

Китрил



Код АТХ:

- [A04AA02](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Гранисетрон](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, треугольные, двояковыпуклые, с гравировкой "K1" на одной стороне.

	1 таб.
гранисетрона гидрохлорид	1.12 мг,
что соответствует содержанию гранисетрона	1 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 69.4 мг, гипромеллоза (3 мПа.с) - 4 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 20 мг, магния стеарат - 0.5 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза (6 мПа.с), титана диоксид (E171), макрогол 400, полисорбат 80 - 3 мг; допускается использование готовой смеси опадрай (Opadry) YS-1-18027-A.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Интермедианты](#)
- [Органотропные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противорвотный препарат, селективный антагонист 5-гидрокситриптаминовых (5-HT₃) рецепторов, расположенных в окончаниях блуждающего нерва и триггерной зоне дна IV желудочка головного мозга (практически не влияет на другие рецепторы серотонина). Оказывает выраженный противорвотный эффект. Исследования показали, что у препарата Китрил низкая аффинность к другим видам рецепторов, включая другие типы серотониновых рецепторов и допаминовые D₂-рецепторы. Устраняет рвоту, возникающую при возбуждении парасимпатической нервной системы вследствие высвобождения серотонина энтерохромаффинными клетками.

Китрил

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Китрил устраняет тошноту и рвоту, вызванную цитотоксической химиотерапией, лучевой терапией, а также послеоперационную тошноту и рвоту.

Китрил не влияет на концентрацию пролактина и альдостерона в плазме крови.

Китрил не оказывает мутагенного действия *in vivo* и *in vitro*. При пожизненном введении в высоких дозах повышает риск возникновения гепатоцеллюлярных опухолей у животных.

Фармакокинетика

Всасывание

Всасывание гранисетрона после перорального применения – быстрое и полное, но абсолютная биодоступность снижается до 60% за счет эффекта первого прохождения через печень. Прием пищи не влияет на биодоступность гранисетрона.

Распределение

Гранисетрон распределяется по органам и тканям (включая плазму и эритроциты), средний объем распределения составляет 3 л/кг. Связь с белками плазмы составляет примерно 65%.

Метаболизм

Биотрансформация происходит в основном в печени путем N-деметилирования и окислением ароматического кольца с последующей конъюгацией. Исследования *in vitro* показали, что кетоконазол ингибирует метаболизм гранисетрона, что предполагает участие изоферментов подсемейства CYP3A. Другие исследования *in vitro* показали, что гранисетрон не влияет на активность изофермента CYP3A4.

Выведение

Почками в неизменном виде выводится в среднем 12% и в виде метаболитов 47% дозы. Оставшиеся 41% выводятся через кишечник в виде метаболитов.

$T_{1/2}$ при пероральном приеме составляет 9 ч, с широкой индивидуальной вариабельностью.

Концентрации гранисетрона в плазме нечетко коррелируют с его противорвотным действием. Терапевтический эффект наблюдается даже тогда, когда гранисетрон уже не обнаруживается в плазме.

Фармакокинетика гранисетрона при пероральном приеме сохраняет линейный характер в диапазоне доз, до 2.5 раз превышающих рекомендованные.

Показания к применению:

— профилактика тошноты и рвоты при проведении цитостатической химиотерапии и лучевой терапии у взрослых.

Относится к болезням:

- [Тошнота](#)

Противопоказания:

- период лактации (грудного вскармливания);
- детский возраст до 12 лет (недостаточно данных, позволяющих установить оптимальный режим дозирования у данной возрастной группы);
- повышенная чувствительность к гранисетрону или любому из компонентов препарата;
- реакции гиперчувствительности к другим селективным антагонистам серотониновых 5-HT₃-рецепторов в анамнезе.

С *осторожностью*: частичная кишечная непроходимость; беременность; дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Способ применения и дозы:

Цитостатическая химиотерапия (профилактика)

Внутрь по 1 мг 2 раза/сут или 2 мг 1 раз/сут не более 7 дней после начала цитостатической терапии. При этом первая доза должна быть принята за 1 час до начала цитостатической терапии.

Лучевая терапия (профилактика)

Внутрь 2 мг 1 раз/сут; при этом первая доза должна быть принята за 1 час до начала лучевой терапии.

Специальный режим дозирования

Китрил в форме таблеток не рекомендуются для применения у **детей в возрасте до 12 лет**, т.к. недостаточно данных, позволяющих установить оптимальный режим дозирования у данной возрастной группы. Для профилактики и лечения тошноты и рвоты при проведении цитостатической терапии у **детей** используется другая лекарственная форма препарата Китрил - концентрат для приготовления раствора для инфузий.

Побочное действие:

В большинстве случаев побочные реакции при применении препарата Китрил не были тяжелыми и переносились пациентами без прерывания терапии.

Отмечены редкие и иногда тяжелые случаи проявления повышенной чувствительности (например, анафилаксия).

