

achē

Montelair montelucaste de sódio

Granulado

USO ORAL
USO PEDIÁTRICO ACIMA DE 6 MESES DE IDADE

FORMA FARMACÊUTICA E APRESENTAÇÕES
Granulado 4 mg: embalagens com 10 e 30 sachês de 350 mg.

COMPOSIÇÃO

Cada sachê de MONTELAIR contém:
montelucaste de sódio
(equivalente a 4,0 mg de montelucaste)4,2 mg
Excipientes: hiprolose, estearato de magnésio e manitol.

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

Ação esperada do medicamento

MONTELAIR é um medicamento para o tratamento da asma que age como antagonista do receptor de leucotrienos. Os leucotrienos são substâncias produzidas por células sanguíneas que causam estreitamento, inchaço das vias aéreas e também causam os sintomas alérgicos. Com o bloqueio da ação dos leucotrienos, os sintomas alérgicos e da asma melhoram e as crises de asma são prevenidas.

Cuidados de armazenamento

Conservar em temperatura ambiente (entre 15 e 30°C). Proteger da luz e umidade.

O medicamento deve ser armazenado na embalagem original até sua total utilização.

Prazo de validade

Desde que respeitados os cuidados de armazenamento, o medicamento apresenta uma validade de 24 meses a contar da data de sua fabricação. Não devem ser utilizados medicamentos fora do prazo de validade, pois podem trazer prejuízos à saúde.

Gravidez e lactação

Informe seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término.

Informar ao médico se está amamentando.

Cuidados de administração

É importante que você ou sua criança continuem tomando MONTELAIR diariamente, conforme prescrito pelo médico, mesmo quando você ou sua criança não apresentarem sintomas ou mesmo durante uma crise de asma.

Se os sintomas da asma piorarem, você deve contatar seu médico imediatamente.

Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

Interrupção do tratamento

Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

Reações adversas

Informe seu médico o aparecimento de reações desagradáveis. As mais comuns relatadas nos estudos foram dor abdominal, dor de cabeça, sede, diarreia, hiperatividade, asma, pele escamosa ou prurido e erupção cutânea. Estas reações geralmente são leves e ocorreram tanto em pacientes tratados com MONTELAIR quanto em pacientes tratados com placebo (comprimido que não contém medicação).

Informe seu médico o aparecimento de reações desagradáveis. **TUDO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.**

Ingestão concomitante com outras substâncias

De maneira geral, MONTELAIR não interfere com outros medicamentos que você ou sua criança estejam tomando. Entretanto, é importante que você informe seu médico sobre todos os medicamentos que você ou sua criança estejam tomando ou que pretendam tomar, incluindo aqueles sem prescrição médica.

Contraindicações e precauções

MONTELAIR contraíndicado para casos de hipersensibilidade a qualquer componente do produto.

NÃO TOME REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO; PODE SER PERIGOSO PARA SUA SAÚDE.

MONTELAIR não é indicado para o tratamento das crises agudas de asma. Se ocorrer uma crise, você ou sua criança devem seguir as instruções dadas pelo seu médico para esta situação.

Informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início, ou durante o tratamento.

NÃO TOME REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO, PODE SER PERIGOSO PARA A SAÚDE.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS

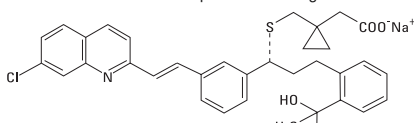
CARACTERÍSTICAS

DESCRIÇÃO

O montelucaste de sódio, princípio ativo de MONTELAIR, é um antagonista do receptor de leucotrienos seletivo e ativo por via oral que inibe o receptor de leucotrienos cisteínicos CysLT₁.

A fórmula química do montelucaste de sódio é: sal monossódico do ácido [R-(E)]-1-[[[1-[3-[2-(7- cloro-2-quinolinil) etenil] fenil]-3-[2-(1-hidróxi-1-metil) fenil] propil]tio]metil]ciclopropanoacético.

A fórmula empírica é C₂₅H₃₅ClN₂NaO₃S, e seu peso molecular é de 608,18. Sua fórmula estrutural é apresentada a seguir:



O montelucaste de sódio é um pó branco a quase branco, higroscópico, opticamente ativo, livremente solúvel em etanol, metanol e água e praticamente insolúvel em acetona.

