УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета контроля медицинской и
фармацевтической деятельности
Министерства здравоохранения
социального развития
Республики Казахстан
от «_10_» ____12_____ 2015 г.
№ ___1403____

Инструкция по медицинскому применению
лекарственного средства

КЛАСТ® 5
КЛАСТ® 10

Торговое название
КЛАСТ® 5
КЛАСТ® 10

Международное непатентованное название
Монтелукаст

Лекарственная форма
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 5 мг и 10 мг

Состав
Одна таблетка содержит
активное вещество – натрия монтелуказта 5.2 мг и 10.4 мг,
эквивалентно монтелукасту 5 мг и 10 мг,
вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая PH 102, лактозы моногидрат, натрия кроскармеллоза, гидроксипропилцеллюлоза SL, магния стеарат,
состав оболочки Sepifilm LP 770: метилгидроксипропилцеллюлоза, целлюлоза микрокристаллическая, кислота стеариновая, титана диоксид (E171).

Описание
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, продолговатой формы, двояковыпуклые, с маркировкой цифры «5» на одной стороне (для дозировки 5 мг).

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, овальной формы, двояковыпуклые (для дозировки 10 мг).

Фармакотерапевтическая группа
Препараты для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей. Другие препараты для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей для системного использования. Лейкотриеновых рецепторов антагонисты. Монтелукаст.
Код АТХ R03DC03

Фармакологические свойства
Фармакокинетика
При пероральном применении монтелукаст быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта. После приема внутрь натощак 10 мг препарата взрослыми пациентами средняя пиковая концентрация в плазме достигается в течение 3-4 часов.
Монтелукаст более чем на 99 % связывается с белками плазмы. Объем распределения составляет в среднем 8 – 11 л. Биодоступность при приеме внутрь составляет 64%.
Монтелукаст активно метаболизируется в печени с использованием микросомальных ферментов цитохром Р450 3А4 и 2С9.
Период полувыведения составляет 2,7–5,5 ч. Фармакокинетика монтелуката в дозах до 50 мг почти линейна. После приема 10 мг монтелуката один раз в день наблюдается умеренная кумуляция (концентрация активного вещества в плазме составляла примерно 14%).
Клиренс у взрослых примерно 45 мл/мин. Монтелукаст и его метаболиты почти полностью выводятся с желчью.
Фармакокинетика и биодоступность однократной пероральной дозы 10 мг монтелуката у пожилых и молодых сходны. Период полувыведения монтелуката у пожилых несколько увеличивается, однако коррекция дозы в этой возрастной группе не требуется.
У пациентов с легкой умеренной печеночной недостаточностью и циррозом после приема однократной дозы монтелуката 10 мг среднее значение площади под кривой было на 41% больше, элиминация была несколько дольше, чем у здоровых добровольцев (средний период полувыведения – 7,4 ч). Корректировка дозы у пациентов с легкой – умеренной печеночной недостаточностью не требуется. Фармакокинетика монтелуката у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью или гепатитом не исследовалась.
Так как монтелукаст и его метаболиты не выводятся с мочой, фармакокинетика монтелуката у пациентов с почечной недостаточностью не исследовалась. Корректировка дозы у этих пациентов не требуется.
Фармакодинамика

Монтелукаст - селективный антагонист рецепторов лейкотриена D4 (цистенил лейкотриена CysLT1) - наиболее мощного медиатора хронического персистирующего воспаления, поддерживающего гиперреактивность бронхов при бронхиальной астме. Цистеинил лейкотриены (LTC_4, LTD_4, LTE_4) являются воспалительными эйкозаноидами, выделяемыми тучными клетками и различными другими клетками, включая эозинофилы. Эти важные проастматические медиаторы связываются с рецепторами цистеинил лейкотриена ($CysLT_1$) в дыхательных путях и вызывают такие явления, как бронхоконстрикция, гиперсекреция слизи, повышение проницаемости сосудистой стенки и скопление эозинофилов. Цистеинил лейкотриены играют важную роль в развитии симптомов аллергического ринита.
На ранней и поздней фазах аллергической реакции после воздействия аллергена в слизистой носа высвобождаются цистеинил лейкотриены.
Их эффект проявляется в ухудшении проходимости полости носа и усилении заложенности носа. Монтелукаст, проявляя высокий аффинитет, селективно связывается с рецепторами $CysLT_1$ (вместо других фармакологически значимых рецепторов дыхательных путей, таких как рецепторы простаноидов, холино- или β-адренорецепторы) и, таким образом, ингибирует физиологическое действие LTD_4, вызывая бронходилатирующее действие.
Монтелукаст в небольших дозах до 5 мг ингибировал бронхоконстрикцию, вызванную ингаляционным введением LTD_4. В течение 2 часов после приема внутрь наблюдалась бронходилатация, уменьшалась степень выраженности аллергической реакции ранней и поздней фаз, вызванной воздействием антигена.

