

*Comprimidos recubiertos:* **MONTELUKAST** (como sal sódica), 10 mg

*Comprimidos masticables:* **MONTELUKAST** (como sal sódica),

4 y 5 mg

*Granulado:* **MONTELUKAST** (como sal sódica), 4 mg

PROSPECTO

Comprimidos recubiertos

Comprimidos masticables

Granulado

**Venta Bajo Receta**

Industria Argentina

## FÓRMULAS

### Comprimidos recubiertos:

Cada comprimido recubierto contiene: Montelukast (como sal sódica) 10,000 mg. Excipientes: celulosa microcristalina 93,180 mg, lactosa 38,000 mg, croscarmelosa sódica 24,700 mg, crospovidona 19,000 mg, hidroxipropilcelulosa 1,900 mg, estearato de magnesio 2,850 mg, dióxido de titanio 1,720 mg, talco 1,540 mg, hidroxipropilmetilcelulosa E15 1,680 mg, polietilenglicol 6000 0,750 mg, óxido de hierro amarillo 0,042 mg, óxido de hierro rojo 0,013 mg, povidona K30 0,260 mg.

### Comprimidos masticables x 4 mg:

Cada comprimido masticable contiene: Montelukast (como sal sódica) 4,00 mg; Excipientes: manitol 154,9 mg, celulosa microcristalina 22,000 mg, hidroxipropilcelulosa 22,000 mg, óxido de hierro rojo 0,013 mg, sabor frutilla 2,2 mg, croscarmelosa sódica 8,8 mg, aspartamo 2,2 g, estearato de magnesio 3,74 mg.

### Comprimidos masticables x 5 mg:

Cada comprimido masticable contiene: Montelukast (como sal sódica) 5,00 mg; Excipientes: manitol 153,74 mg, celulosa microcristalina 22,00 mg, hidroxipropilcelulosa 22,000 mg, óxido de hierro rojo 0,132 mg, sabor frutilla 2,2 mg, croscarmelosa sódica 8,8 mg, aspartamo 2,2 mg, estearato de magnesio 3,74 mg.

### Granulado:

Cada sobre contiene:

Montelukast (como sal sódica) 4,00 mg; Excipientes: povidona 24,65 mg; manitol 468,70 mg; estearato de magnesio 2,50 mg.

## ACCIÓN TERAPÉUTICA

El montelukast es un antagonista selectivo de los receptores de leucotrienos que actúa específicamente sobre los receptores del cisteinil leucotrieno y es activo por vía oral.

## INDICACIONES

Profilaxis y tratamiento crónico del asma en niños mayores de 12 meses y en adultos. Tratamiento de pacientes asmáticos sensibles al ácido acetil salicílico y prevención del espasmo bronquial inducido por ejercicio. Se indica asimismo para el alivio de los síntomas de la rinitis alérgica estacional en adultos y niños mayores de 2 años.

## ACCIÓN FARMACOLÓGICA

Los cisteinil leucotrienos son eicosanoides derivados del ácido araquidónico y son producidos por diversas células, incluyendo mastocitos y eosinófilos. Receptores para estos leucotrienos han sido hallados en las vías aéreas (músculo liso bronquial y macrófagos pulmonares), eosinófilos y stem-cells.

La actividad de los cisteinil leucotrienos ha sido ligada a la fisiopatología de la rinitis alérgica y al asma, provocando en esta enfermedad espasmo y edema bronquial.

El montelukast es un compuesto oralmente activo que se liga con gran afinidad y selectividad a los receptores de cisteinil leucotrienos pulmonares, inhibiendo sus acciones.

### **FARMACOCINÉTICA**

El montelukast se absorbe rápidamente tras su administración oral, alcanzándose concentraciones plasmáticas máximas a las 3-4 hs, con una biodisponibilidad del 64%, que no se modifica con la ingesta concomitante de alimentos. La vida media plasmática es de 2,7-5,5 hs. Se liga a proteínas plasmáticas en más del 99%, con mínimo pasaje a través de la barrera hematoencefálica. El montelukast es metabolizado en hígado por el sistema del citocromo P450, eliminándose casi exclusivamente por vía biliar con las heces.

