Эмесет



Код АТХ:

- A04AA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ондансетрон

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Раствор для в/в и в/м введения бесцветный, прозрачный.

	1 мл	**1 амп.**
ондансетрон (в форме гидрохлорида дигидрата)	2 мг	4 мг

Вспомогательные вещества: лимонная кислота безводная, тринатрия цитрата дигидрат, натрия хлорид, вода д/и.

2 мл - ампулы (5) - поддоны пластиковые (1) - пачки картонные.

Раствор для в/в и в/м введения бесцветный, прозрачный.

	1 мл	**1 амп.**
ондансетрон (в форме гидрохлорида дигидрата)	2 мг	8 мг

Вспомогательные вещества: лимонная кислота безводная, тринатрия цитрата дигидрат, натрия хлорид, вода д/и.

4 мл - ампулы (5) - поддоны пластиковые (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с выдавленной цифрой "4" на одной стороне.

	1 таб.
ондансетрон (в форме гидрохлорида дигидрата)	4 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал, лактоза, магния стеарат, гипромеллоза.

Состав пленочной оболочки: титана диоксид, тальк, пропиленгликоль.

6 шт. - стрипы (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с выдавленной цифрой "8" на одной стороне и линией разлома - на другой.

	1 таб.
ондансетрон (в форме гидрохлорида дигидрата)	8 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал, лактоза, магния стеарат, гипромеллоза.

Состав пленочной оболочки: титана диоксид, тальк, пропиленгликоль.

6 шт. - стрипы (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ондансетрон является селективным антагонистом рецепторов $5HT_3$ (серотонина). Лекарственные средства для цитостатической химиотерапии и радиотерапия могут вызвать повышение уровня серотонина, который путем активации вагусных афферентных волокон, содержащих рецепторы $5\text{-}HT_3$, вызывает рвотный рефлекс. Ондансетрон тормозит появление рвотного рефлекса путем блокады рецепторов $5\text{-}HT_3$ на уровне нейронов как центральной, так и периферической нервной системы.

По-видимому, на этом механизме действия основано предупреждение и лечение послеоперационной и вызванной цитостатической химио- и радиотерапией рвоты и тошноты.

Фармакокинетика

При в/м введении пиковая концентрация в плазме достигается в течение 10 мин. Распределение ондансетрона одинаково при в/м и в/в введении. После приема внутрь C_{max} ондансетрона в плазме крови достигается примерно через 1.5 ч. Абсолютная биодоступность составляет около 60%. Препарат подвергается метаболизму в печени. Связывание с белками плазмы составляет 70-76%. Почками в неизмененном виде выводится менее 5% препарата.

Как после приема внутрь, так и при парентеральном введении $T_{1/2}$ составляет около 3 ч, у пожилых больных может достигать 5 ч, а при выраженной печеночной недостаточности - 15-20 ч. При поражении почек (почечный клиренс меньше 15 мл/мин) $T_{1/2}$ увеличивается на 4-5 ч, но это увеличение не имеет клинического значения.

Показания к применению:

— предупреждение и устранение тошноты и рвоты, вызванных цитостатической химиотерапией и радиотерапией, а также послеоперационной тошноты и рвоты.

Относится к болезням:

- Тошнота

Противопоказания:

— беременность и период кормления грудью;

— детский возраст до 2-х лет (безопасность и эффективность применения не изучалась)

— повышенная чувствительность к любому компоненту препарата.

Способ применения и дозы:

Цитостатическая терапия.

Выбор режима дозирования определяется выраженностью эметогенного действия проводимой противоопухолевой терапии.

Взрослым, как правило, назначают в суточной дозе 8-32 мг, рекомендуются следующие режимы:

При умеренной эметогенной химиотерапии или радиотерапии:

— 8 мг в/в струйно медленно или в/м, непосредственно перед началом терапии;

— 8 мг внутрь за 1-2 ч до начала терапии, затем еще 8 мг внутрь через 12 ч после начала терапии.

При высокоэметогенной химиотерапии:

— 8 мг в/в струйно медленно непосредственно перед началом химиотерапии, а затем еще две в/в струйные инъекции по 8 мг, каждая из которых осуществляется через 2-4 ч;

— непрерывная 24-часовая инфузия препарата в дозе 24 мг со скоростью 1 мг/ч;

— 16-32 мг, разведенные в 50-100 мл соответствующего инфузионного раствора, в виде 15-минутной инфузии, непосредственно перед началом химиотерапии.

Эффективность Эмесета может быть увеличена путем разового в/в введения глюкокортикостероида (например, 20 мг дексаметазона) до начала химиотерапии; при приеме внутрь для усиления эффекта разовая доза может быть увеличена до 24 мг и назначена одновременно с 12 мг дексаметазона за 1-2 ч до начала проведения химиотерапии. Для предупреждения отсроченной (возникающей через 24 ч после начала химио- или радиотерапии) рвоты, рекомендуется продолжить применение препарата внутрь в виде таблеток по 8 мг 2 раза/сут в течение 5 дней.

Детям в возрасте старше 2-х лет препарат назначается в дозе 5 мг/м^2 поверхности тела в/в, непосредственно перед началом химиотерапии с последующим приемом внутрь в дозе 4 мг через 12 ч; после окончания химиотерапии рекомендуется продолжать лечение по 4 мг 2 раза/сут внутрь в течение 5 дней.

