

ЗАТВЕРДЖЕНО  
Наказ Міністерства охорони  
здоров'я України  
21.09.2020 № 2143  
Ресстраційне посвідчення  
№ 4A/18335/01/01

**ІНСТРУКЦІЯ**  
для медичного застосування лікарського засобу

**АСМОНТ**  
(ASMONT)

**Склад:**

*діюча речовина:* монтелукаст натрію;  
1 таблетка містить монтелукасту натрію 10,4 мг, що відповідає монтелукасту 10 мг;  
*допоміжні речовини:* маніт (E 421), натрію кроскармелоза, аспартам (E 951), ароматизатор бапановий, целюлоза мікрокристалічна, гідроксипропілцелюлоза низькозаміщена, магію стеарат;  
плівкове покриття Opadry yellow 20A33251: гіпромелоза, гідроксипропілцелюлоза, тальк, титану діоксид (E 171), заліза оксид жовтий (E 172), заліза оксид червоний (E 172).

**Лікарська форма.** Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

**Основні фізико-хімічні властивості:** таблетки, вкриті плівковою оболонкою, кремового кольору, круглої форми, з двошуклою поверхню.

**Фармакотерапевтична група.** Засоби для системного застосування при обструктивних захворюваннях дихальних шляхів. Блокатори лейкотрієнових рецепторів. Код АТХ R03D C03.

**Фармакологічні властивості.**

**Фармакодинаміка.**

Цистеїніллейкотрієни (LTC<sub>4</sub>, LTD<sub>4</sub>, LTE<sub>4</sub>) – потужні ейкозаноїди запалення, що виділяються різними клітинами, у тому числі опасистими клітинами та еозинофілами. Ці важливі проастматичні медіатори зв'язуються з цистеїніллейкотрієновими рецепторами (CysLT), наявними в дихальних шляхах людини (включаючи міоцити гладкої мускулатури та макрофаги), та іншими клітинами прозапалення (включаючи еозинофіли та деякі міелоїдні стовбурові клітини). CysLT мають відношення до патофізіології астми та алергічного риніту. При астмі лейкотрієн-опосередковані ефекти включають бронхоспазм, виділення мокротиння, проникність судин і збільшення кількості еозинофілів. При алергічному риніті після експозиції з алергеном CysLT вивільняється з носової слизової оболонки під час обох фаз (ранньої та пізньої) та проявляється симптомами алергічного риніту. При інтраназальній пробі з CysLT було продемонстровано збільшення резистентності повітроносних носових шляхів та симптомів назальної обструкції.

Монтелукаст є активною сполукою, яка з високою вибірковістю і хімічною спорідненістю зв'язується з CysLT<sub>1</sub>-рецепторами. Монтелукаст спричиняє значне блокування цистеїніллейкотрієнових рецепторів дихальних шляхів, що було підтверджено його здатністю інгібувати бронхоконстрикцію в пацієнтів з астмою, спричинену вдиханням LTD<sub>4</sub>. Навіть низька доза 5 мг спричиняє значну блокаду стимульованої LTD<sub>4</sub> бронхоконстрикції. Монтелукаст спричиняє бронходилатацію протягом 2 годин після перорального застосування; цей ефект був адитивним до бронходилатації, спричиненої β-агоністами.

Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного досьє

Лікування монтелукастом пригнічує бронхоспазм як на ранній, так і на пізній стадії, знижуючи реакцію на антигени. Монтелукаст зменшує число еозинофілів периферичної крові у дорослих пацієнтів та дітей, значно зменшує число еозинофілів у дихальних шляхах (аналіз мокротиння) та покращує клінічний контроль астми.

#### *Фармакокінетика.*

##### *Абсорбція*

Після прийому монтелукаст швидко і майже повністю всмоктується. У дорослих при прийомі натще таблеток, вкритих плівковою оболонкою, в дозі 10 мг максимальна концентрація у плазмі крові ( $C_{max}$ ) досягається через 3 години ( $T_{max}$ ). Середня біодоступність становить 64 %. Вживання звичайної їжі не впливає на  $C_{max}$  у плазмі крові і біодоступність таблеток, вкритих плівковою оболонкою.