### **POSOLOGÍA Y MODO DE ADMINISTRACIÓN**

- *Niños de 12 meses a 2 años de edad con asma:* Un sobre granulado de 4 mg una vez al día.
- *Niños de 2 a 5 años de edad con asma y/o rinitis alérgica estacional:* Un comprimido masticable de 4 mg al día, antes de acostarse.
- *Niños de 6 a 14 años de edad con asma y/o rinitis alérgica estacional:* Un comprimido masticable de 5 mg al día, antes de acostarse.
- *Mayores de 15 años y adultos con asma y/o rinitis alérgica estacional:* Un comprimido de 10 mg al día, antes de acostarse.

Los efectos de montelukast sobre el asma se observan en el transcurso de las primeras 24 hs. Se puede tomar con o sin alimentos, no siendo necesario ningún ajuste de dosis en niños, ancianos, pacientes con insuficiencia renal o con fallo hepático leve a moderado, ni según el sexo del paciente. El montelukast puede asociarse a otros tratamientos antiasmáticos, pudiendo reducirse la dosis de los mismos (broncodilatadores o corticoides inhalatorios) si se observa mejoría del cuadro general.

El sobre granulado puede ser administrado directamente en la boca del niño o mezclado con una cucharada llena de alguna comida suave y fría (por ej.: puré de manzanas).

El sobre no debe abrirse hasta ser utilizado, y, ya abierto, debe ser administrado dentro de los 15 minutos. El granulado no debe ser disuelto en líquido para su administración.

### **CONTRAINDICACIONES**

Hipersensibilidad a cualquiera de los componentes del producto.

### **ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES**

No se ha establecido la eficacia del montelukast en el tratamiento de los ataques agudos de asma.

Los corticoides inhalatorios no deben suspenderse bruscamente cuando se asocian con montelukast.

La reducción de la dosis de corticoides sistémicos en pacientes que reciben montelukast puede desencadenar la aparición de eosinofilia, vasculitis cutánea, empeoramiento del cuadro pulmonar, complicaciones cardíacas, enfermedad de Churg-Strauss, y vasculitis eosinofílica. Si bien no se ha definido una relación causa-efecto entre la administración de montelukast y la aparición de estos cuadros, se deberá monitorear cuidadosamente la reducción de la corticoterapia sistémica.

Existe riesgo de presentar trastornos neuropsiquiátricos (agitación, conducta agresiva, ansiedad, depresión, desorientación, sueños anormales, alucinaciones, insomnio, trastornos de memoria, sonambulismo, ideación suicida). Si estos trastornos aparecen se debe discontinuar inmediatamente la medicación.

Los comprimidos masticables contienen aspartamo, por lo que no deben ser consumidos por pacientes que no pueden metabolizar la fenilalanina.

### Embarazo

No ha sido estudiado durante el embarazo por lo cual deberá usarse solo si es de extrema necesidad.

### Lactancia

Se desconoce si el montelukast se excreta con la leche materna por lo cual deberá usarse con precaución en mujeres lactantes.

### Uso pediátrico

Se sugiere no utilizar en niños menores de 12 meses de edad.

### Pacientes de edad avanzada

No existen diferencias en cuanto a eficacia y seguridad del montelukast en relación con la edad avanzada de los pacientes.

### Interacciones medicamentosas

El montelukast no tuvo efectos clínicamente significativos sobre la farmacocinética de: teofilina, prednisona, prednisolona, anticonceptivos orales, terfenadina, warfarina y digoxina. La coadministración de fenobarbital reduce un 40% el área bajo la curva de montelukast, pero no se recomiendan ajustes de dosis en estos casos. El montelukast puede ser utilizado conjuntamente con otros tratamientos crónicos del asma y la rinitis alérgica.

