

مونته لوکاست (Montelukast)

دسته دارویی: داروی ضد آسم و ضد آلرژی - آنتاگونیست رسپتورهای لکوترین

شکل دارویی: قرص ۱۰ میلی گرمی

نحوه عملکرد

لکوترین ها مواد شیمیایی هستند که از طریق مسیر ۵- لپپوکسیژناز و متابولیسم اسید آراشیدونیک موجود در سلول های التهابی مانند بازوفیل ها، ماست سل ها، ائوزینوفیل ها تولید می شوند. مهم ترین لکوترین های تولید شده LTC_4 ، LTD_4 و LTE_4 می باشند که غالباً به نام سیستمینیل لکوترین ها یا پیتیدلکوترین ها خوانده می شوند. LTD_4 و LTC_4 تنگ کننده های قوی برونش می باشند و نقش اصلی را در بروز آسم و شوک آنافیلاکسی دارند. در آسم لکوترین ها به گیرنده های خود در مجاری هوایی متصل شده و سبب ادم مجاری هوایی، انقباض عضلات صاف برونش ها و واکنش های التهابی می شوند.

در رینیت آلرژیک، لکوترین ها بعد از مواجهه با آلرژن ها، از موکوس بینی آزاد شده و واکنش های مربوطه مثل احتقان و آبریزش بینی و ... را سبب می شوند.

مونته لوکاست ترکیبی خوراکی است که با تمایل بالا و به طور انتخابی به گیرنده ای LT_1 پیوند شده (بدون تأثیر بر روی گیرنده های مهم موجود در راه های هوایی شامل پروستانوئید، کولینرژیک یا بتا آدرنرژیک) و اعمال فیزیولوژیک لکوترین D_4 و رسپتورهای $CYSLT_1$ را مهار می کند بدون اینکه اثر آگونیستی داشته باشد.

مشخصات فارماکوکینتیکی

مونته لوکاست از راه خوراکی به سرعت جذب شده و فراهمی زیستی آن ۶۴٪ می باشد. مقدار جذب دارو چندان تحت تأثیر غذا نیست. حداکثر غلظت پلاسمایی آن پس از ۳ تا ۴ ساعت ایجاد می شود. در خون ۹۹٪ به پروتئین های پلاسمایی متصل است. متابولیسم عمدتاً کبدی دارد و قسمت اعظم آن توسط سیتوکروم های $CYP3A4$ و $CYP2C9$ متابولیزه می شود. نیمه عمر دارو در یک فرد جوان و سالم حدود ۲/۷ تا ۵/۵ ساعت می باشد. ۸۶٪ آن از طریق مدفوع و کمتر از ۰/۲٪ از طریق ادرار دفع می شود.

موارد مصرف

- پیشگیری و درمان طولانی مدت آسم در بزرگسالان و کودکان ۱۲ ماهه و بالاتر
- تسکین علائم رینیت آلرژیک (رینیت آلرژیک فصلی در بزرگسالان و بیماران کودک ۲ سال به بالا و رینیت آلرژیک دائمی در بزرگسالان و بیماران کودک ۶ ماهه و بالاتر)
- پیشگیری از برونکواسپاسم ناشی از ورزش در بیماران ۶ ساله و بالاتر
- کهیر ایدیوپاتیک مزمن

