

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Монтелар, 10 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: монтелукаст.

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 10,40 мг монтелукаста натрия (что соответствует монтелукасту 10,00 мг).

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза, натрий (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Бежевые, круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, гладкие с обеих сторон.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Монтелар показан к применению у взрослых и детей старше 15 лет:

- для лечения бронхиальной астмы (в комплексной терапии) у пациентов с персистирующей бронхиальной астмой от легкой до умеренной степени тяжести, которая недостаточно контролируется приемом ингаляционных глюкокортикостероидов, а также у больных, у которых применение агонистов бета 2-адренорецепторов короткого действия «по необходимости» не обеспечивает достаточного клинического контроля бронхиальной астмы. У пациентов с бронхиальной астмой, которым показан монтелукаст, препарат также облегчает симптомы сезонного аллергического ринита.
- для профилактики бронхиальной астмы, при которой доминирующим компонентом является бронхоспазм, индуцированный физической нагрузкой.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Взрослые

Доза для взрослых составляет 1 таблетку, покрытую пленочной оболочкой, 10 мг в сутки.

Общие рекомендации

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

Препарат Монтелар может быть добавлен к лечению пациента бронходилататорами и ингаляционными глюкокортикостероидами (см. раздел 4.5).

Особые группы пациентов

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

Дети

Режим дозирования для детей от 15 до 18 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Не следует назначать (применять) препарат Монтелар у детей в возрасте от 0 до 15 лет для данной дозировки в связи с невозможностью обеспечить режим дозирования.

Способ применения

Внутрь, 1 раз в сутки, независимо от времени приема пищи.

Для лечения бронхиальной астмы препарат Монтелар следует принимать вечером.

Пациенты с бронхиальной астмой и аллергическим ринитом должны принимать 1 таблетку препарата Монтелар 1 раз в сутки, вечером.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к монтелукасту или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- редкие наследственные заболевания, такие как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- детский возраст до 15 лет (для данной лекарственной формы).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Особые указания

ВНИМАНИЕ: ВОЗМОЖНЫ ТЯЖЕЛЫЕ НЕЙРОПСИХИЧЕСКИЕ РАССТРОЙСТВА

Имеются сообщения о развитии тяжелых нейropsychических расстройств (НПР), связанных с приемом препарата Монтелар. Виды расстройств, о которых сообщалось, чрезвычайно различаются и включают в себя (но не ограничиваются ими) следующие нежелательные реакции: возбуждение, агрессивное поведение, депрессию, нарушения сна, суицидальные мысли и поведение (включая попытки суицида). Механизм развития данных НПР, связанных с применением препарата Монтелар, в настоящее время недостаточно изучен.

Поскольку имеется риск развития НПР, польза от применения препарата Монтелар может не превышать риск, связанный с его применением, у некоторых групп пациентов, особенно в

случаях, когда симптомы аллергического ринита являются умеренными или заболевание может адекватно контролироваться иными методами лечения. Следует сохранять применение препарата Монтелар только у тех пациентов с аллергическим ринитом, у которых не наблюдается ответа на альтернативные методы лечения, или они плохо переносятся.

При назначении препарата Монтелар следует обсудить с пациентом или лицами, осуществляющими уход за ним, ожидаемую пользу и возможные риски от применения данного лекарственного препарата. Следует предупредить пациента и (или) лиц, осуществляющих уход за ним, о необходимости наблюдения за изменением характера поведения или появлением каких-либо новых нейropsychических симптомов (НПС) в период приема препарата Монтелар. Если наблюдается изменение поведения пациента, появление новых НПС, либо у пациента возникают суицидальные мысли и (или) поведение, необходимо прекратить прием препарата Монтелар и незамедлительно связаться с медицинским работником.

Эффективность монтелукаста для приема внутрь в отношении лечения острых приступов бронхиальной астмы не установлена, поэтому препарат Монтелар 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 Монтелар в период обострения астмы и необходимости применения препаратов экстренной помощи для купирования приступов (ингаляционных бета₂-агонистов короткого действия).