##### *Розподіл*

Понад 99 % монтелукасту зв'язується з білками плазми крові. Об'єм розподілу монтелукасту в стаціонарній фазі в середньому становить від 8 до 11 літрів. При дослідженні міченого монтелукасту проходження через гематоенцефалічний бар'єр було мінімальним. У всіх інших тканинах концентрації міченого радіоізотопом матеріалу через 24 години після прийому дози також виявилися мінімальними.

##### *Метаболізм*

Монтелукаст активно метаболізується. Під час досліджень із застосуванням терапевтичних доз концентрації метаболітів монтелукасту у стаціонарному стані плазми крові в дорослих і пацієнтів дитячого віку не визначаються.

Під час досліджень *in vitro* з використанням мікросом печінки людини доведено, що цитохроми P450 3A4, 2A6 і 2C9 беруть участь у метаболізмі монтелукасту. Результати подальших досліджень мікросом печінки людини *in vitro* показали, що в терапевтичних концентраціях монтелукаст не пригнічує цитохроми P450 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 і 2D6. Участь метаболітів у терапевтичній дії монтелукасту є мінімальною.

##### *Виведення*

Кліренс монтелукасту із плазми здорових дорослих добровольців у середньому становить 45 мл/хв. Після пероральної дози міченого ізотопом монтелукасту 86 % виводиться з калом протягом 5 днів і менше 0,2 % – із сечею. У сукупності з біодоступністю монтелукасту при пероральному застосуванні цей факт вказує, що його метаболіти майже повністю виводяться з жовчю.

##### *Фармакокінетика у різних груп пацієнтів*

Для пацієнтів літнього віку, а також пацієнтів із печінковою недостатністю легкого і середнього ступеня тяжкості корекція дози не потрібна. Даних про характер фармакокінетики монтелукасту у пацієнтів з тяжкою печінковою недостатністю (понад 9 балів за шкалою Чайлда-П'ю) немає.

Дослідження за участю пацієнтів з нирковою недостатністю не проводилися. Оскільки монтелукаст і його метаболіти виводяться з жовчю, корекція дози для пацієнтів з нирковою недостатністю не вважається необхідною.

При прийомі великих доз монтелукасту (що в 20 та 60 разів перевищували дозу, рекомендовану для дорослих) спостерігалось зниження концентрації теофіліну в плазмі крові. Цей ефект не спостерігався при прийомі рекомендованої дози 10 мг 1 раз на добу.

#### **Клінічні характеристики.**

##### **Показання.**

- Додаткове лікування персистуючої бронхіальної астми легкого та середнього ступеня тяжкості, що недостатньо контролюється інгаляційними кортикостероїдами, а також при недостатньому клінічному контролі астми короткодіючими  $\beta$ -агоністами, що застосовуються за необхідності.
- Симптоматичне лікування сезонного алергічного риніту у хворих на бронхіальну астму.
- Профілактика бронхіальної астми, домінуючим компонентом якої є бронхоспазм, індукований фізичним навантаженням.
- Поліпшення симптомів сезонного та цілорічного алергічного риніту.

Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного доосьє

### **Протипоказання.**

- Гіперчутливість до монтелукасту або до інших компонентів препарату.
- Дитячий вік до 15 років (для дози 10 мг).

### **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.**

Монтелукаст можна призначати разом з іншими препаратами для профілактики або тривалого лікування бронхіальної астми. Рекомендована клінічна доза монтелукасту не має значного клінічного впливу на фармакокінетику таких препаратів: *теофілін, преднізон, преднізолон, пероральні контрацептиви (етинілестрадіол/норетиндрон 35/1), терфенадин, дигоксин та варфарин*.

У пацієнтів, які одночасно приймали *фенобарбітал*, площа під кривою «концентрація-час» (AUC) для монтелукасту знижувалася приблизно на 40 %. Оскільки монтелукаст метаболізується CYP 3A4, 2C8 і 2C9, необхідно бути обережним, особливо щодо дітей, якщо монтелукаст призначають одночасно з *індукторами CYP 3A4, 2C8 і 2C9*, наприклад, з *фенітоїном, фенобарбіталом і рифампіцином*.

Дослідження *in vitro* показали, що монтелукаст є потужним інгібітором CYP 2C8. Дослідження взаємодії лікарських засобів, що включають монтелукаст і *розіглітазон* (маркерний субстрат; препарат, що метаболізується за допомогою CYP 2C8), показали, що монтелукаст не є інгібітором CYP 2C8 *in vivo*. Таким чином, монтелукаст не впливає значною мірою на метаболізм препаратів, що метаболізуються за допомогою CYP 2C8 (наприклад, *наклітакселу, розиглітазону та репаглініду*).