Предупреждение послеоперационной тошноты и рвоты

Взрослым вводят разовую дозу 4 мг /м или в/в струйно медленно в начале наркоза или назначают 16 мг внутрь за 1 ч до начала наркоза.

Для купирования возникшей тошноты и рвоты рекомендуется в/м или медленное в/в введение 4 мг препарата.

Внутримышечно в один и тот же участок тела Эмесет может быть введен в дозе, не превышающей 4 мг!

Детям для предотвращения послеоперационной тошноты и рвоты Эмесет применяется исключительно парентерально в разовой дозе 0.1 мг/кг (максимально до 4 мг) в виде медленной в/в инъекции до или после анестезии.

Для лечения развившейся послеоперационной тошноты и рвоты у детей рекомендуется медленное в/в введение разовой дозы препарата 0.1 мг/кг (максимально до 4 мг).

В отношении предотвращения и лечения послеоперационной тошноты и рвоты *у **детей** в возрасте до 2-х лет* достаточного опыта нет.

Пожилые больные.

Изменения дозировки не требуется.

Больные с нарушениями функции почек.

При нарушении функции почек изменять обычную суточную дозу и частоту введения препарата не требуется.

У **пациентов с нарушением функции печени** в значительной степени уменьшается клиренс Эмесета,причем увеличивается время полувыведения его из плазмы, поэтому не следует превышать суточную дозу - 8 мг.

Для разведения инъекционного раствора могут применяться следующие растворы:

— 0.9% раствор натрия хлорида,

— 5% раствор декстрозы,

— раствор Рингера,

— 0.3% раствор калия хлорида и 0.9% раствор натрия хлорида,

— 0,3% раствор калия хлорида и 5% раствор декстрозы.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, спонтанные двигательные расстройства и судороги.

Со стороны сердечнососудистой системы: боли в грудной клетке, в ряде случаев с депрессией сегмента ST , аритмии, брадикардия, снижение артериального давления.

Со стороны пищеварительной системы: икота, сухость во рту, диарея, запор, иногда бессимптомное преходящее

повышение уровня аминотрансфераз в сыворотке крови.

Аллергические реакции: крапивница, бронхоспазм, ларингоспазм, ангионевротический отек, анафилаксия.

Местные реакции: боль, жжение и покраснение в месте введения.

Прочие: прилив крови к лицу, чувство жара, временное нарушение остроты зрения, гипокалиемия.

Передозировка:

В случаях предполагаемой передозировки показана симптоматическая терапия.

При передозировке таблетками Эмесет не рекомендуется применение ипекакуаны, так как маловероятно, что этот препарат будет эффективен в период антиэметического действия ондансетрона.

Специфический антидот не известен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Так как ондансетрон метаболизируется ферментной системой (цитохром Р450) печени, требуется осторожность при совместном применении:

— с ферментативными индукторами Р450 (CYP2D6 и CYP3A) (барбитураты, карбамазепин, каризопродол, глютетимид, гризеофульвин, закись азота, папаверин, фенилбутазон, фенитоин (вероятно и другие гидантоины), рифампицин, толбутамид);

— с ингибиторами ферментов Р450 (CYP2D6 и CYP3A) (аллопуринол, макролидные антибиотики, антидепрессанты - ингибиторы МАО, хлорамфеникол, циметидин, пероральные контрацептивы, содержащие эстрогены, дилтиазем, дисульфирам, вальпроевая кислота, вальпроат натрия, эритромицин, флюконазол, фторхинолоны, изониазид, кетоконазол, ловастатин, метронидазол, омепразол, пропранолол, хинидин, хинин, верапамил).

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов, у которых ранее при применении других селективных антагонистов $5HT_3$-рецепторов, наблюдались реакции повышенной чувствительности, при применении Эмесета также могут развиться аналогичные реакции.

Так как ондансетрон замедляет моторику кишечника, больные с признаками кишечной непроходимости после применения препарата требуют особого наблюдения.

Инфузионный раствор должен быть приготовлен непосредственно перед использованием. В случае необходимости готовый инфузионный раствор может храниться до использования максимально в течение 24 ч при температуре 2-8°С.

Во время проведения инфузии защиты от света не требуется; разведенный инъекционный раствор сохраняет свою стабильность как минимум в течение 24 ч при естественном свете или нормальном освещении.

При нарушениях функции почек

При нарушении функции почек изменять обычную суточную дозу и частоту введения препарата не требуется.

При нарушениях функции печени

У**пациентов с нарушением функции печени** в значительной степени уменьшается клиренс Эмесета,причем увеличивается время полувыведения его из плазмы, поэтому не следует превышать суточную дозу - 8 мг.

Применение в пожилом возрасте

При применении препарата у пожилых больных с нормальной функцией печени не требуется коррекции режима дозирования.

Применение в детском возрасте

Препарат не назначают детям в возрасте до 2-х лет.

В отношении предотвращения и лечения послеоперационной тошноты и рвоты *у* ***детей*** *в возрасте до 2-х лет* достаточного опыта нет.

Условия хранения:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, хранить при температуре не выше 25°C в защищенном от света месте.

Раствор для в/в и в/м введения хранить при температуре не выше 30°C в защищенном от света, недоступном для детей месте.

Срок годности: Раствор для в/в и в/м введения - 3 года.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой - 3 года.

Препарат не следует использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Emeset