Пациенты с подтвержденной аллергией к ацетилсалициловой кислоте и другим нестероидным противовоспалительным препаратам (НПВП) не должны принимать эти препараты в период лечения препаратом Монтелар, поскольку препарат Монтелар, улучшая дыхательную функцию у больных с аллергической бронхиальной астмой, тем не менее, не может полностью предотвратить вызванную у них НПВП бронхоконстрикцию.

Дозу ингаляционных глюкокортикостероидов, принимаемых одновременно с препаратом Монтелар, можно постепенно снижать под наблюдением врача, однако резкой замены ингаляционных или пероральных глюкокортикостероидов препаратом Монтелар проводить нельзя.

В редких случаях пациенты, получавшие противоастматические препараты, включая антагонисты лейкотриеновых рецепторов, испытывали одно или несколько нежелательных явлений из нижеперечисленных: эозинофилия, сыпь, ухудшение легочных симптомов, кардиологические осложнения и/или нейропатия, иногда диагностируемых как синдром Чарджа-Стросс (системный эозинофитный васкулит). Эти случаи иногда были связаны со снижением дозы или отменой терапии пероральными кортикостероидами. Хотя причинно-следственной связи этих нежелательных явлений с терапией антагонистами лейкотриеновых рецепторов не было установлено, у пациентов, принимающих препарат Монтелар, необходимо соблюдать осторожность: у таких пациентов необходимо проводить соответствующее клиническое наблюдение.

Применение у пожилых пациентов

Различий в профилях эффективности и безопасности препарата Монтелар, связанных с возрастом пациентов, не выявлено.

Вспомогательные вещества

Препарат Монтелар содержит лактозу

Данный лекарственный препарат не следует принимать пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

Препарат Монтелар содержит натрий

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия в одной таблетке, покрытой пленочной оболочкой, то есть, по сути, не содержит натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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/норэтинстерон 35/1), терфенадина, дигоксина и варфарина.

Значение показателя площади под кривой «концентрация-время» (AUC) уменьшается у лиц, одновременно получающих фенobarбитал (приблизительно на 40%), однако коррекции режима дозирования монтелукаста таким пациентам не требуется.

В исследованиях *in vitro* установлено, что монтелукаст является потенциальным ингибитором изофермента CYP 2C8 системы цитохрома P450, однако данные клинических исследований взаимодействия «препарат-препарат», включающих монтелукаст и росиглитазон (метаболизируется с участием изофермента CYP 2C8 системы цитохрома P450) было показано, что монтелукаст не ингибировал изофермент CYP 2C8. Следовательно, монтелукаст не оказывает заметного влияния на метаболизм лекарственных препаратов, метаболизирующихся этим ферментом (например, паклитаксел, росиглитазон и репаглинид).

Исследования *in vitro* показали, что монтелукаст является субстратом CYP 2C8, 2C9 и 3A4. Данные клинического исследования лекарственного взаимодействия в отношении монтелукаста и гемфиброзила (ингибитора как CYP 2C8, так и 2C9) демонстрируют, что гемфиброзил повышает эффект системного воздействия монтелукаста в 4,4 раза. Совместный прием интраконазола, сильного ингибитора CYP 3A4, вместе с гемфибросилом 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, 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 гемфибросилом корректировка дозы монтелукаста не требуется. По результатам исследований *in vitro* не предполагается клинически значимых лекарственных взаимодействий с другими известными ингибиторами CYP 2C8 (например, с триметопримом). Кроме того, совместный

прием монтелукаста с одним только интраконазолом не приводил к существенному повышению эффекта системного воздействия монтелукаста.

Комбинированное лечение с бронходилататорами.

Препарат Монтелар 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 Монтелар можно начать постепенное снижение дозы бронходилататоров.

Комбинированное лечение с ингаляционными глюкокортикостероидами.

Лечение препаратом Монтелар 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 Монтелар не рекомендуется.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применение препарата Монтелар 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 монтелукаста сообщалось о развитии врожденных дефектов конечностей у новорожденных, матери которых принимали монтелукаст в период беременности. Большинство этих женщин также принимали другие препараты для лечения бронхиальной астмы в период беременности. Причинно-следственная связь между приемом монтелукаста и развитием врожденных дефектов конечностей не установлена.

