Нотирол



Код АТХ:

- A04AA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Гранисетрон

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 пленочной оболочкой белого цвета, треугольные, двояковыпуклые, с гравировкой "G1" на одной стороне.

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

Вспомогательные вещества: лактоза безводная - 69.38 мг, целлюлоза микрокристаллическая (тип 101) - 20 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 5 мг, гипромеллоза 2910/5сР - 4 мг, магния стеарат - 0.5 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 85F18378 белый ~ 3 мг (поливиниловый спирт - 1.2 мг, титана диоксид (Е171) - 0.75 мг, макрогол 3350 - 0.61 мг, тальк - 0.44 мг).

1 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.
5 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, треугольные, двояковыпуклые, с гравировкой "G2" с одной стороны.

	1 таб.
гранисетрона гидрохлорид	2.24 мг,
что соответствует содержанию гранисетрона	2 мг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная - 138.76 мг, целлюлоза микрокристаллическая (тип 101) - 40 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 10 мг, гипромеллоза 2910/5сР - 8 мг, магния стеарат - 1 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 85F18378 белый ~ 6 мг (поливиниловый спирт - 2.4 мг, титана диоксид (E171) - 1.5 мг, макрогол 3350 - 1.21 мг, тальк - 0.89 мг).

1 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.
5 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гранисетрон - селективный антагонист 5-гидрокситриптаминовых (5-HT_3) рецепторов, расположенных в окончаниях вагусного нерва и триггерной зоне дна IV желудочка мозга (практически не влияет на другие рецепторы серотонина), с выраженным противорвотным эффектом. Исследования показали, что у гранисетрона низкая аффинность к другим видам рецепторов, включая 5-НТ и места связывания дофамина $Д_2$. Устраняет рвоту, возникающую при возбуждении парасимпатической нервной системы, вследствие высвобождения серотонина энтерохромаффинными клетками.

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

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

Фармакокинетика

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 препарата. C_{max} препарата в плазме крови - 5.99 нг/мл.

Гранисетрон распределяется по органам и тканям, средний объем распределения составляет 3 л/кг. Распределяется в плазме и в эритроцитах. Связь с белками плазмы составляет примерно 65%.

Биотрансформация происходит в основном в печени путем N -деметилирования и окислением ароматического кольца с последующей конъюгацией. In vitro исследования показали, что кетоконазол ингибирует метаболизм гранисетрона, что предполагает участие изофермета 3А системы цитохрома Р450.

С мочой в неизмененном виде выводится, в среднем, 12% и в виде метаболитов 47% дозы, оставшийся процент метаболитов выводится с калом. $T_{1/2}$ составляет 9 часов, с широкой индивидуальной вариабельностью. Концентрации гранисетрона в плазме не четко коррелируют с его противорвотным действием. Терапевтический эффект наблюдается даже тогда, когда гранисетрон уже не обнаруживается в плазме.

Показания к применению:

— профилактика острой и отсроченной тошноты и рвоты, вызванных цитостатической химиотерапией и лучевой терапией у взрослых.

Относится к болезням:

- Тошнота

Противопоказания:

— реакции гиперчувствительности к другим селективным антагонистам 5-HT_3 рецепторов в анамнезе;

— беременность и период лактации;

— детский возраст (сведения об эффективности и безопасности отсутствуют);

— повышенная чувствительность к гранисетрону или любому другому компоненту препарата.

С осторожностью: частичная кишечная непроходимость.

Способ применения и дозы:

Внутрь по 1 мг 2 раза/сут или 2 мг 1 раз/сут (при цитостатической терапии) или 2 мг 1 раз/сут (при лучевой терапии), при этом первая доза должна быть принята за 1 ч до начала цитостатической или лучевой терапии. Прием Нотирола должен продолжаться не более 7 дней.

Пациенты с почечной или печеночной недостаточностью, пожилые пациенты

Коррекции дозы не требуется.

Побочное действие:

В большинстве случаев побочные действия при применении гранисетрона не были тяжелыми и переносились пациентами без прерывания терапии. Отмечены редкие и иногда тяжелые случаи проявления повышенной чувствительности (например, анафилаксия).

Со стороны пищеварительной системы: боль в животе, запор, диарея, метеоризм, повышение активности "печеночных" трансаминаз (АЛТ, АСТ); диспепсия; *редко* - изжога, изменение вкусовых ощущений.

Со стороны нервной системы: головная боль, бессонница, сонливость (связь возникновения сонливости с приемом гранисетрона не установлена), слабость; *редко* - тревога, беспокойство, головокружение;

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмия, повышение или снижение артериального давления, боль в груди;

Со стороны иммунной системы: кожная сыпь, гипертермия, бронхоспазм, крапивница, зуд; *редко* - реакции повышенной чувствительности.

Со стороны кожи и ее придатков: очень редко - кожная сыпь, отёк/отёк лица.

Прочие: очень редко - гриппоподобный синдром.

Передозировка:

Специфический антидот для Нотирола не известен. В случае передозировки лечение симптоматическое.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Нотирол не влияет на активность метаболизирующих ферментов подсемейства 3А4 системы цитохрома Р450 (отвечающих за метаболизм некоторых наркотических анальгетиков).

Эффективность гранисетрона может быть усилена в/в введением дексаметазона (8-20 мг) до начала химиотерапии.

In vitro исследования показали, что кетоконазол ингибирует метаболизм гранисетрона, что предполагает участие изофермента 3А системы цитохрома Р450. Специальных исследований по взаимодействию со средствами для общей анестезии не проводилось, но гранисетрон хорошо переносится при одновременном назначении с подобными препаратами и наркотическими анальгетиками.

Не выявлено взаимодействия при одновременном назначении с бензодиазепинами, транквилизаторами, противоязвенными препаратами и другими цитостатическими лекарственными средствами, вызывающими рвоту.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты с признаками частичной непроходимости кишечника после введения Нотирола должны находиться под наблюдением врача, так как Нотирол может снижать моторику кишечника.

В связи с наличием в составе лактозы пациенты с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, дефицит лактозы или глюкозно-галактозная мальабсорбция принимать препарат не рекомендуется.

Влияние на способность к вождению транспортных средств и работу с машинами и механизмами.

Данные о влиянии гранисетрона на способность к вождению транспортного средства отсутствуют.

Условия хранения:

Хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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