Со стороны нервной системы: головная боль, бессонница, сонливость, слабость, тревога, беспокойство, головокружение.

Со стороны пищеварительной системы: боль в животе, запор, диарея, метеоризм, повышение активности "печеночных" трансаминаз (АЛТ, АСТ) обычно в пределах их нормальных значений, диспепсия, изжога, изменение вкусовых ощущений.

Аллергические реакции: кожная сыпь, гипертермия, бронхоспазм, крапивница, зуд, реакции повышенной чувствительности.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмия, боль в груди, снижение или повышение АД.

Как и при применении других антагонистов серотониновых 5-НТ₃-рецепторов, при терапии препаратом Китрил сообщалось о случаях изменений параметров ЭКГ, включая случаи увеличения интервала QT. Данные изменения были незначительными и, как правило, не имели клинического значения, в частности не имели признаков проаритмогенного действия.

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки: кожная сыпь, отек/отека лица.

Со стороны организма в целом: гриппоподобный синдром, включая лихорадку и озноб.

Передозировка:

Симптомы: применение 38 мг гранисетрона в виде однократной в/в инъекции не сопровождалось развитием серьезных нежелательных эффектов, кроме легкой головной боли.

Лечение: специфический антидот для препарата Китрил не известен. Показано проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности Китрил назначается только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Китрил не оказывает тератогенного действия на животных, исследования у беременных женщин не проводились.

Препарат противопоказан в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Гранисетрон не влияет на активность изофермента CYP3A4 (отвечающего за метаболизм некоторых наркотических анальгетиков). Эффективность гранисетрона может быть усилена в/в введением дексаметазона (8-20 мг) до начала химиотерапии.

Исследования in vitro показали, что кетоконазол ингибирует метаболизм гранисетрона, что предполагает участие изоферментов подсемейства CYP3A. Специальных исследований по взаимодействию со средствами для общей анестезии не проводилось, но гранисетрон хорошо переносится при одновременном применении с подобными препаратами и наркотическими анальгетиками.

При индукции "печеночных" ферментов фенобарбиталом наблюдалось увеличение клиренса гранисетрона (при в/в введении) примерно на четверть.

Не выявлено взаимодействия при одновременном применении с бензодиазепинами, транквилизаторами, противоязвенными препаратами из группы блокаторов H₂-гистаминовых рецепторов и цитостатическими лекарственными средствами, вызывающими рвоту.

Как и при применении других антагонистов серотониновых 5-HT₃-рецепторов, при терапии гранисетроном сообщалось о случаях изменений параметров ЭКГ, включая случаи увеличения интервала QT. Данные изменения были несущественными и, как правило, не имели клинического значения, в частности не имели признаков проаритмогенного действия. Однако у пациентов, получающих сопутствующую терапию препаратами с известной способностью пролонгировать интервал QT и/или аритмогенной активностью, наблюдаемые изменения на ЭКГ при терапии гранисетроном могут привести к клинически значимым последствиям.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты с признаками частичной непроходимости кишечника после введения препарата Китрил должны находиться под наблюдением врача, т.к. Китрил может снижать моторику кишечника.

Китрил безопасен для применения у пациентов пожилого возраста и пациентов с почечной или печеночной недостаточностью.

У здоровых добровольцев Китрил при в/в введении в дозе до 200 мкг/кг не оказывает клинически значимого влияния на ЭЭГ или результаты психометрических тестов.

Как и при применении других антагонистов серотониновых 5-HT₃-рецепторов, при терапии препаратом Китрил сообщалось об изменениях параметров ЭКГ, включая случаи увеличения интервала QT. Данные изменения были несущественными и, как правило, не имели клинического значения, в частности не имели признаков проаритмогенного действия. Однако у пациентов с уже существующими аритмиями или заболеваниями, сопровождающимися нарушением сердечной проводимости, наблюдаемые изменения параметров ЭКГ при терапии препаратом Китрил могут привести к клинически значимым последствиям. В связи с этим следует проявлять осторожность при назначении препарата пациентам с сопутствующими сердечными заболеваниями, получающим кардиотоксическую химиотерапию и/или имеющим сопутствующие электролитные нарушения.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Данные о влиянии препарата Китрил на способность к вождению транспортных средств отсутствуют. Однако следует соблюдать осторожность, учитывая, что в единичных случаях при терапии препаратом Китрил сообщалось о сонливости и головокружении.

При нарушениях функции почек

Китрил безопасен для применения у пациентов с почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Китрил безопасен для применения у пациентов с печеночной недостаточностью.

Применение в пожилом возрасте

Китрил безопасен для применения у пожилых пациентов.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 12 лет (недостаточно данных, позволяющих установить оптимальный режим дозирования у данной возрастной группы).

Условия хранения:

Препарат хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

Китрил

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Kitрил>