## **REACCIONES ADVERSAS**

En los distintos estudios clínicos realizados la incidencia global de efectos adversos fue similar a la observada con placebo.

*Mayores de 15 años y adultos:* en dos estudios clínicos controlados con placebo efectuados en 2.600 pacientes sólo se observaron como reacciones adversas, en 1% o más de los pacientes tratados y con diferencias respecto del placebo, dolor abdominal y cefalea.

*Niños de 6 a 14 años de edad:* en unos 320 pacientes evaluados sólo se registró la cefalea como efecto adverso con incidencia mayor que en el grupo placebo y en más del 1% de los pacientes tratados.

*Niños de 2 a 5 años de edad:* en unos 573 pacientes evaluados sólo se registró sed como efecto adverso con incidencia mayor que en el grupo placebo y en más del 1% de los pacientes tratados.

*Niños de 12 a 23 meses de edad:* en un estudio efectuado a 124 pacientes pediátricos el medicamento fue bien tolerado, observándose con una frecuencia  $\geq 2\%$  catarro de vías aéreas superiores, sibilancias, otitis media, faringoamigdalitis, tos y rinitis.

*Experiencia post-comercialización:* a partir de su lanzamiento al mercado, se observaron las siguientes reacciones adversas con montelukast: hipersensibilidad (prurito, erupciones cutáneas, urticaria, angioedema, anafilaxis), mareos, náuseas, vómitos, diarrea, dispepsias, irritabilidad, trastornos del sueño, parestesias, raramente convulsiones, alucinaciones, pancreatitis, hepatitis colestásica, artralgias, mialgias y calambres, diátesis hemorrágica y síndrome de Churg-Strauss (que debe ser tratado con corticoides sistémicos) que, en ocasiones, puede presentarse ante la reducción de la corticoterapia oral. En estos casos, los médicos deben estar alertas ante la aparición de eosinofilia, vasculitis, empeoramiento de los síntomas pulmonares, complicaciones cardíacas y/o neuropatías.

Existe riesgo de presentar trastornos neuropsiquiátricos (agitación, conducta agresiva, ansiedad, depresión, desorientación, sueños anormales, alucinaciones, insomnio, trastornos de memoria, sonambulismo, ideación suicida). Si estos trastornos aparecen se debe discontinuar inmediatamente la medicación.

### **SOBREDOSIFICACIÓN**

No existe información específica sobre el tratamiento de la sobredosis por montelukast. Pacientes asmáticos adultos con dosis de hasta 200 mg/día por 22 semanas, o 900 mg/día por una semana, no presentaron efectos adversos significativos.

Se han informado casos de sobredosis aguda en niños en la experiencia post-comercialización, observándose un perfil de seguridad para la droga comparable al de pacientes adultos.

Se ignora si el montelukast es dializable.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666/2247 / 0800-444-8694.

Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777 / 0800-333-0160.

Centro de Asistencia Toxicológica La Plata: (0221) 451-5555.

**Esta especialidad medicinal está libre de gluten.**



### **PRESENTACIÓN**

Comprimidos recubiertos: Envases con 30 y 60 comprimidos recubiertos.

Comprimidos masticables: Envases con 30 comprimidos masticables.

Granulado: Envases con 30 sobres.

Fecha de última revisión: Abril de 2021.

### **FORMA DE CONSERVACIÓN**

- Conservar en su envase original, en lugar fresco y seco a temperatura ambiente, desde 15°C hasta 30°C. Proteger de la luz y la humedad.
- Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Alejandro D. Santarelli – Farmacéutico.

ESPECIALIDAD MEDICINAL AUTORIZADA POR EL MINISTERIO DE SALUD DE LA NACION.

Certificado N° 52.415

Laboratorios CASASCO S.A.I.C.

Av. Boyacá 237 - Ciudad Autónoma de Buenos Aires, Argentina.

 **CASASCO**