Propriedades farmacológicas

Mecanismo de Ação

Os leucotrienos cisteínicos (LTC₄, LTD₄, LTE₄) são potentes eicosanóides inflamatórios, produtos do metabolismo do ácido araquidônico e liberados de várias células, incluindo mastócitos e eosinófilos. Esses importantes mediadores pró-asmáticos ligam-se aos receptores de leucotrienos cisteínicos (CysLT). O receptor CysLT tipo 1 (CysLT₁) encontra-se nas vias aéreas de humanos (incluindo as células musculares lisas e macrófagos da via aérea) e em outras células pró-inflamatórias (incluindo eosinófilos e determinadas células-tronco mielóides). Os CysLT foram correlacionados com a fisiopatologia da asma e da rinite alérgica. Na asma, os efeitos mediados pelos leucotrienos, inclusive um número de ações nas vias aéreas, incluem broncoconstrição, secreção de muco, aumento da permeabilidade vascular e recrutamento de eosinófilos. Na

rinite alérgica, os CysLT são associados aos sintomas e liberados da mucosa nasal depois da exposição ao alérgeno durante as fases de reação precoce e tardia. A provocação intranasal com os CysLTs tem mostrado aumentar a resistência da via nasal e os sintomas da obstrução nasal.

O montelucaste é um potente composto ativo por via oral que melhora significativamente os parâmetros da inflamação asmática. Com base nos bioensaios bioquímicos e farmacológicos, ele se liga com alta afinidade e seletividade ao receptor CysLT₁ (preferindo-o a outros receptores farmacologicamente importantes das vias aéreas, tais como os receptores prostanoídes, colinérgicos ou β-adrenérgicos). O montelucaste inibe as ações fisiológicas do LTC₄, LTD₄ e LTE₄ no receptor CysLT₁ sem atividade agonista.

Propriedades farmacocinéticas

Absorção

O montelucaste de sódio é rápido e quase completamente absorvido após a administração oral. A C_{max} dos sachês de 4 mg é atingida cerca 2 horas após a administração a pacientes pediátricos de dois a cinco anos de idade em jejum. A co-administração de papinha de maçã ou de uma refeição-padrão com os grânulos orais não teve efeito significativo na farmacocinética de montelucaste de sódio. Estudos clínicos também demonstraram o perfil de segurança de montelucaste quando os grânulos orais de 4 mg foram administrados, independentemente do horário de ingestão de alimentos.

Metabolismo

O montelucaste de sódio é amplamente metabolizado. Em estudos nos quais se utilizou doses terapêuticas, as concentrações plasmáticas dos metabólitos do montelucaste de sódio, em estado de equilíbrio, são indetectáveis em adultos e em pacientes pediátricos.

Estudos *in vitro* em microsomos de fígado humano indicam que as isoenzimas do citocromo P450 3A4 e 2C9 estão envolvidas no metabolismo do montelucaste de sódio. Resultados de estudos posteriores *in vitro* em microsomos de fígado humano demonstraram que as concentrações plasmáticas terapêuticas do montelucaste de sódio não inibem as isoenzimas 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 ou 2D6 do citocromo P450.

Distribuição

A ligação do montelucaste de sódio às proteínas plasmáticas é superior a 99%. O volume de distribuição em estado de equilíbrio do montelucaste de sódio é de aproximadamente 8 a 11 litros. Estudos em ratos, que utilizaram montelucaste de sódio marcado radioativamente, demonstraram mínima distribuição pela barreira hematoencefálica. Além disso, as concentrações do material radiomarcado, 24 horas após a dose, foram mínimas em todos os outros tecidos.

Excreção

A depuração plasmática do montelucaste de sódio é de aproximadamente 45 mL/min em adultos saudáveis. Após uma dose oral de montelucaste de sódio marcado radioativamente, 86% da radioatividade foi recuperada em coletas fecais durante 5 dias e < 0,2% foi recuperada na urina. Considerando-se as estimativas da biodisponibilidade oral do montelucaste de sódio, isso indica que o montelucaste de sódio e seus metabólitos são excretados quase que exclusivamente pela bile.

