



ЛЕСОН

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Лесон.

Международное непатентованное название: левоцетиризин + монтелукаст.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав: каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Левоцетиризина дигидрохлорид USP 5 мг;

Монтелукаст натрия ВР экв. монтелукасту 10 мг.

Краситель: диоксид титана ВР

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

Код АТХ: R03DC53.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Левоцетиризин - энантиомер цетиризина, конкурентный антиагонист гистамина, блокирует H₁-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 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 эпителия дыхательных путей, обладая тем самым одновременно способностью ингибировать бронхоспазм, обусловленный вдыханием 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 β₂-адреналиномиметиками.

Фармакокинетика:

Левоцетиризин - после приема внутрь препарат быстро и полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на полноту абсорбции, хотя скорость ее уменьшается. У взрослых после однократного приема препарата в терапевтической дозе (5 мг) максимальная концентрация (С_{max}) 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.

Левоцетиризин на 90 % связывается с белками плазмы крови. Объем распределения (V_d) 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 H₁ гистаминовых рецепторов, которые метаболизируются в печени с помощью системы цитохромов) с образованием фармакологически неактивного метаболита. Из-за низкого уровня метаболизма и отсутствия метаболического потенциала взаимодействие левоцетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным.

У взрослых период полувыведения (T_{1/2}) составляет (7,9 ± 1,9) ч; у маленьких детей T_{1/2} 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 (T_{1/2}) удлиняется (так, у больных, находящихся на гемодиализе, общий клиренс снижается на 80 %), что требует соответствующего изменения режима дозирования. Менее 10 % левоцетиризина 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 (С_{max}) таблеток покрытых оболочкой. У взрослых при приеме натощак таблеток покрытых оболочкой 10 мг С_{max} достигается через 3 часа. Биодоступность при приеме внутрь составляет 64%.

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 ингибирует 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:

аллергический ринит 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 6 лет;
- беременность и период лактации.

Способ применения и дозы:

Внутри 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 Лесон 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 Лесон на показатели, отражающие течение бронхиальной астмы развивается в течение первого дня. Пациенту следует продолжать принимать Лесон 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 специальной 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:

Возможны диспепсия, боли в животе, сыпь, головокружение, головная боль, усталость, лихорадка, кашель, заложенность носа, реакции гиперчувствительности, включая анафилактический шок, печеночная эозинофильная инфильтрация, нарушения сна в том числе ночные кошмары, галлюцинации, бессонница, раздражительность, тревожность, беспокойство, агрессивное поведение, тремор, депрессия, в очень редких случаях суицидальные мысли, головокружение сонливости, парестезия / гипестезия, сердцебиение, понос, сухость во рту, диспепсия, тошнота, рвота, повышение уровня сывороточных трансаминаз (АЛТ, АСТ), холестатический гепатит, крапивница, зуд, сыпь, эритема, боли в суставах, миалгия, включая мышечные судороги, слабость, усталость, недомогание, отеки.

Передозировка:

Левоцетиризин

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:

Левоцетиризин

Теофиллин (400 мг в сутки) снижает общий клиренс левоцетиризина 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.

AUC уменьшается у лиц, одновременно получающих фенобарбитал (примерно на 40%), однако коррекция 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:

Пациентам не рекомендуется использование данного комбинированного препарата, содержащего монтелукаст и левоцетиризин, 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 Лесон 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 приеме препарата Лесон может развиваться сонливость, что следует учитывать при необходимости управления автотранспортными средствами или работе с механизмами. В период приема препарата целесообразно воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстрых психомоторных реакций.

Форма выпуска:

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

Условия хранения:

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

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.

Произведено для: 
SPEY MEDICAL
Лондон, Великобритания
Производитель:
Раван Лайф Сайнс Pvt. Лтд.,
Индия