Осетрон



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:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с тиснением "Rx" на одной стороне и гладкой поверхностью на другой стороне.

	1 таб.
ондансетрона гидрохлорида дигидрат	5 мг,
что соответствует содержанию ондансетрона	4 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая (Ultra-102), лактоза, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

4 шт. - стрипы (1) - пачки картонные.
10 шт. - стрипы (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с тиснением "Rx" на одной стороне и гладкой поверхностью на другой стороне.

	1 таб.
ондансетрона гидрохлорида дигидрат	9.976 мг,
что соответствует содержанию ондансетрона	8 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая (Ultra-102), лактоза, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

4 шт. - стрипы (1) - пачки картонные.
10 шт. - стрипы (1) - пачки картонные.

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

	1 мл	**1 амп.**
ондансетрона гидрохлорида дигидрат	2.494 мг	4.988 мг,
что соответствует содержанию ондансетрона	2 мг	4 мг

Вспомогательные вещества: лимонной кислоты моногидрат, натрия цитрат, натрия хлорид, вода д/и.

2 мл - ампулы бесцветного стекла (2) - блистеры (1) - пачки картонные.
2 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - блистеры (2) - пачки картонные.
2 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - блистеры (10) - пачки картонные.

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

	1 мл	**1 амп.**
ондансетрона гидрохлорида дигидрат	2.494 мг	9.976 мг,
что соответствует содержанию ондансетрона	2 мг	8 мг

Вспомогательные вещества: лимонной кислоты моногидрат, натрия цитрат, натрия хлорид, вода д/и.

4 мл - ампулы бесцветного стекла (2) - блистеры (1) - пачки картонные.
4 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - блистеры (2) - пачки картонные.
4 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - блистеры (10) - 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 радиотерапии могут вызывать повышение уровня серотонина, который путем активации вагусных афферентных волокон, содержащих $5HT_3$-рецепторы, вызывает рвотный рефлекс. Селективно блокирует серотониновые $5HT_3$-рецепторы нейронов центральной и периферической нервной системы, окончания блуждающего нерва в кишечнике и в центрах ЦНС (преимущественно дно IV желудочка), регулирующих осуществление рвотных рефлексов.

Не нарушает координации движений, не вызывает седативного эффекта и снижения работоспособности. Обладает анксиолитической активностью. Не изменяет концентрацию пролактина в плазме.

Фармакокинетика

После приема внутрь время достижения C_{max} - 1.5 ч. После в/м введения время достижения C_{max} - 10 мин.

Связывание с белками плазмы крови составляет 70-76%.

Метаболизируется в печени с участием микросомальных ферментов (CYP2D6). Отсутствие фермента CYP 2D6 (полиморфизм дебрисохина) не оказывает влияния на фармакокинетику ондансетрона.

Как после приема внутрь, так и после парентерального введения $T_{1/2}$ составляет 3 ч. В неизмененном виде с мочой выводится менее 5% от введенной дозы.

Фармакокинетические параметры ондансетрона не изменяются при его многократном введении.

У пациентов с умеренной почечной недостаточностью (КК 15-60 мл/мин) снижены как системный клиренс, так и V_d, результатом этого является небольшое и клинически незначимое увеличение $T_{1/2}$. Фармакокинетика ондансетрона практически не меняется у пациентов с тяжелым нарушением функции почек, находящихся на хроническом гемодиализе (исследования проводились в перерывах между сеансами гемодиализа).

У пациентов с выраженными нарушениями функции печени резко снижается системный клиренс ондансетрона, в результате чего увеличивается $T_{1/2}$ до 15-20 ч. $T_{1/2}$ ондансетрона не зависит от способа введения.

У пациентов пожилого возраста после приема внутрь или парентерального введения $T_{1/2}$ может увеличиваться до 5 ч.

Показания к применению:

— предупреждение и устранение тошноты и рвоты, вызванных цитотоксической химио- или радиотерапией;

— предупреждение и устранение тошноты и рвоты в послеоперационном периоде.

Относится к болезням:

- Тошнота

Противопоказания:

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский возраст до 2 лет;

— повышенная чувствительность к ондансетрону или другим компонентам препарата.

Способ применения и дозы:

Тошнота и рвота, вызванные цитостатической терапией

Выбор режима дозирования определяется эметогенностью противоопухолевой терапии.

Для **взрослых** суточная доза Осетрона составляет в среднем 8-32 мг.

При *умеренно-эметогенной химиотерапии или радиотерапии* назначают внутрь 8 мг ондансетрона за 1-2 ч до начала проведения основной терапии с последующим приемом еще 8 мг через 12 ч, либо 8 мг в/в струйно медленно или в/м непосредственно перед началом терапии.