Показания к применению
- лечение и профилактика бронхиальной астмы, включая предупреждение дневных и ночных симптомов заболевания, в том числе аспиринчувствительных пациентов с бронхиальной астмой и предупреждение бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой
- лечение сезонного аллергического ринита

Способ применения и дозы
Для взрослых и подростков старше 15 лет назначается КЛАСТ® 10 один раз в сутки, а для детей в возрасте 6-14 КЛАСТ® 5 один раз в сутки. Препарат принимается независимо от приема пищи.
При сезонном аллергическом рините – время приема пациент определяет по своему усмотрению.
Для лечения бронхиальной астмы препарат следует принимать вечером. Больные, страдающие одновременно астмой и сезонным аллергическим

ринитом, должны принимать препарат однократно вечером. Продолжительность курса лечения определяет лечащий врач.

Общие рекомендации

Терапевтическое действие препарата на показатели, отражающие течение бронхиальной астмы, проявляется в течение первого дня.

Пациенту следует продолжать принимать препарат как в период достижения контроля за симптомами бронхиальной астмы, так и в периоды обострения бронхиальной астмы.

Для пожилых пациентов с почечной или печеночной недостаточностью легкой, умеренной степени, коррекция дозы не требуется.

Побочные действия

Часто:

- повышение температуры тела, слабость
- кашель, заложенность носа
- боли в животе, гастроэнтерит, тошнота, рвота, диспепсия, понос
- кожная сыпь
- реакции повышенной чувствительности, (анафилаксия, ангионевротический отек, зуд, крапивница)
- головная боль, головокружение, аномальные сновидения, сомнамбулизм, дезориентация, сонливость, раздражительность, беспокойство, галлюцинации, агрессивное поведение, парестезии/гипестезии, утомляемость
- мышечные судороги, миалгия, артралгия
- кровотечение, гематомы
- отеки

редко:

- эозинофильная инфильтрация печени
- системная эозинофилия, симптомы васкулита (сходного с синдромом Churg Strauss при лечении системными кортикостероидами, чаще при уменьшении дозы пероральных кортикостероидов)
- суицидальные намерения и поведение (попытки суицида)
- учащенное сердцебиение
- инфекция верхних дыхательных путей (ларингит, фарингит)

очень редко:

- панкреатит
- повышение уровня (АлАТ, АсАТ) в крови
- холестатический гепатит

Противопоказания

- повышенная чувствительность к монтелукасту или любому другому компоненту препарата
- фенилкетонурия

- врожденная недостаточность лактазы, глюкозо/галактозная мальабсорбция, наследственная непереносимость фруктозы.
- беременность и период лактации
- КЛАСТ®10 противопоказан детям до 15 лет
- КЛАСТ®5 противопоказан детям до 6 лет

Лекарственные взаимодействия

КЛАСТ® может применяться с другими препаратами для профилактики и длительного лечения астмы без усиления побочных эффектов.

КЛАСТ® в рекомендованной дозе не вызывал клинически значимых изменений фармакокинетики следующих препаратов: теофиллин, преднизон, преднизолон, оральные контрацептивы (норэтиндрон 1 мг/этинилэстрадиол 35 мкг), терфенадин, дигоксин, варфарин.

