МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

СИМПЛАЕР

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: СИМПЛАЕР

Международное непатентованное название: монтелукаст

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

СОСТАВ:

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Активное вещество: монтелукаст – 10,00 мг (в виде монтелукаста натрия – 10,40 мг).

Вспомогательные вещества:

ядро: микроцелак 100 (лактозы моногидрат – 75,00 %, целлюлоза микрокристаллическая – 25,00 %) – 173,92 мг, кроскармеллоза натрия – 5,20 мг, гипролоза – 8,32 мг, магния стеарат – 4,16 мг.

пленочная оболочка: Опадрай АМВ® (поливиниловый спирт – 45,52 %, титана диоксид – 31,11 %, тальк – 20,00 %, лецитин соевый – 2,00 %, камедь ксантановая – 0,48 %, краситель железа оксид желтый – 0,84 %, краситель железа оксид красный – 0,05 %) – 6,0 мг.

ОПИСАНИЕ

Квадратные, с закругленными углами двояковыпуклые таблетки бежевого цвета, покрытые пленочной оболочкой.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА:

Противовоспалительное антибронхоконстрикторное средство – лейкотриеновых рецепторов блокатор.

Код АТХ: R03DC03

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Антагонист лейкотриеновых рецепторов. Монтелукаст ингибирует цистеинил-лейкотриеновые рецепторы эпителия дыхательных путей, проявляя одновременно способность ингибировать бронхоспазм, обусловленный вдыханием цистеинил-лейкотриена LTD_4 у пациентов с бронхиальной астмой. Дозы 5 мг достаточно для купирования бронхоспазма, индуцированного LTD_4. Применение монтелукаста в дозах, превышающих 10 мг 1 раз в сутки, не повышает эффективность препарата.

Бронхолитическое действие развивается в течение 1 суток и может дополнять бронходилатацию, вызванную бета$_2$-адреномиметиками.

Фармакокинетика

Всасывание: После приема внутрь монтелукаст быстро всасывается. Средняя максимальная концентрация в плазме (C_{max}) после приема натощак таблетки 10 мг, покрытой пленочной оболочкой, достигалась через три часа (T_{max}). Средняя биодоступность при приеме внутрь составляет 64 %. Прием обычной пищи не влияет на C_{max} в плазме крови и биодоступность препарата.

Распределение: Монтелукаст связывается с белками плазмы крови более чем на 99 %. Объем распределения в состоянии стабильного равновесия составляет в среднем 8-11 л.

Метаболизм: Монтелукаст активно метаболизируется в печени. При применении в терапевтических дозах концентрация метаболитов монтелукаста в плазме в равновесном состоянии у взрослых и детей не определяется.

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

Выведение: Клиренс монтелукаста составляет у здоровых взрослых в среднем 45 мл/мин. Период полувыведения ($T_{1/2}$) монтелукаста у молодых здоровых взрослых составляет от 2,7 до 5,5 ч. После приема монтелукаста внутрь 86 % дозы выводится через кишечник в течение 5 дней, и менее 0,2 % – почками, что подтверждает то, что монтелукаст и его метаболиты выводятся почти исключительно через кишечник.

При приеме монтелукаста в утренние и вечерние часы различий фармакокинетики не наблюдается.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

1. Профилактика и длительное лечение бронхиальной астмы, включая:

- предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания;
- лечение бронхиальной астмы у пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте;
- предупреждение бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой.

2. Облегчение симптомов сезонного и круглогодичного аллергического ринита.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- повышенная чувствительность к компонентам препарата;
- детский возраст до 15 лет;
- непереносимость сои, редкие наследственные заболевания, такие как непереносимость галактозы, дефицит лактазы или глюкозогалактозная мальабсорбция (т.к. препарат содержит лактозу).

С осторожностью: в период беременности и грудного вскармливания

Применение в период беременности и грудного вскармливания

Препарат следует применять при беременности и в период грудного вскармливания только в случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь. Взрослым и детям старше 15 лет - по 1 таблетке по 10 мг 1 раз в сутки независимо от приема пищи.

Для *лечения бронхиальной астмы* препарат следует принимать вечером. При *лечении аллергических ринитов* препарат можно принимать в любое время суток.

Терапевтическое действие препарата на показатели, отражающие течение бронхиальной астмы, развивается в течение первого дня. Пациенту следует продолжать принимать СИМПЛАЕР как в период достижения контроля симптомов бронхиальной астмы, так и в период обострения заболевания.

Для профилактики бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой у детей старше 15 лет и взрослых: по 1 таблетке 10 мг один раз в сутки, перед сном в течение 2-4 недель, при отсутствии удовлетворительного эффекта следует назначить дополнительную или альтернативную терапию.

Монтелукаст не рекомендуется в качестве монотерапии пациентам, страдающим бронхиальной астмой средней степени тяжести.

73254

Для пожилых пациентов, пациентов с почечной недостаточностью, пациентов с легкими или среднетяжелыми нарушениями функции печени специального подбора дозы не требуется.

СИМПЛАЕР можно добавлять к лечению бронходилататорами и ингаляционными глюкокортикостероидами (ГКС).

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Частота нежелательных эффектов: очень часто (≥ 10 %), часто (≥ 1 %, но < 10 %), нечасто (≥ 0,1 %, но < 1 %), редко (≥ 0,01 %, но < 0,1 %), очень редко (<0,01 %), включая отдельные сообщения.

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию, ангионевротический отек, эозинофильные инфильтраты печени.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: очень редко – повышенная кровоточивость, склонность к формированию гематом, тромбоцитопения.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головная боль; очень редко – сонливость, парестезии/гипестезии, судороги, тремор, головокружение, нарушение сна, астения/утомляемость.

