Рондасет



Код АТХ:

- A04AA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- R-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 белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "2".

	1 таб.
R(+)-ондансетрона гидрохлорида дигидрат	2.25 мг,
что соответствует содержанию R(+)-ондансетрона	2 мг

Вспомогательные вещества: крахмал - 5 мг, лактозы моногидрат - 20 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 35.95 мг, кремния диоксид коллоидный - 3 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 5 мг, магния стеарат 0.8 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (15) - пачки картонные.

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "4".

	1 таб.
R(+)-ондансетрона гидрохлорида дигидрат	4.5 мг,
что соответствует содержанию R(+)-ондансетрона	4 мг

Вспомогательные вещества: крахмал - 5 мг, лактозы моногидрат - 20 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 33.70 мг, кремния диоксид коллоидный - 3 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 5 мг, магния стеарат - 0.8 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (15) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ондансетрон является селективным атагонистом 5-HT_3-рецепторов серотонина. Клинические исследования показали, что выделенный R(+) изомер обладает более выраженным фармакологическим действием по сравнению с 5(-)-ондансетроном. Лекарственные средства для цитостатической химиотерапии и радиотерапия могут вызвать повышение концентрации серотонина, который путем активации афферентных волокон блуждающего нерва, содержащих 5-HT_3-рецепторы, вызывает рвотный рефлекс. R(+)-ондансетрон обладает большим сродством к серотониновым 5-HT_3-рецепторам нейронов центральной (рвотный центр) и периферической нервной системы, регулирующих рвотный рефлекс. Не нарушает координации движении, не вызывает седативного эффекта и снижения работоспособности. Не отменяет концентрацию пролактина в плазме.

Фармакокинетика

После приема внутрь ондансетрон полностью абсорбируется в ЖКТ и подвергается эффекту первого прохождения через печень. Биодоступность составляет около 60%. C_{max} в плазме крови достигается через 1.31±0.53 ч и составляет в среднем 22.87±4.05 нг/мл после приема препарата в дозе 4 мг. Биодоступность препарата несколько увеличивается при одновременном приеме с пищей, но не изменяется при приеме антацидов.

Распределение ондансетрона при приеме внутрь, в/в или в/м введении одинаково.

V_d при достижении равновесного состояния составляет около 140 л. Ондансетрон и его метаболиты накапливаются в грудном молоке. Связывание с белками плазмы кровн - 70-76%.

Ондансетрон элиминируется из организма, главным образом, в результате метаболизма в печени при участии нескольких микросомальных изоферментов (CYP1A2, CYP2D6, CYP3A4). Отсутствие изофермента CYP2D6 не оказывает влияния на фармакокинетнку ондансетрона. Менее 5% введенной дозы выводится почками в неизмененном виде. $T_{1/2}$ составляет 3 ч. Фармакокинетические параметры ондансетрона не изменяются при его повторном приеме.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У детей значения клиренса и V_d зависят от возраста. Коррекция дозы с учетом массы тела пациентов (от 0.05 мг/кг до 2 мг максимально) компенсирует эти изменения и нормализует системную экспозицию ондансетрона у детей.

У пациентов с умеренной почечной недостаточностью (клиренс креатинина 15-60 мл/мин) снижены системный клиренс и V_d, что приводит к небольшому и клинически незначимому увеличению $T_{1/2}$ - 5.4 ч.

У пациентов с тяжелым нарушением функции почек, находящееся на гемодиализе, фармакокинетика ондансетрона практически не изменяется.

У пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью значительно снижается клиренс ондансетрона, в результате чего $T_{1/2}$ увеличивается (до 15-32 ч), а биодоступность при пероральном приеме достигает 100% вследствие снижения пресистемного метаболизма.

У лиц пожилого возраста наблюдается небольшое увеличение биодоступности до 65% и $T_{1/2}$ до 5 ч.

Распределение ондансетрона зависит от пола, у женщин наблюдается более высокая абсорбция при приеме внутрь, а также снижение системного клиренса и V_d.

Показания к применению:

— профилактика и купирование тошноты и рвоты, вызванных цитотоксической химио-или радиотерапией;

— профилактика и купирование тошноты и рвоты в послеоперационном периоде (для взрослых).

Относится к болезням:

- Тошнота

Противопоказания:

— детский возраст до 4-х лет (для дозировки 2 мг);

— детский возраст до 12 лет (для дозировки 4 мг);

— беременность;

— период лактации;

— повышенная чувствительность к ондансетрону или к любому другому компоненту препарата.

С *осторожностью*: пациентам с наследственной непереносимостью лактозы, врожденной лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией

Способ применения и дозы:

Препарат предназначен для приема внутрь.

Выбор режима дозирования определяется выраженностью эметогенного действия проводимой противоопухолевой терапии.

Для **взрослых и детей с 12 лет** суточная доза, как правило, составляет 4-12 мг.

Для **детей с 4 до 12 лет** суточная доза составляет 2-6 мг.

