



Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Лесон.

Международное непатентованное название: монтелукаст + левоцетиризин.

Лекарственная форма: суспензия для приема внутрь.

Состав: каждые 5 мл содержат:

Монтелукаст натрия ВР экв. монтелукасту	4 мг;
Левецетиризина дигидрохлорид	2,5 мг;
Ароматизированная сиропная основа	q.s.
Краситель: желтый закат FCF.	

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

Код АТХ: R03DC53.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Монтелукаст - ингибирует цистеинил лейкотриеновых рецепторов эпителия дыхательных путей, обладая тем самым одновременно способностью ингибировать бронхоспазм, обусловленный вдыханием цистеинил-лейкотриена LTD₄ у пациентов с бронхиальной астмой. Дозы 5 мл достаточно для купирования бронхоспазма, индуцированного LTD₄. Использование монтелукаста в дозах, превышающих 10 мл в день, принимаемых однократно, эффективность препарата не повышает.

Левецетиризин - энантиомер цетиризина, конкурентный антагонист гистамина, блокирует H₁-гистаминовые рецепторы, сродство 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 антихолинэргического 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.

Фармакокинетика:

Монтелукаст после приема внутрь быстро и практически полностью всасывается из ЖКТ. У взрослых при приеме в дозе 5-10 мл C_{max} в плазме крови достигается через 2-3 ч. Биодоступность при приеме внутрь составляет 64-73%.

Связывание монтелукаста с белками плазмы составляет более 99%. V_d в среднем составляет 8-11 л.

При однократном приеме в дозе 10 мл 1 раз в сутки наблюдается умеренная (около 14%) кумуляция активного вещества в плазме.

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 процессе метаболизма монтелукаста участвуют изоферменты CYP3A4 и CYP2C9, при этом в терапевтических концентрациях монтелукаст не ингибирует изоферменты CYP3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 и 2D6.

T_{1/2} монтелукаста у молодых здоровых взрослых составляет от 2,7 до 5,5 ч. Клиренс монтелукаста составляет у здоровых взрослых в среднем 45 мл/мин. После перорального приема монтелукаста 86% выводится с калом в течение 5 дней и менее 0,2% - с мочой, что подтверждает то, что монтелукаст и его метаболиты выводятся почти исключительно с желчью.

Фармакокинетика монтелукаста сохраняет практически линейный характер при приеме внутрь в дозах более 50 мл.

Левецетиризин быстро всасывается при применении внутрь, прием пищи не влияет на степень всасывания, но снижает его скорость. Биодоступность достигает 100%.

У 50% больных действие препарата развивается через 12 мин после приема одноразовой дозы, а у 95% - через 0,5-1 час. Максимальная концентрация (C_{max}) в сыворотке достигается через 50 мин после одноразового приема внутрь терапевтической дозы и удерживается на протяжении 2 дней. C_{max} составляет 207 нг/мл после одноразового применения и 308 нг/мл - после повторного применения в дозе 5 мг соответственно. Связывание с белками плазмы - 90%. Метаболиту подвергается приблизительно 14% левецетиризина. Период полувыведения составляет 7,9 ± 1,9 часов, общий клиренс - 0,63 мл/мин/кг. Не накапливается, полностью выводится из организма за 96 часов. 85,4% дозы препарата выводится в неизменном виде с мочой, приблизительно 12,9% - с фекалиями.

Показания к применению:

• лечение симптомов круглогодичного и сезонного аллергического ринита (включая персистирующий аллергический ринит) и аллергического конъюнктивита, чихание, ринорея, слезотечение, гиперемия конъюнктивы;

• профилактика и длительное лечение бронхиальной астмы.

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к препарату;
- детский возраст до 2 лет;
- тяжелая форма хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина < 10 мл/мин).

Беременность и период лактации:

Не применяют в период беременности, в связи с отсутствием достоверных данных о влиянии препарата на плод и течение беременности. В период лактации назначение препарата Лесон возможно только после решения вопроса об отмене грудного вскармливания, так как левецетиризин проникает в грудное молоко.

Способ применения и дозы:

Внутрь, во время еды или натощак.

Рекомендуемая доза *взрослым и детям старше 6 лет, пожилым пациентам* (при условии нормальной функции почек) - 10 мл 1 раз в день.

Детям от 2 до 6 лет - 2,5 мл 1 раз в день.

Курс лечения составляет 14 дней.

Побочные действия:

Со стороны свертывающей системы крови: повышение склонности к кровотечениям.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, в т.ч. анафилаксия; очень редко (<1/10 000) - эозинофильная инфильтрация печени.

Со стороны психики: агитация (в т.ч. агрессивное поведение или враждебность), тревожность, депрессия, дезориентация, патологические сновидения, галлюцинации, бессонница, раздражительность, беспокойство, социальная интроверсия, суицидальные мысли и поведение (суицидальность), тремор.

Со стороны нервной системы: головокружение, сонливость, парестезия/гипестезия; очень редко (< 1/10 000) - судороги.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия.

Со стороны дыхательной системы: носовые кровотечения, инфекции верхних дыхательных путей.

Со стороны пищеварительной системы: диарея, диспепсия, тошнота, рвота, панкреатит, увеличение активности АЛТ и АСТ в крови; очень редко (<1/10 000) - гепатит (включая холестатические, гепатоцеллюлярные и смешанные поражения печени).

Со стороны кожи и подкожных тканей: склонность к формированию гематом, узловатая эритема, многоформная эритема, зуд, сыпь.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, крапивница.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия, включая мышечные судороги.

Со стороны организма в целом: астения (слабость), усталость, отеки, пирексия.

Передозировка:

Левецетиризин:

Симптомы: сонливость, у детей - беспокойство, раздражительность.

Лечение: промывание желудка, активированный уголь, 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:

Левецетиризин:

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

Совместное применение с макролидами или кетоконазолом не вызывало достоверных изменений на ЭКГ. Может усиливать 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 коррекции режима дозирования монтелукаста таким пациентам не требуется.

Ингаляционные 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:

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 астмы терапии.

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:

Суспензия для приема внутрь 60 мл в стеклянной бутылке янтарного цвета. Одна бутылка вместе с инструкцией по применению и мерным стаканчиком в картонной упаковке.

Условия хранения:

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

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.