Під час досліджень *in vitro* було встановлено, що монтелукаст є субстратом CYP 2C8 і меншою мірою 2C9 та 3A4. У процесі клінічного дослідження взаємодії монтелукасту і *гемфіброзилу* (інгібітор CYP 2C8 і 2C9) *гемфіброзил* підвищував системну експозицію монтелукасту в 4,4 рази. При одночасному застосуванні з *гемфіброзилом* або іншими *потужними інгібіторами CYP 2C8* корекція дози монтелукасту не потрібна, але лікар повинен враховувати підвищений ризик виникнення побічних реакцій.

За результатами досліджень *in vitro*, не очікується клінічно важливих взаємодій з *менш потужними інгібіторами CYP 2C8* (наприклад, з *триметопримом*).

Одночасне застосування монтелукасту з *ітраконазолом* (потужний інгібітор CYP 3A4), не призводило до істотного підвищення системної експозиції монтелукасту.

### **Особливості застосування.**

Пацієнтів необхідно попередити, що Асмопт не слід застосовувати для зняття гострих астматичних нападів, а також про те, що вони повинні завжди мати при собі відповідний препарат невідкладної допомоги. У випадку гострого нападу слід застосовувати інгаляційні β-агоністи короткої дії. Пацієнтам необхідно якнайшвидше проконсультуватися з лікарем у разі, якщо вони потребують більшої, ніж зазвичай, кількості інгаляцій β-агоністів короткої дії.

Не слід різко замінювати монтелукастом інгаляційні або пероральні кортикостероїди.

Відсутні дані, які доводили б, що дозу пероральних кортикостероїдних препаратів можна зменшувати при одночасному прийомі монтелукасту.

Повідомлялося про виникнення психоневрологічних реакцій у дорослих пацієнтів, підлітків та дітей, які приймають монтелукаст (див. розділ «Побічні реакції»). Пацієнти та лікарі повинні враховувати можливість виникнення психоневрологічних реакцій. Лікарі повинні обговорити можливість таких реакцій зі своїми пацієнтами та/або їх опікунами. Пацієнтам та/або опікунам слід вказати, щоб вони повідомляли свого лікаря про виникнення психоневрологічних змін. Лікарі повинні ретельно оцінити ризики та переваги продовження лікування монтелукастом, якщо такі події виникли.

У поодиноких випадках у пацієнтів, які отримують протиастматичні засоби, в тому числі монтелукаст, може спостерігатися системна еозинофілія, інколи з клінічними проявами васкуліту, так званий синдром Чарга-Страуса (гранулематозний алергічний ангіїт), лікування якого проводиться системними кортикостероїдними препаратами. Такі випадки зазвичай, але не завжди, були пов'язані зі зменшенням дози або відміною пероральних кортикостероїдних препаратів. Зв'язок антагоністів лейкотрієнових рецепторів з розвитком синдрому Чарга-Страуса

узгоджено з матеріалами  
реєстраційного доось

неможливо ані спростувати, ані підтвердити, тому лікарі повинні пам'ятати про можливість виникнення у пацієнтів созинофії, васкулітних висипань, погіршення легеневої симптоматики, серцево-судинних ускладнень та/або нейропатії. Пацієнтам, у яких розвинулися вищезгадані симптоми, необхідно пройти повторне обстеження, а схему їхнього лікування слід переглянути. Лікування монтелукастом не скасовує необхідності пацієнтам з аспіринзалежною бронхіальною астмою уникати застосування ацетилсаліцилової кислоти або інших нестероїдних протизапальних препаратів.

Препарат Асмонт містить аспартам, який є похідним фенілаланіну, що являє небезпеку для хворих на фенілкетонурію. Пацієнтам, хворим на фенілкетонурію, необхідно враховувати, що одна таблетка препарату Асмонт 10 мг містить 1,5 мг аспартаму.

Цей лікарський засіб містить допоміжну речовину маніт, який може чипити м'яку проносну дію.

#### *Застосування у період вагітності або годування груддю.*

Дослідження на тваринах не продемонстрували шкідливого впливу на вагітність або ембріональний/фетальний розвиток.