Нарушения психики: часто – утомляемость; очень редко – возбудимость, агрессивное поведение, беспокойство, аномальные сновидения, галлюцинации, депрессия, бессонница, раздражительность, суицидальное мышление и поведение, сомнамбулизм.

Нарушения со стороны сердца: очень редко – ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – боль в животе, диарея, диспепсия, тошнота; очень редко – рвота, панкреатит, сухость во рту.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: редко – холестатический гепатит, повреждение гепатоцитов на фоне медикаментозной терапии или сопутствующей патологии печени (алкогольный и другие формы гепатита), повышение активности "печеночных" трансаминаз.

Нарушения со стороны костно-мышечной и соединительной ткани: очень редко – артралгия, миалгия, включая мышечные судороги.

Нарушения со стороны органов дыхательной системы: редко – фарингит, инфекции верхних дыхательных путей, кашель, синусит, отит (в т.ч. средний), ринорея, гриппоподобный синдром, носовое кровотечение.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: часто – крапивница, сыпь; очень редко – узелковая эритема, зуд.

Общие расстройства: часто – жажда, редко – недомогание, отеки, гипертермия.

В целом препарат хорошо переносится. Побочные эффекты обычно бывают легкими и, как правило, не требуют отмены лечения.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

В случае острой передозировки монтелукаста (прием не менее 1000 мг в сутки) наиболее частыми побочными эффектами были: жажда, сонливость, рвота, психомоторное возбуждение, головная боль и боль в животе, мидриаз, гиперкинезы.

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия.

Данных об эффективности перитонеального диализа или гемодиализа монтелукаста нет.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Препарат можно назначать вместе с другими лекарствами, традиционно применяемыми для профилактики и длительного лечения бронхиальной астмы. 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.

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.

Фенобарбитал ускоряет метаболизм монтелукаста в печени. При одновременном назначении пациентам фенобарбитала и монтелукаста площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) уменьшалась приблизительно на 40 %. Однако, коррекции дозы не требуется.

Комбинированное лечение с бронходилататорами:

При неэффективности бронходилататоров в качестве монотерапии бронхиальной астмы к лечению можно добавить СИМПЛАЕР. При достижении терапевтического эффекта (обычно после первой дозы) на фоне терапии монтелукастом дозу бронходилататоров можно постепенно снижать.

Комбинированное лечение с ингаляционными глюкокортикостероидами:

Применение монтелукаста обеспечивает дополнительный терапевтический эффект у пациентов, получающих ингаляционные ГКС. При достижении стабилизации состояния пациента возможно снижение дозы ГКС. Дозу ГКС следует снижать постепенно, под

наблюдением врача. В некоторых случаях прием ингаляционных ГКС может быть отменен полностью. Однако, резкая замена ингаляционных ГКС на монтелукаст не рекомендуется.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Препарат не рекомендуется назначать для лечения острых приступов бронхиальной астмы. При остром течении бронхиальной астмы пациентам следует назначать лекарственные препараты для проведения купирующей и предупреждающей приступы терапии.

Лечение монтелукастом не гарантирует абсолютную профилактику обострений, поэтому больным бронхиальной астмой рекомендуется всегда иметь при себе препараты экстренной помощи. В случае возникновения острого приступа бронхиальной астмы следует воспользоваться ингаляционным бета-агонистом быстрого действия.

Дозу применяемых одновременно с пероральным монтелукастом ингаляционных ГКС необходимо снижать постепенно под наблюдением врача. Резкая замена ингаляционных или пероральных ГКС препаратом СИМПЛАЕР недопустима.

У пациентов с аспириновой астмой лечение монтелукастом не отменяет необходимости избегать приема аспирина и других нестероидных противовоспалительных препаратов.

Уменьшение системной дозы ГКС у больных, получающих противоастматические средства, включая антагонисты лейкотриеновых рецепторов, сопровождалось в редких случаях развитием синдрома Чарга-Стросса (системного эозинофильного васкулита), проявляющегося в виде одного или нескольких из перечисленных симптомов: эозинофилии, васкулярной сыпи, усугубления симптомов со стороны легких, кардиологических осложнений и/или нейропатии. Хотя причинно-следственной связи этих нежелательных явлений с терапией антагонистами лейкотриеновых рецепторов не было установлено, при снижении системной дозы ГКС у больных, принимающих монтелукаст, необходимо соблюдать осторожность и обеспечить соответствующее врачебное наблюдение.

Возрастных различий в показателях эффективности и безопасности монтелукаста не выявлено.

ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ АВТОМОБИЛЕМ И ДРУГИМИ МЕХАНИЗМАМИ

Монтелукаст не влияет на способность управлять автомобилем и другими механизмами. Однако, в очень редких случаях у отдельных пациентов наблюдались сонливость и

головокружение. В этом случае, пациентам не рекомендуется как управление транспортными средствами, так и занятие другими видами деятельности, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 10 мг. По 14 таблеток в блистере из Al/Al. По 2 или 6 блистеров в картонной пачке вместе с инструкцией по применению.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

СРОК ГОДНОСТИ

2 года

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

По рецепту

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

Зентива Саалык Юрюнлери Санайи ве Тиджарет А.Ш., Турция

Район Кючюккарыштыран, 39780 Люлебургаз, Кыркларэли, Турция

Претензии по качеству препарата направлять
по адресу ООО «ЗЕНТИВА ФАРМА»:
119017, Москва, ул. Б. Ордынка 40, стр. 4
Тел.: +7 495-721-16-66/67/68
Факс: +7 495-721-16-69

Менеджер по регистрации
ООО «Зентива Фарма» А.Ю. Кошель

LLC "Zentiva Pharma"

МЗСР РФ
ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ
ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА
0 0 0 0 0 0 0 0 0 1