Рекомендуются следующие режимы

При *умеренной выраженности эметогенного действия химио- или радиотерапии*:

— **взрослым и детям с 12 лет назначают** 4 мг препарата Рондасет за 1-2 ч до начала проведения основной терапии с последующим приемом еще 4 мг внутрь через 12 ч;

— **детям с 4 до 12 лет** назначают 2 мг препарата Рондасет за 30 мин до начала проведения основной терапии с последующим приемом еще 2 мг внутрь через каждые 8 ч.

Данные по применению при радиотерапии у **детей до 12 лет** отсутствуют.

При *высокой выраженности эметогенного действия химио- или радиотерапии.*

Рекомендуемая доза для **взрослых** (данные по применению у **детей** отсутствуют) составляет 12 мг одновременно с дексаметазоном внутрь в дозе 12 мг за 1-2 ч до начала проведения химиотерапии.

Для *профилактики поздней или длительной рвоты*

Взрослым следует продолжить прием препарата Рондасет внутрь в дозе 4 мг 2 раза/сут в течение 5 дней после окончания основной терапии.

Детям ондансетрон назначается в дозе 5 мг/м^2 поверхности тела в/в в течение не менее 15 мин непосредственно перед началом химиотерапии, с последующим приемом внутрь 2 мг препарата Рондасет через 12 ч; лечение рекомендуется продолжить в дозе 2 мг 2 раза/сут. Внутрь в течение 5 дней.

Предупреждение послеоперационной тошноты и рвоты:

— **взрослым** назначают 8 мг внутрь за 1 ч до начала общей анестезин;

— **детям** для предотвращения и купирования послеоперационной тошноты и рвоты ондансетрон применяется только парентерально.

Пациенты пожилого возраста изменение дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек. Изменять обычную суточную дозу и частоту приема препарата не требуется.

Пациенты с нарушением функции печени. Суточная доза не должна превышать 4 мг/сут.

Пациенты с медленным метаболизмом спартеина дебризохина: коррекции суточной дозы пли частоты приема ондансетрона не требуется.

Побочное действие:

Со стороны иммунной системы: крапивница, бронхоспазм, ларпнгоспазм, ангионевротический отек, реакции повышенной чувствительности немедленного типа, иногда тяжелые, включая анафилаксию.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, судороги, спонтанные двигательные расстройства, включая экстрапирамндные расстройства (дистонические реакции, окулогирный криз, дискинезия), которые носят обратимый характер и не приводят к стойким клиническим последствиям.

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

Со стороны пищеварительной системы: икота, сухость во рту, диарея, запор, бессимптомное преходящее повышение активности печеночных ферментов.

Прочие: ощущение жара и покраснение кожи лица, гипокалиемия, гиперкреатининемия; временное снижение остроты зрения.

Передозировка:

Симптомы: нарушение зрения, запор, снижение артериального давления и вазовагальный эпизод с преходящей AV-блокадой II степени. Во всех случаях явления полностью обратимы

Лечение: проводят симптоматическую и поддерживающую терапию, специфический антидот не известен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан 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 цитохрома Р450 (изоферменты CYP2D6 и CYP3A) - барбитураты, карбамазепин, каризопродол, глутетимид, гризеофульвин, динитрогена оксид, папаверин, феннлбутазон, фенитоин (вероятно и другие гидантоины), рифампицин, толбутамид;

— с ингибиторами цитохрома Р450 (изоферменты 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.

Специальные исследования показали, что ондансетрон не взаимодействует с этанолом, темазепамом, фуросемидом и пропофолом.

Данные специальных исследований указывают на то, что ондансетрон может снижать обезболивающий эффект трамадола.

Особые указания и меры предосторожности:

Т.к. ондансетрон замедляет моторику кишечника, пациенты с симптомами подострой кишечной непроходимости требуют регулярного наблюдения врача. В таблетированной форме ондансетрон нельзя применять для профилактики и лечения послеоперационной тошноты и рвоты у детей после операций.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В случае возникновения побочных реакций со стороны нервной системы пациентам рекомендуется воздержаться от управления автомобилем и другими механизмами, а также занятий видами деятельности, требующими концентрации внимания, напряжения психомоторных функции.

При нарушениях функции почек

Пациенты с нарушением функции почек. Изменять обычную суточную дозу и частоту приема препарата не требуется.

При нарушениях функции печени

Пациенты с нарушением функции печени. Суточная доза не должна превышать 4 мг/сут.

Применение в пожилом возрасте

Пациенты пожилого возраста: изменение дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан:

— детский возраст до 4-х лет (для дозировки 2 мг);

— детский возраст до 12 лет (для дозировки 4 мг).

В таблетированной форме ондансетрон нельзя применять для профилактики и лечения послеоперационной тошноты и рвоты у детей после операций. Детям для предотвращения и купирования послеоперационной тошноты и рвоты ондансетрон применяется только парентерально.

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте. Срок годности - 18 месяцев. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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