Обмежена інформація про застосування монтелукасту в період вагітності не вказує на причинно-наслідковий зв'язок між його застосуванням і виникненням мальформацій (таких як вроджені дефекти кінцівок), про які рідко повідомлялося за даними всесвітнього постмаркетингового досвіду застосування. Асмонт можна застосовувати в період вагітності, тільки якщо це вважається безумовно необхідним.

Дослідження на тваринах продемонстрували, що монтелукаст проникає в грудне молоко. Невідомо, чи проникає монтелукаст у грудне молоко жінок. Асмонт можна застосовувати в період годування груддю, тільки якщо це вважається безумовно необхідним.

#### *Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.*

Не очікується, що монтелукаст впливатиме на здатність пацієнта керувати автотранспортом або іншими механізмами. Проте в саодиноких випадках може виникати запаморочення або сонливість, тому під час прийому препарату слід утриматися від керування автомобілем або іншими механізмами.

#### *Спосіб застосування та дози.*

Препарат застосовувати перорально, незалежно від прийому їжі.

*Дорослим та дітям віком від 15 років* для лікування астми або астми із суттєвим сезонним алергічним ринітом слід приймати по 1 таблетці (10 мг) 1 раз на добу, ввечері.

Для полегшення симптомів алергічного риніту час прийому підбирають індивідуально.

#### *Загальні рекомендації.*

Терапевтичний ефект препарату щодо контролю бронхіальної астми настає впродовж 1 дня. Пацієнтам слід рекомендувати продовжувати прийом препарату навіть при досягненні контролю бронхіальної астми, а також у періоди загострення астми. Не слід приймати препарат разом із лікарськими засобами, що також містять монтелукаст.

Немає необхідності в корекції дози пацієнтам літнього віку, пацієнтам з порушеннями функції нирок або з порушеннями функції печінки легкого та помірного ступеня. Немає даних щодо застосування препарату пацієнтам із печінковою недостатністю тяжкого ступеня.

Дозування препарату є однаковим для пацієнтів чоловічої та жіночої статі.

*Лікування монтелукастом залежно від інших способів лікування бронхіальної астми.*

Асмонт можна призначати додатково до вже існуючого курсу лікування пацієнта.

#### *Інгаляційні кортикостероїди.*

Асмонт можна застосовувати як додаткову терапію у разі, якщо інгаляційні кортикостероїди у комбінації з короткодійними  $\beta$ -агоністами як засобами першої допомоги не забезпечують адекватного клінічного контролю захворювання.

Не можна різко замінювати інгаляційні кортикостероїди препаратом Асмонт.

Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного дос'є

### *Діти.*

Застосовувати дітям віком від 15 років. Дітям віком до 15 років слід застосовувати препарат у вигляді жувальних таблеток.

### *Передозування.*

Під час довготривалих досліджень хронічної бронхіальної астми монтелукаст призначали в дозах до 200 мг/добу дорослим пацієнтам, а у короткочасних дослідженнях – до 900 мг/добу впродовж приблизно одного тижня, при цьому клінічно значущі побічні реакції не виникали.

*Симптоми.* Повідомлялося про гостре передозування монтелукасту. Ці випадки стосувалися дорослих та дітей, які приймали дозу понад 1000 мг (приблизно 61 мг/кг у дитини віком 42 місяці). Отримані клінічні та лабораторні показники були в межах профілю безпеки у дорослих пацієнтів і дітей. У більшості випадків передозування про побічні реакції не повідомлялося. Найчастіше спостерігалися побічні реакції, що відповідали профілю безпеки монтелукасту та включали біль у животі, сонливість, спрагу, головний біль, блювання та психомоторну гіперактивність.

*Лікування.* Спеціальної інформації щодо лікування передозувань монтелукасту немає. Лікування симптоматичне. Антидот відсутній. Невідомо, чи виводиться монтелукаст за допомогою перитонеального діалізу або гемодіалізу.

### *Побічні реакції.*

Під час клінічних досліджень про нижчезазначені побічні реакції повідомлялося часто (від  $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ) у пацієнтів, які отримували лікування монтелукастом, а також з більшою частотою, ніж у пацієнтів, які отримували плацебо:

*Нервова система:* головний біль.

*Шлунково-кишковий тракт:* абдомінальний біль.

*Загальні розлади:* спрага.

Під час клінічних досліджень при пролонгованому лікуванні різних вікових груп пацієнтів профіль безпеки не змінювався.

