациентов с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина <79 мл / мин -> 10 мл/мин), препарат следует использовать с осторожностью и под строгим медицинским наблюдением.

Побочные действия:

Возможные побочные эффекты приведены ниже по системам организма и частоте возникновения: часто (>1/100), нечасто (≥ 1/100, ≤1/10), редко (≥1/1000, ≤1/100), очень редко (≥1/10000, ≤1/1000).

Монтелукаст

Очень часто: инфекции верхних дыхательных путей. Часто: диарея, тошнота, рвота, боли в животе, сыпь, увеличение уровня печеночных трансаминаз (АЛТ, АСТ) в плазме крови, лихорадка, головная боль. Нечасто: расстройства сна (ночные кошмары, бессонница, сомнамбулизм), раздражительность, возбуждение (включая агрессивное поведение или враждебность), депрессия, головокружение, сонливость, парестезия/гипестезия, эпилептический приступ, эпистаксис, сухость во рту, диспепсия, аллергические реакции в виде анафилаксии, крапивница, зуд, гематомы, астения, усталость, недомогание, отек, артралгия, миалгия, мышечные судороги. Редко: учащенное сердцебиение, отек Квинке, склонность к кровоточивости, носовое кровотечение, тремор, нарушение внимания, ухудшение памяти. Очень редко: эозинофильная инфильтрация паренхимы печени, гепатит (включая холестатический и гепатоцеллюлярный), узловая эритема, мультиформная эритема, галлюцинации, склонность к суициду, дезориентация, синдром Чарга-Стросса.

Левосетиризин

Очень часто: сонливость. Часто: сухость во рту, головная боль, утомляемость. Нечасто: астения, боль в животе. Очень редко: гиперчувствительность, в том числе анафилаксия, агрессия, возбуждение, судороги, нарушение зрения, учащенное сердцебиение, одышка, диспноэ, тошнота, повышение аппетита, рвота, гепатит, отек Квинке, зуд, сыпь, крапивница, миалгия, увеличение веса, дизурия, задержка мочи.

В постмаркетинговых наблюдениях были зарегистрированы очень редкие случаи следующих побочных реакций: изменение функциональных проб печени, диарея.

Передозировка:

Левосетиризин

Симптомы: сонливость, у детей - беспокойство, раздражительность

Лечение: промывание желудка, приём активированного угля, симптоматическая терапия.

Специфического антидота нет, гемодиализ неэффективен.

Монтелукаст

Симптомы: чувство жажды, сонливость, мидриаз, гиперкинезы и боль в животе.

Лечение: симптоматическое.

Данных о возможности выведения монтелукаста путем перитонеального диализа или гемодиализа нет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Левосетиризин

Теофиллин (400 мг в сутки) снижает общий клиренс левосетиризина на 16%, при этом кинетика теофиллина не изменяется.

Совместное применение с макролидами или кетоконазолом не вызвало достоверных изменений на ЭКГ. Может усилить действие средств, угнетающих центральную нервную систему и этанола.

Монтелукаст

Рекомендуемая клиническая доза монтелукаста не оказывала клинически значимого эффекта на фармакокинетику следующих препаратов: теофиллина, преднизона, преднизолона, пероральных противозачаточных средств (этинилэстрадиол / норэтиндрон 35/1), терфенадина, дигоксина и варфарина.

АУС уменьшается у лиц, одновременно получающих фенобарбитал (примерно на 40%), однако коррекция режима дозирования монтелукаста таким пациентам не требуется.

Ингалиционные глюкокортикостероиды: Лечение монтелукастом обеспечивает дополнительный терапевтический эффект пациентам, получающим лечение ингаляционными глюкокортикостероидами. При достижении стабилизации состояния пациента возможно снижение дозы глюкокортикостероидов. Дозу глюкокортикостероидов нужно снижать постепенно, под наблюдением врача. У некоторых пациентов прием ингаляционных глюкокортикостероидов может быть полностью отменен. Не рекомендуется резкая замена терапии ингаляционными глюкокортикостероидами назначением монтелукаста.

Особые указания:

Пациентам не рекомендуется использование данного комбинированного препарата, содержащего монтелукаст и левосетиризин, для лечения острых приступов астмы и держать при себе всегда наготове подходящие препараты неотложной терапии для таких случаев. При приступе пациентам следует немедленно обратиться к врачу. Не рекомендуется резко менять монтелукаст на ингаляционный или оральный кортикостероид.

Лечение препаратом не отменяет необходимость для пациентов с аспириновой астмой избегать прием аспирина и других нестероидных противовоспалительных средств.

Комбинированный препарат Монтелиз содержит лактозу, в качестве неактивного компонента, поэтому пациентам с редкими наследственными проблемами с непереносимостью галактозы, с дефицитом лактазы Лаппа или синдромом мальабсорбции глюкозы и галактозы, не рекомендуется принимать данное средство.

Требуется соблюдение осторожности при одновременном употреблении с алкоголем.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами:

При объективной оценке достоверно не отмечено влияния препарата на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами при приеме в рекомендуемой дозе. Тем не менее, в период приема препарата целесообразно воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска:

10 таблеток, покрытые пленочной оболочкой в каждом блистере алу/алу. 2 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C и в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.



Произведено для:
BELINDA Laboratories
Лондон, Великобритания
Производитель:
Анчал Лайфсайд Пвт. Лтд.
Индия