Лактация

Неизвестно, выделяется ли монтелукаст с грудным молоком. Поскольку многие лекарственные препараты выделяются с грудным молоком, необходимо учитывать это при назначении препарат Монтелар кормящим грудью женщинам.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Данных, свидетельствующих о том, что прием монтелукаста влияет на способность управлять автомобилем или движущимися механизмами, не выявлено. Однако сообщалось о сонливости и головокружениях, поэтому при появлении этих признаков пациентам не рекомендуется как управление транспортными средствами, так и занятие другими видами деятельности, требующими концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

В целом препарат Монтелар хорошо переносится. Побочные эффекты обычно бывают легкими и, как правило, не требуют отмены препарата. Общая частота побочных эффектов при лечении препаратом Монтелар сопоставима с их частотой при приеме плацебо.

Дети в возрасте от 2 до 5 лет с бронхиальной астмой

В 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 получили лечение монтелукастом в течение как минимум 3 месяцев, 230 – 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 ринитом

В 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 препарата 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 $\geq 1\%$ пациентов, принимавших монтелукаст, и чаще, чем в группе пациентов, принимавших плацебо.

Дети в возрасте от 6 до 14 лет с бронхиальной астмой

Профиль безопасности препарата у детей был в целом схож 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 астмой

В двух 12-недельных плацебо-контролируемых клинических исследованиях с аналогичным дизайном единственными НЯ, оцененными как связанные с приемом препарата, наблюдавшиеся у $\geq 1\%$ пациентов, принимавших монтелукаст, и чаще, чем в группе пациентов, принимавших плацебо, были боли в животе и головная боль. Различие по частоте между двумя группами лечения было 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 ринитом

Монтелукаст 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 $\geq 1\%$ 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 ринитом

Монтелукаст 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 $\geq 1\%$ 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 исследований

Был 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 применением 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;1,36]).

Резюме нежелательных реакций

По данным Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ) нежелательные явления классифицированы в соответствии с их частотой развития следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нежелательные реакции, о которых сообщалось в период постмаркетингового применения препарата, перечислены ниже в соответствии с системно-органными классами и специфическими нежелательными реакциями. Категории частоты были оценены на основе соответствующих клинических исследований.

Инфекции и инвазии

очень часто: инфекции верхних дыхательных путей¹.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

редко: повышенная склонность к кровотечениям;

очень редко: тромбоцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы

нечасто: реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию;

очень редко: эозинофильная инфильтрация печени.

Психические нарушения

нечасто: агитация, включая агрессивное поведение или враждебность, тревожность, депрессия, патологические сновидения, бессонница, психомоторная гиперактивность (включая раздражительность, беспокойство и тремор²), сомнамбулизм;

редко: нарушение внимания, нарушение памяти, тик;

очень редко: галлюцинации, дезориентация, дисфемия, суицидальные мысли и поведение (суицидальность), обсессивно-компульсивные симптомы.

Нарушения со стороны нервной системы

нечасто: головокружение, сонливость, парестезия/гипестезия;

очень редко: судороги.

Нарушения со стороны сердца

редко: учащенное сердцебиение.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

нечасто: носовые кровотечения;

очень редко: синдром Чарджа-Стросс (см. раздел 4.4), легочная эозинофилия.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

часто: диарея³, тошнота³, рвота³;

нечасто: диспепсия;

частота неизвестна: панкреатит.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

часто: увеличение активности аланинаминотрансферазы (АЛТ) и аспартатаминотрансферазы (АСТ) в крови;

очень редко: гепатит (включая холестатические, гепатоцеллюлярные и смешанные поражения печени).

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

часто: высыпания³;

нечасто: склонность к формированию гематом, зуд, крапивница;

редко: ангионевротический отек;

очень редко: узловатая эритема, многоформная эритема.

Нарушения со стороны мышечной, костной и соединительной ткани

нечасто: артралгия, миалгия, включая мышечные судороги.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

нечасто: энурез у детей.