Побічні реакції, зареєстровані у постмаркетинговий період:

*Інфекції та інвазії:* дуже часто – інфекції верхніх дихальних шляхів\*.

*Система крові та лімфатична система:* рідко – тенденція до посилення кровоточивості; дуже рідко – тромбоцитопенія.

*Імуна система:* нечасто – реакції гіперчутливості, у тому числі анафілаксія; дуже рідко – еозинофільна інфільтрація печінки.

*Психічні порушення:* печасто – порушення сну, в тому числі нічні кошмари, безсоння, сомнамбулізм, тривожність, ажитація, включаючи агресивну поведінку або ворожість, депресія, психомоторна гіперактивність (включаючи драгівливість, неспокій, тремор<sup>§</sup>); рідко – порушення уваги, погіршення пам'яті, тик; дуже рідко – галюцинації, дезорієнтація, суїцидальні думки та поведінка (суїцидальність), дисфемія, obsесивно-компульсивні розлади.

*Нервова система:* нечасто – запаморочення, млявість, парестезія/гіпестезія, судоми.

*Серцево-судинна система:* рідко – пальпітація.

*Дихальна система, органи грудної клітки та середостіння:* печасто – носова кровотеча; дуже рідко – синдром Чарга-Страуса (див. розділ «Особливості застосування»), легенева еозинофілія.

*Шлунково-кишковий тракт:* часто – діарея\*\*, нудота\*\*, блювання\*\*;  
нечасто – сухість у роті, диспепсія.

*Гепатобіліарна система:* часто – підвищення рівня сироваткових трансаміназ (АЛТ, АСТ); дуже рідко – гепатит (включаючи холестатичне, гепатоцелюлярне та змішане ураження печінки).

*Шкіра та підшкірні тканини:* часто – висип\*\*;  
нечасто – гематома, кропив'янка, свербіж; рідко – ангіошверотичний набряк; дуже рідко – вузлувата еритема, мультиформна еритема.

*Кістково-м'язова система та сполучна тканина:* нечасто – артралгія, міалгія, включаючи м'язові судоми.

*Сечовидільна система:* нечасто – снурыз у дітей.

Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного доось

**Загальні розлади:** часто – пірекісія\*\*;  
(нездужання), набряк.

Категорії частоти: дуже часто ( $\geq 1/10$ ), часто (від  $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ), нечасто (від  $\geq 1/1000$  до  $< 1/100$ ), рідко (від  $\geq 1/10\ 000$  до  $< 1/1000$ ), дуже рідко ( $< 1/10\ 000$ ).

\* Побічна реакція спостерігалася з частотою «дуже часто» у пацієнтів, які застосовували монтелукаст, а також у пацієнтів, які отримували плацебо, під час клінічних досліджень.

\*\* Побічна реакція спостерігалася з частотою «часто» у пацієнтів, які застосовували монтелукаст, а також у пацієнтів, які отримували плацебо, під час клінічних досліджень.

§ Категорія частоти: рідко.

**Термін придатності.**

3 роки.

Не застосовувати після закінчення терміну придатності, вказаного на упаковці.

**Умови зберігання.**

В оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

**Упаковка.**

По 7 таблеток у блистері, по 4 блистери в пачці.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

**Виробник.**

Товариство з обмеженою відповідальністю «Агрофарм».

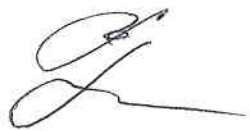
Товариство з обмеженою відповідальністю «Натур+».

**Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.**

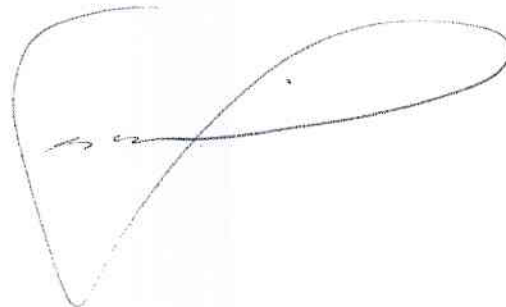
Україна, 08200, Київська область, м. Ірпінь, вул. Центральна, 113-А.

Україна, 08200, Київська область, м. Ірпінь, вул. Шевченка Тараса, 3.

**Дата останнього перегляду.**



Ленів узгоджено:



Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного досьє