مقدار و روش مصرف

- الف) آسم ، رینیت آلرژیک فصلی ، رینیت آلرژیک دائمی
- بزرگسالان و کودکان ۱۵ سال به بالا : ۱۰ میلی گرم خوراکی یک بار در روز هنگام غروب.
 - کودکان ۶ تا ۱۴ سال : ۵ میلی گرم (قرص های جویدنی) خوراکی یک بار در روز هنگام غروب
 - کودکان ۲ تا ۵ سال : ۴ میلی گرم (یک پاکت گرانول) خوراکی یک بار در روز هنگام غروب
 - کودکان ۱۲ تا ۲۳ ماهه (فقط آسم) : یک پاکت ۴ میلی گرمی حاوی گرانول دارو ، یک بار در روز خوراکی هنگام غروب.
 - کودکان ۶ تا ۲۳ ماهه (فقط رینیت آلرژیک دائمی) : یک پاکت ۴ میلی گرمی حاوی گرانول دارو ، یک بار در روز خوراکی هنگام غروب.
 - نوزادان کمتر از ۱۲ ماهه : بی خطری و اثر بخشی دارو در این گروه به اثبات نرسیده است.
- ب) کهیر ایدیوپاتیک مزمن
- بزرگسالان : روزانه ۵ تا ۲۰ میلی گرم
- پ) پیشگیری از برونکواسپاسم ناشی از ورزش
- بزرگسالان و نوجوانان بالاتر از ۱۵ سال : روزانه ۱۰ میلی گرم خوراکی
 - کودکان ۶ تا ۱۴ سال : روزانه ۵ میلی گرم خوراکی

موارد منع مصرف دارو

- حساسیت به مونته لوکاست یا سایر ترکیبات فرمولاسیون

عوارض جانبی

عوارضی که در صورت بروز نیاز به مراقبت پزشکی دارند
عوارض با شیوع کم :

- افزایش آنزیم های کبدی (ALT و AST)

عوارض با شیوع بسیار کم :

- عفونت ادراری ، عفونت دستگاه تنفسی فوقانی

عوارض با شیوع ناشناخته :

- رفتارهای پرخطر، بی قراری ، اضطراب، آنافیلاکسی، هیپاتیت کلستاتیک ، توهم، تپش قلب، پانکراتیت، خارش، کهیر، تشنج

عوارضی که در صورت تداوم و یا بدتر شدن نیاز به مراقبت پزشکی دارند

عوارض با شیوع بالا :

- سردرد

عوارض با شیوع کمتر :

- درد شکم ، معده درد، ضعف، گیجی، خستگی غیر معمول، سرفه، دندان درد، خواب آلودگی، سوءهاضمه، تب، گاستروآنتریت، عفونت (معده یا شکم درد)، احتقان و آبریزش بینی ، راش پوستی

عوارض با شیوع ناشناخته :

- تورم و درد مفاصل و ماهیچه ها، سختی حرکت، کبودی پوست، اسهال، خواب آلودگی، اِدم، افزایش ریسک خونریزی، بی خوابی، تحریک پذیری، تهوع، کرختی و مور مور شدن اندام ها ، استفراغ

تداخل اثر

- فنوباربیتال ممکن است سطح خونی مونته لوکاست را تا ۴۰٪ کاهش دهد ولی نیاز به تنظیم دوز مونته لوکاست نمی باشد.
- با اینکه مونته لوکاست به طور روتین همزمان با دیگر داروهای پیشگیری و درمان آسم به کار می رود ، ولی تاکنون مطالعات تداخل خاصی را بین مونته لوکاست با این داروها و نیز تنوفیلین، پردنیزولون، کنتراسپتیوها، ترفنادین، دیگوکسین و وارفارین نشان نداده اند.

مصرف دارو در دوران حاملگی و شیر دهی

بارداری : این دارو طبق نظر سازمان غذا و داروی امریکا در طبقه بندی FDA pregnancy category در گروه B قرار دارد . مصرف این دارو در دوران بارداری توصیه نمی شود. پزشک ارزیابی خواهد کرد که آیا امکان مصرف این دارو در دوران بارداری وجود دارد یا خیر.

شیردهی : ترشح این دارو در شیر مادر مشخص نیست. مصرف این دارو در دوران شیردهی توصیه نمی شود. پزشک ارزیابی خواهد کرد آیا امکان مصرف این دارو در حین شیردهی و جود دارد یا خیر.