Общие нарушения и реакции в месте введения

часто: астения (слабость)/усталость, отеки, пирексия³.

¹ Данная нежелательная реакция, которая была отнесена к категории «очень часто» у пациентов, получавших монтелукаст, также была отнесена к категории «очень часто» у пациентов, получавших плацебо в клинических исследованиях.

² Категория частоты: редко.

³ Данная нежелательная реакция, которая была отнесена к категории «часто» у пациентов, получавших монтелукаст, также была отнесена к категории «часто» у пациентов, получавших плацебо в клинических исследованиях.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 (800) 550 99 03

E-mail: pharm@roszdravnadzor.gov.ru или npr@roszdravnadzor.gov.ru

www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы

Данных о симптомах передозировки при приеме монтелукаста пациентами с бронхиальной астмой в дозе, превышающей 200 мг в сутки в течение 22 недель и в дозе 900 мг в сутки в течение 1 недели, не выявлено.

Имеются сообщения об острой передозировке монтелукаста у детей и взрослых (прием не менее 1000 мг препарата в сутки). Клинические и лабораторные данные при этом свидетельствуют о соответствии профиля безопасности монтелукаста у детей профилю безопасности у взрослых и пожилых пациентов. Наиболее частыми симптомами были чувство жажды, сонливость, рвота, мидриаз, гиперкинезы, психомоторное возбуждение, головная боль и боль в животе.

Лечение

Проведение симптоматической терапии.

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

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: средства для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей; другие средства системного действия для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей; блокаторы лейкотриеновых рецепторов.

Код АТХ: R03DC03.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Цистеинил лейкотриены (LTC_4 , LTD_4 , LTE_4) являются сильными медиаторами воспаления – эйкозаноидами, которые выделяются разными клетками, в том числе тучными клетками эозинофилами. Эти важные проагматические медиаторы связываются с цистеинил лейкотриеновыми рецепторами ($CysLT$). Цистеинил лейкотриеновые рецепторы 1 типа ($CysLT_1$ -рецепторы) присутствуют в дыхательных путях человека (в том числе, в клетках гладких мышц бронхов, макрофагах) и других клетках провоспаления (включая эозинофилы и некоторые миелоидные стволовые клетки). Цистеинил лейкотриены ($CysLT$ s) коррелируют с патофизиологией бронхиальной астмы и аллергического ринита. При астме лейкотриенопосредованные эффекты включают бронхоспазм, увеличение секреции слизи, повышение проницаемости сосудов и увеличение количества эозинофилов. При аллергическом рините после воздействия аллергена происходит высвобождение $CysLT$ s из провоспалительных клеток слизистой оболочки полости носа во время ранней и поздней фаз аллергической реакции, что проявляется симптомами аллергического ринита. При интраназальной пробе с $CysLT$ s было продемонстрировано повышение резистентности воздухоносных путей носа и симптомов назальной обструкции.

Монтелукаст – высокоактивное при приеме внутрь лекарственное средство, которое значительно улучшает показатели воспаления при бронхиальной астме. По данным биохимического и фармакологического анализа монтелукаст с высоким сродством и избирательностью связывается с $CysLT_1$ – рецепторами, не взаимодействуя с другими фармакологически важными рецепторами в дыхательных путях (таких как простагландиновые, холинергические или β -адренергические рецепторы). Монтелукаст ингибирует физиологическое действие LTC_4 , LTD_4 , LTE_4 путем связывания с $CysLT_1$ -рецепторами, не оказывая стимулирующего действия на данные рецепторы.

Монтелукаст ингибирует $CysLT_1$ -рецепторы в дыхательных путях, что подтверждается способностью блокировать развитие бронхоспазма в ответ на вдыхание LTD_4 у пациентов с бронхиальной астмой. Дозы 5 мг достаточно для купирования бронхоспазма, индуцированного LTD_4 .

Монтелукаст вызывает бронходилатацию в течение 2-х часов после приема внутрь и может дополнять бронходилатацию, вызванную β -адреномиметиками.