При *высокоэметогенной химиотерапии* назначают внутрь 24 мг Осетрона одновременно с 12 мг дексаметазона за 1-2 ч до начала проведения химиотерапии. Для профилактики поздней или длительной рвоты, возникающей через 24 ч, следует продолжить прием ондансетрона в дозе 8 мг 2 раза/сут в течение 5 дней.

Для парентерального введения рекомендуются следующие режимы:

— 8 мг в/в струйно медленно непосредственно перед началом химиотерапии, а затем еще 2 в/в 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 ондансетрона может быть увеличена путем разового в/в введения ГКС (например, 20 мг дексаметазона) до начала химиотерапии.

Детям старше 2 лет препарат назначают в дозе 5 мг/м^2 поверхности тела в/в, непосредственно перед началом химиотерапии, с последующим приемом внутрь 4 мг через 12 ч; лечение рекомендуется продолжить в дозе 4 мг 2 раза/сут внутрь в течение 5 дней.

Послеоперационная тошнота и рвота

Для *предупреждения послеоперационной тошноты и рвоты* **взрослым** вводят препарат в разовой дозе 4 мг в/м или в/в струйно (медленно) в начале наркоза или назначают 16 мг внутрь за 1 ч до начала общей анестезии.

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!

Для *предотвращения послеоперационной тошноты и рвоты* у **детей** ондансетрон 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 препарата в разовой дозе 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.

Пациентам пожилого возраста изменения дозировки не требуется.

Пациентам с нарушением функции почек изменять обычную суточную дозу и частоту введения препарата не требуется.

При **умеренном или тяжелом нарушении функции печени** клиренс ондансетрона в значительной степени снижается, при этом увеличивается его $T_{1/2}$, поэтому таким пациентам не рекомендуется назначать ондансетрон в дозе более 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, запоры или диарея; иногда - бессимптомное преходящее повышение активности аминотрансфераз в сыворотке крови.

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

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

Местные реакции: гиперемия, боль, жжение в месте введения.

Прочие: прилив крови к коже лица, чувство жара, временное нарушение остроты зрения, гипокалиемия, гиперкреатинемия.

Передозировка:

В случаях предполагаемой передозировки показана симптоматическая терапия. Специфический антидот неизвестен. При передозировке ондансетрона не рекомендуется применение ипекакуаны, т.к. маловероятно, что этот препарат будет эффективен в период антиэметического действия ондансетрона.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения ондансетрона при беременности не установлена.

Противопоказано применение препарата Осетрон при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Т.к. ондансетрон метаболизируется ферментной системой (цитохром Р450) печени, требуется осторожность при совместном применении:

— с индукторами изоферментов цитохрома Р450 (CYP2D6 и CYP3A) - барбитураты, карбамазепин, каризопродол, глютетимид, гризеофульвин, динитроген оксид, папаверин, фенилбутазон, фенитоин (вероятно и другие гидантоины), рифампицин, толбутамид;

— с ингибиторами изоферментов Р450 (CYP2D6 и CYP3A) - аллопуринол, макролидные антибиотики, антидепрессанты (ингибиторы МАО), хлорамфеникол, циметидин, эстрогенсодержащие пероральные контрацептивы, дилтиазем, дисульфирам, вальпроевая кислота и ее соли, эритромицин, флуконазол, фторхинолоны, изониазид, кетоконазол, ловастатин, метронидазол, омепразол, пропранолол, хинидин, хинин, верапамил.

Ондансетрон в концентрации 16-160 мкг/мл фармацевтически совместим и может вводиться через Y-образный инжектор в/в капельно совместно со следующими лекарственными средствами:

— 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 преципитацию 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 0.25-2.0 г в виде в/в болюсной инъекции в течение 5 мин);

— циклофосфамид (в дозе от 0.1-1.0 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). Препараты можно вводить через одну капельницу, при этом в растворе концентрации дексаметазона могут составлять от 32 мкг до 2.5 мг/мл, ондансетрона от 8 мкг до 0.1 мг/мл.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты, имевшие ранее аллергические реакции на другие селективные блокаторы $5HT_3$-рецепторов, имеют повышенный риск их развития на фоне применения ондансетрона.

Ондансетрон может замедлять моторику толстого кишечника, в связи с чем его назначение больным с признаками непроходимости кишечника требует регулярного наблюдения.

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

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

Пациентам с нарушением функции почек изменять обычную суточную дозу и частоту введения препарата не требуется.

При нарушениях функции печени

При **умеренном или тяжелом нарушении функции печени** клиренс ондансетрона в значительной степени снижается, при этом увеличивается его $T_{1/2}$, поэтому таким пациентам не рекомендуется назначать ондансетрон в дозе более 8 мг/сут.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста изменения дозировки не требуется.

Применение в детском возрасте

Применяется у детей старше 2 лет.

Противопоказан в детском возрасте до 2 лет.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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