Em diversos estudos, a meia-vida plasmática média do montelucaste de sódio foi de 2,7 a 5,5 horas em jovens saudáveis. A farmacocinética do montelucaste de sódio é quase linear para doses de até 50 mg administradas por via oral. Nenhuma diferença na farmacocinética foi notada entre as doses administradas pela manhã ou à noite. Com a administração de 10 mg de montelucaste uma vez ao dia, houve pequeno acúmulo do medicamento inalterado no plasma (aproximadamente 14%).

Características Relacionadas aos Pacientes

Sexo

A farmacocinética do montelucaste de sódio é similar nos sexos masculino e feminino.

Idosos

O perfil farmacocinético e a biodisponibilidade oral de uma dose única de 10 mg de montelucaste de sódio são similares em jovens e idosos. A meia-vida plasmática do montelucaste de sódio é ligeiramente mais prolongada em idosos. Não é necessário ajuste posológico para idosos.

Raça

Diferenças farmacocinéticas relacionadas à raça não foram estudadas. Em estudos clínicos, não pareceu haver quaisquer diferenças em efeitos clinicamente importantes.

Insuficiência Hepática

Pacientes com insuficiência hepática leve a moderada e evidência clínica de cirrose apresentaram evidência de redução do metabolismo de montelucaste de sódio, que resultou em um aumento de aproximadamente 41% da área média sob a curva de concentração plasmática (AUC) do montelucaste de sódio após uma dose única de 10 mg. A eliminação do montelucaste de sódio é ligeiramente prolongada quando comparada àquela observada em indivíduos saudáveis (meia-vida média de 7,4 horas). Não é necessário ajuste posológico para pacientes com insuficiência hepática leve a moderada. Não há dados clínicos em pacientes com insuficiência hepática grave (Escore de Child- Pugh > 9).

Insuficiência Renal

Uma vez que o montelucaste de sódio e seus metabólitos não são excretados na urina, a farmacocinética do montelucaste de sódio não foi avaliada em pacientes com insuficiência renal. Não é recomendado ajuste posológico para esses pacientes.

Pacientes Pediátricos

Estudos farmacocinéticos mostram que o perfil plasmático dos grânulos orais de 4 mg em pacientes pediátricos de 6 meses a 2 anos de idade foi similar ao perfil plasmático dos comprimidos revestidos de 10 mg em adultos.

Os grânulos orais de 4 mg devem ser usados em pacientes pediátricos de 6 meses a 2 anos de idade.

INDICAÇÕES

MONTELAIR é indicado para a profilaxia e o tratamento crônico da asma em pacientes pediátricos de 6 meses a 5 anos de idade, incluindo a prevenção de sintomas diurnos e noturnos, da broncoconstrição induzida pelo exercício e o tratamento de pacientes com asma sensíveis à aspirina.

MONTELAIR é efetivo isoladamente ou em associação a outros medicamentos utilizados no tratamento da asma crônica. MONTELAIR pode ser utilizado concomitantemente a corticosteróides inalatórios com efeitos aditivos no controle da asma e para reduzir a dose do corticosteróide inalatório e manter a estabilidade clínica.

MONTELAIR é indicado para o alívio dos sintomas diurnos e noturnos da rinite alérgica em pacientes pediátricos de 2 anos a 5 anos de idade, incluindo congestão nasal, rinorreia, prurido nasal, espirros; congestão nasal ao despertar, dificuldade de dormir e despertares noturnos; lacrimejamento, hiperemia ocular.

CONTRAINDICAÇÕES

Hipersensibilidade a qualquer componente do produto.

PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS

A eficácia oral de montelucaste de sódio para o tratamento das crises agudas de asma não foi estabelecida. Desta forma, MONTELAIR não deve ser usado para o tratamento das crises agudas de asma. Os pacientes devem ser aconselhados a ter disponível medicamento de resgate adequado.

Apesar das doses do corticosteróide inalatório usado concomitantemente poderem ser gradualmente reduzidas sob supervisão médica, MONTELAIR não deve substituir abruptamente os corticosteróides inalatórios ou orais.

A redução da dose do corticosteróide sistêmico em pacientes que recebem medicamentos para o tratamento da asma, inclusive antagonistas do receptor de leucotrienos, em casos raros, tem sido seguida pela ocorrência de um ou mais dos seguintes sintomas: eosinofilia, exantema vasculítico, piora dos sintomas pulmonares,

300 mm

150 mm