نکات آموزشی درباره این دارو

- بی خطری و اثر بخشی دارو در کودکان زیر یک سال مبتلا به آسم به اثبات نرسیده است.
- این دارو ممکن است سبب افزایش آنزیم های کبدی AST و ALT شود.
- این دارو ممکن است سبب افزایش میزان ائوزینوفیل ها گردد.
- در بیماران با اختلالات کبدی با احتیاط مصرف شود.
- اگر چه با شروع مونته لوکاست دوز کورتیکواستروئیدهای استنشاقی کاهش می یابد، با این حال مونته لوکاست نباید به طور ناگهانی جایگزین کورتیکواستروئیدهای خوراکی یا استنشاقی شود.
- دارو را طبق دستور پزشک مصرف نموده و از افزایش، کاهش یا قطع دارو خودداری نمائید.
- اگر مصرف داروی آسپرین (استیل سالیسیلیک اسید) یا داروهای ضد التهاب غیر استروئیدی (مانند ایبوپروفن ، دیکلوفناک ، ...) علائم آسم شما را بدتر می کند، در این صورت از مصرف داروهای ذکر شده خودداری نمائید.
- در صورت داشتن حساسیت به دارو یا سایر ترکیبات فرمولاسیون از مصرف آن خودداری نمائید.
- در صورت بارداری، شیردهی یا قصد بارداری قبل از شروع مصرف دارو به پزشک خود اطلاع دهید.
- مونته لوکاست در حمله ها و آسم ناشی از ورزش مصرف ندارد. بنابراین بیمار باید به اقلام دارویی یا تجهیزات اورژانسی در موقع حمله آسم مجهز باشد. اما درمان با مونته لوکاست در طول درگیری با بیماری آسم ادامه می یابد. بتا آگونیست های کوتاه اثر (اسپری سالبوتامول) باید حتماً در دسترس باشد.
- باید توجه داشت که درمان آسم مزمن با مونته لوکاست به تنهایی ممکن است نتواند حتماً از دوره های حاد ناشی از ورزش جلوگیری کند.
- در صورت فراموش کردن یک دوز از دارو ، به محض به یادآوردن ، آن دوز را مصرف نمائید. اگر این زمان نزدیک به زمان مصرف دوز بعدی دارو می باشد از مصرف دوز فراموش شده صرف نظر کرده و دوز بعدی را نیز دو برابر نکنید.
- همانطور که هنگام شدت بیماری دارو مصرف می شود، در مواقع فاقد علامت نیز باید آن را مصرف نمود.
- اگر آسم یا تنفس شما بدتر شد، سریعاً به پزشک خود اطلاع دهید.

- در صورت بروز ترکیبی از علائم زیر حتماً به پزشک خود اطلاع دهید:
- بیماری شبه آنفولانزا، کرخت یا سوزن سوزن شدن دست ها یا پاها ، بدتر شدن علائم ریوی، جوش
- عوارضی مانند سرگیجه و خواب آلودگی که بسیار به ندرت با این دارو گزارش شده است، ممکن است توانایی بعضی افراد را برای رانندگی یا استفاده از ماشین آلات تحت تأثیر قرار دهد، بنابراین در این موارد باید احتیاط شود.
- در صورت بروز هرگونه تغییر خلق یا رفتار فوراً به پزشک خود اطلاع دهید.
- این دارو را می توان با یا بدون غذا مصرف نمود.

مصرف دوز بیش از حد دارو و درمان آن

علائم بالینی : درد شکم ، هایپرکینزی (افزایش حرکات بدن) ، میدریازیس (بزرگ شدن مردمک چشم) حساس شدن چشم ها به نور ، خواب آلودگی و گیجی غیر معمول، تشنگی
 درمان : درمان شامل خروج بقایای جذب نشده دارو از دستگاه گوارش می باشد. کنترل علائم بالینی و حیاتی بیمار و در صورت نیاز درمان های حمایتی و علامتی انجام شود.

شرایط نگهداری دارو

دارو دور از نور و در دمای کمتر از ۳۰ درجه سانتی گراد نگهداری شود.