Площадь под кривой концентрации в плазме крови (AUC) снижалась приблизительно у 40% пациентов при совместном введении фенобарбитала, однако коррекции режима дозирования препарата КЛАСТ® таким пациентам не требуется.

Поскольку монтелукаст метаболизируется при помощи CYP A4, следует соблюдать осторожность, особенно у детей, когда КЛАСТ® применяется совместно с индукторами CYP 3A4, такими как фенитоин, фенобарбитал и рифампицин.

Лечение бронходилататорами: КЛАСТ® можно добавить к лечению пациентов, у которых бронхиальная астма не контролируется применением одних бронходилататоров. При достижении терапевтического эффекта (обычно после первой дозы) на фоне терапии препаратом КЛАСТ®, дозу бронходилататоров можно постепенно снижать.

Ингаляционные глюкокортикостероиды: Лечение препаратом КЛАСТ® 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 КЛАСТ®.

Препараты, содержащие зверобой продырявленный, могут снижать уровень монтелукаста в плазме крови.

Особые указания

КЛАСТ® не предназначен для купирования бронхоспазма при острых приступах астмы, а также для лечения астматического статуса.

При остром течении бронхиальной астмы рекомендуется применять соответствующие препараты для лечения пациентов. В острой фазе бронхиальной астмы лечение КЛАСТ® можно продолжать.
Даже при постепенном контролируемом снижении дозы ингаляционного глюкокортикостероида сразу назначать КЛАСТ® вместо ингаляционного кортикостероида не следует.
Уменьшение системной дозы или отмена глюкокортикостероидов у больных, получающих противоастматические средства, включая блокаторы лейкотриеновых рецепторов, сопровождалось в редких случаях появлением одного или нескольких из нижеперечисленных явлений: эозинофилии, васкулярной сыпи, ухудшения легочных симптомов, кардиологических осложнений и/или нейропатии, иногда диагностируемой как синдром Чарга-Стросса – системный эозинофильный васкулит. Связь между лечением антагонистами рецепторов лейкотриена и возникновением синдрома Чарга-Стросса нельзя исключить или подтвердить. В случае появления таких симптомов, как эозинофилия, сыпь, ухудшение легочных симптомов, кардиологические осложнения и/или нейропатия, необходимо дополнительное обследование и пересмотр тактики лечения.
У пациентов с аспирин-чувствительной астмой лечение монтелукастом не влияет на необходимость применения аспирина или других нестероидных противовоспалительных средств.
Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять автотранспортом или потенциально опасными механизмами
КЛАСТ® может вызывать головную боль, сонливость, вялость, медлительность. Это следует учитывать при необходимости применения препарата у лиц, деятельность которых связана с управлением автомобилем, обслуживанием машин и механизмов, с выполнением работ в неустойчивом положении.

Передозировка
Симптомы: обезвоживание, сонливость, мидриаз, гиперкинезия, боль в животе.
Лечение - отмена препарата, симптоматическое лечение. Данных о возможности выведения монтелукаста путем перитонеального диализа или гемодиализа нет.

Форма выпуска и упаковка
По 14 таблеток помещают в контурную ячейковую упаковку из форматуры алюминиевой и фольги алюминиевой печатной.
По 1 или 2 контурной упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в пачку картонную с голограммой фирмы – производителя

Условия хранения
Хранить при температуре не выше 25 ºС, в сухом, защищенном от света месте.
Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения
3 года
Не применять после истечения срока хранения

Условия отпуска из аптек
По рецепту

Производитель
АО «Нобел Алматинская Фармацевтическая Фабрика»
Республика Казахстан,
г. Алматы, ул. Шевченко 162 Е.

Владелец регистрационного удостоверения
АО «Нобел Алматинская Фармацевтическая Фабрика»
Республика Казахстан

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству продукции (товара)
АО «Нобел Алматинская Фармацевтическая Фабрика»
Республика Казахстан, г. Алматы, ул. Шевченко 162 Е.
Номер телефона: (+7 727) 399-50-50
Номер факса: (+7 727) 399-60-60
Адрес электронной почты nobel@nobel.kz
12.05.2015