Применение монтелукаста в дозах, превышающих 10 мг в день, принимаемых однократно, эффективность препарата не повышает.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Монтелукаст быстро и практически полностью всасывается после приема внутрь из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Прием пищи не влияет на биодоступность и максимальную концентрацию ($C_{\max}$) в плазме крови. Биодоступность при приеме внутрь составляет 64%. После приема таблетки, покрытой пленочной оболочкой, 10 мг, время достижения максимальной концентрации ($T_{C_{\max}}$) – 3 ч.

Распределение

Монтелукаст связывается с белками плазмы крови более чем на 99%. Средний объем распределения монтелукаста 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.

Биотрансформация

Монтелукаст активно метаболизируется в печени. При использовании терапевтических доз препарата концентрация метаболитов монтелукаста в плазме крови в равновесном состоянии у взрослых и детей не определяется.

Предполагается, что в процесс метаболизма монтелукаста вовлечены изоферменты цитохрома P450 CYP (3A4, 2C8 и 2C9), при этом в терапевтических концентрациях монтелукаст не ингибирует изоферменты CYP: 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6.

Элиминация

Плазменный клиренс – 45 мл/мин. После перорального приема монтелукаст практически полностью выводится через кишечник (около 86%) и менее 0,2% – почками, что подтверждает, что монтелукаст и его метаболиты экскретируются почти исключительно с желчью.

Период полувыведения монтелукаста ($T_{1/2}$) 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 10 мг монтелукаста 1 раз в сутки наблюдается умеренная (около 14%) кумуляция активного вещества в плазме.

Особые группы пациентов

Пол

Фармакокинетика монтелукаста у женщин и мужчин имеет сходный характер.

Пациенты пожилого возраста

При однократном приеме внутрь 10 мг монтелукаста фармакокинетический профиль и биодоступность сходны у пациентов пожилого и молодого возраста. $T_{1/2}$ монтелукаста из плазмы

крови несколько длиннее у пациентов пожилого возраста. Коррекции дозы монтелукаста у пациентов пожилого возраста не требуется.

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 монтелукаста в дозе 10 мг. Выведение монтелукаста у этих пациентов несколько увеличивается по сравнению со здоровыми субъектами (среднее время полувыведения – 7,4 часа). Изменения дозы монтелукаста для пациентов с печеночной недостаточностью легкой или 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 монтелукаст и его метаболиты не экскретируются почками, фармакокинетика монтелукаста у пациентов с почечной недостаточностью не оценивалась. Коррекции дозы монтелукаста для этой группы пациентов не требуется.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

- лактозы моногидрат;
- гидроксипропилцеллюлоза, тип EF;
- целлюлоза микрокристаллическая;
- кроскармеллоза натрия;
- магния стеарат.

Состав пленочной оболочки «опадрай бежевый II»:

- поливиниловый спирт;
- титана диоксид (E 171);
- макрогол 4000;
- тальк;
- краситель железа оксид желтый (E 172);
- краситель железа оксид красный (E 172).

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в оригинальной упаковке (блистер в пачке) при температуре не выше 30 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

Первичная упаковка

По 7 или 10 таблеток помещают в блистер из алюминия и ОПА/алюминий/ПВХ.

Вторичная упаковка

По 2 или 4 блистера по 7 таблеток помещают в картонную пачку вместе с инструкцией по медицинскому применению.

По 1 или 3 блистера по 10 таблеток помещают в картонную пачку вместе с инструкцией по медицинскому применению.

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Словения

Сандоз д.д.

Веровшкова 57, 1000 Любляна;

Телефон: +386 1 580 3332,

Факс: +386 1 568 3517.

E-mail: info.sandoz@sandoz.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

АО «Сандоз»

125315, г. Москва, Ленинградский проспект, д. 70;

Телефон: +7 (495) 660 75 09;

Факс: +7 (495) 660 75 10.

E-mail: adverse.event.russia@sandoz.com (для нежелательных явлений)

E-mail: complaint.eaeu@sandoz.com (для претензий по качеству)

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 20.01.2026 № 771
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Монтелар доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC.