Эметрон



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:

Таблетки, покрытые оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "4" на одной стороне и "RG" - на другой.

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

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, тальк, крахмал прежелатинированный, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный, лактоза безводная, железа оксид желтый, титана диоксид, макрогол 6000, сепифильм 003 (гидроксипропилметилцеллюлоза+полиоксистеарат).

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "8" на одной стороне и "RG" - на другой.

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

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, тальк, крахмал прежелатинизированный, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный, лактоза безводная, железа оксид желтый, титана диоксид, макрогол 6000, сепифильм 003 (гидроксипропилметилцеллюлоза+полиоксистеарат).

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Раствор для инъекций чистый, бесцветный или почти бесцветный.

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

Вспомогательные вещества: тринатрия цитрат, лимонной кислоты моногидрат, сорбитол, вода д/и.

2 мл - ампулы (5) - пачки картонные.

Раствор для инъекций чистый, бесцветный или почти бесцветный.

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

Вспомогательные вещества: тринатрия цитрат, лимонной кислоты моногидрат, сорбитол, вода д/и.

4 мл - ампулы (5) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противорвотный препарат центрального действия. Ондансетрон является селективным антагонистом серотониновых $5HT_3$- рецепторов. Лекарственные средства для цитостатической химиотерапии и радиотерапия могут вызвать повышение уровня серотонина, который путем активации вагусных афферентных волокон, содержащих серотониновые $5HT_3$-рецепторы, вызывает рвотный рефлекс. Ондансетрон тормозит появление рвотного рефлекса путем блокады серотониновых $5HT_3$- рецепторо 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 C_{max} измеряется в течении 10 мин после инъекции. 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 после приема внутрь составляет около 60%. Препарат подвергается метаболизму в печени. Связывание с белками плазмы составляет 70-76%. С мочой в неизмененном виде выделяется 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 - 15-22 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;

— период лактации;

— 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.

Для **взрослых** суточная доза, как правило, составляет 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; или 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 2 в/в струйные инъекции по 8 мг, каждая из которых осуществляется через 2-4 ч; или непрерывная 24-часовая инфузия препарата в дозе 24 мг со скоростью 1 мг/ч; или 16-32 мг, разведенные в 50-100 мл соответствующего инфузионного раствора, в виде 15-минутной инфузии, непосредственно перед началом химиотерапии.

Эффективность ондансетрона может быть увеличена путем разового в/в введения глюкокортикоида (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 рвоты, возникающей через 24-ч после начала химио- или радиотерапии,* рекомендуется продолжать применение препарата внутрь по 8 мг 2 раза/сут в течение 5 дней.

Детям 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 в/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.

В/м в один и тот же участок тела ондансетрон может быть введен в дозе, не превышающей 4 мг.

Детям для *предотвращения послеоперационной тошноты и рвоты* ондансетрон применяется исключительно парентерально в разовой дозе 0.1 мг/кг (максимально до 4 мг) в виде медленной в/в инъекции во время 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 лет** достаточного опыта нет.

Пожилым больным изменения дозировки не требуется.

При **поражении почек** изменять обычную суточную дозу и частоту введения препарата не требуется.

При **поражении печени** в значительной степени уменьшается клиренс ондансетрона, причем увеличивается $T_{1/2}$ из плазмы, поэтому не следует превышать суточную дозу 8 мг/сут.

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:

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

Со стороны пищеварительной системы: икота, сухость во рту, диарея, запор; иногда - бессимптомное преходящее повышение уровня аминотрансфераз в сыворотке крови.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: боли в грудной клетке, в ряде случаев с депрессией сегмента ST, аритмии, брадшсардия, снижение АД.

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

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

Прочие: прилив крови к лицу, чувство жара, временное нарушение остроты зрения; редко - гипокалиемия (связь с приемом препарата однозначно не установлена).

Передозировка:

В случаях предполагаемой передозировки показана симптоматическая терапия. Специфический антидот не известен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Т.к. 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, фторхинолопы, изониазид, кетоконазол, ловастатин, метронидазол, омепразол, пропранолол, хинидин, хинин, верапамил).

Не вступает во взаимодействие с этанолом, темазепамом, фуросемидом, трамадолом и пропофолом.

Ондансетрон в концентрации 16-160 мкг/мл фармацевтически совместим со следующими лекарственными средствами, которые можно вводить через Y-образный инжектор:

— цисплатин (в концентрации до 0.48 мг/мл) в течение 1-8 ч;

— 5-фторурацил (в концентрации до 0.8 мг/мл со скоростью 20 мл/ч - более высокие концентрации могут вызвать выпадение в осадок ондансетрона);

— карбоплатин (в концентрации 0.18-9.9 мг/мл в течение 10-60 мин);

— этопозид (в концентрации 0.14-0.25 мг/мл в течение 30-60 мин);

— цефтазидим (в дозе 0.25-2 г, в виде в/в болюсной инъекции в течение 5 мин);

циклофосфамид (в дозе от 0.1-1 г, в виде в/в болюсной инъекции в течение 5 мин);

— доксорубицин (в дозе 10-100 мг, в виде в/в болюсной инъекции в течение 5 мин);

— дексаметазон: возможно в/в введение 20 мг дексаметазона медленно, в течение 2-5 мин. Лекарственные средства молено вводить через одну капельницу, при этом в растворе концентрации дексаметазона натрия фосфата могут составлять от 32 мкг до 2.5 мг/мл, ондансетрона - от 8 мкг до 1 мг/мл.

Особые указания и меры предосторожности:

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

Т.к. ондансетрон вызывает запор, больные с признаками непроходимости кишечника после применения препарата требуют регулярного 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 искусственном освещении.

При наличии непереносимости лактозы следует учитывать, что 4 мг таблетка содержит 59.25 мг лактозы, 8 мг – 118.5 мг соответственно.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не обладает седативным действием и не влияет на психомоторные способности, необходимые для управления автомобилем и другими механизмами.

При нарушениях функции почек

При **поражении почек** изменять обычную суточную дозу и частоту введения препарата не требуется.

При нарушениях функции печени

При **поражении печени** в значительной степени уменьшается клиренс ондансетрона, причем увеличивается $T_{1/2}$ из плазмы, поэтому не следует превышать суточную дозу 8 мг/сут.

Применение в пожилом возрасте

Пожилым больным изменения дозировки не требуется.

Применение в детском возрасте

Детям 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.

Детям для *предотвращения послеоперационной тошноты и рвоты* ондансетрон применяется исключительно парентерально в разовой дозе 0.1 мг/кг (максимально до 4 мг) в виде медленной в/в инъекции во время 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 лет** достаточного опыта нет.

Условия хранения:

Список Б. Раствор для инъекций хранят при температуре 15-30°С в защищенном от света месте, недоступном для детей, таблетки - при температуре 15-30° С, в месте, недоступном для детей.

Срок годности таблеток - 3 года, раствора для инъекций - 4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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