ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПРЕПАРАТА
ЭМЕСЕТ® (EMESET)

Регистрационный номер:
Торговое название препарата: Эмесет®
Международное непатентованное название: ондансетрон (ondansetron)
Лекарственные формы: - раствор для внутривенного и внутримышечного введения
- таблетки покрытые пленочной оболочкой

Состав
1 мл раствора содержит:

активное вещество: ондансетрон 2 мг (в виде ондансетрона гидрохлорида дигидрата).
вспомогательные вещества: кислота лимонная безводная, тринатрий цитрат дигидрат, натрия хлорид, вода для инъекций.

1 таблетка покрытая пленочной оболочкой содержит:
активное вещество: ондансетрон 4 мг или 8 мг (в виде ондансетрона гидрохлорида дигидрата).
вспомогательные вещества: микрокристаллическая целлюлоза, крахмал, лактоза, магния стеарат, гипромеллоза, титана диоксид, тальк, пропиленгликоль.

Описание
Раствор: прозрачный бесцветный раствор.
Таблетки по 4 мг: белые или почти белые, круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, с выдавленной цифрой "4" на одной стороне.
Таблетки по 8 мг: белые или почти белые, круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, с выдавленной цифрой "8" на одной стороне и линией разлома на другой.

Фармакотерапевтическая группа - противорвотное средство, антагонист серотониновых рецепторов.
Код АТХ: A04AA01

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Ондансетрон является селективным антагонистом рецепторов $5HT_3$ (серотонина). Лекарственные средства для цитостатической химиотерапии и радиотерапия могут вызвать повышение уровня серотонина, который путем активации вагусных афферентных волокон, содержащих рецепторы 5-HT_3, вызывает рвотный рефлекс. Ондансетрон тормозит появление рвотного рефлекса путем блокады рецепторов 5-HT_3 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 внутримышечном введении пиковая концентрация в плазме достигается в течение 10 минут. Распределение ондансетрона одинаково при внутримышечном и внутривенном введении. После приема внутрь максимальная концентрация ондансетрона в плазме крови достигается примерно через 1,5 ч. Абсолютная биодоступность составляет около 60%. Препарат подвергается метаболизму в печени. Связывание с белками плазмы составляет 70-76%. Почками в неизмененном виде выделяется менее 5% препарата.

Как после приема внутрь, так и при парентеральном введении период полувыведения составляет около 3 ч., у пожилых больных может достигать 5 часов, а при выраженной печеночной недостаточности – 15-20 часов. При поражении почек (почечный клиренс меньше 15 мл/мин) период полувыведения увеличивается на 4-5 часов, 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.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к любому компоненту препарата
- Беременность и период кормления грудью.
- Детский возраст до 2-х лет (безопасность и эффективность применения не изучалась)

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 внутривенно струйно медленно или внутримышечно, непосредственно перед началом терапии;
- 8 мг внутрь за 1-2 часа до начала терапии, затем еще 8 мг внутрь через 12 часов после начала терапии.

При высокоэметогенной химиотерапии:

- 8 мг внутривенно струйно медленно непосредственно перед началом химиотерапии, а затем еще две внутривенные струйные инъекции по 8 мг, каждая из которых осуществляется через 2-4 часа;
- непрерывная 24-часовая инфузия препарата в дозе 24 мг со скоростью 1 мг/час;
- 16-32 мг, разведенные в 50-100 мл соответствующего инфузионного раствора, в виде 15-минутной инфузии, непосредственно перед началом химиотерапии.

Эффективность Эмесета® может быть увеличена путем разового внутривенного введения глюкокортикостероида (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 (возникающей через 24 часов после начала химио- или радиотерапии) рвоты, рекомендуется продолжить применение препарата внутрь в виде таблеток по 8 мг 2 раза в день в течение 5 дней.

Дети

Детям старше 2-х лет препарат назначается в дозе 5 мг/м^2 поверхности тела внутривенно, непосредственно перед началом химиотерапии с последующим приемом внутрь в дозе 4 мг через 12 часов; после окончания химиотерапии рекомендуется продолжать лечение по 4 мг два раза в день внутрь в течение 5 дней.

Предупреждение послеоперационной тошноты и рвоты

Взрослым вводят разовую дозу 4 мг внутримышечно или внутривенно струйно медленно в начале наркоза, или назначают 16 мг внутрь за 1 час до начала наркоза.

Для купирования возникшей тошноты и рвоты рекомендуется внутримышечное или медленное внутривенное введение 4 мг препарата.

Внутримышечно в один и тот же участок тела Эмесет® может быть введен в дозе, не превышающей 4 мг!

Детям для предотвращения послеоперационной тошноты и рвоты Эмесет® применяется исключительно парентерально в разовой дозе 0,1 мг/кг (максимально до 4 мг) в виде медленной внутривенной инъекции до или после анестезии.

Для лечения развившейся послеоперационной тошноты и рвоты у детей рекомендуется медленное внутривенное 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.

Пожилые больные

Изменения дозировки не требуется.

Больные с поражениями почек.

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

При поражении печени в значительной степени уменьшается клиренс Эмесета®, причем увеличивается время полувыведения его из плазмы, поэтому не следует превышать суточную дозу - 8 мг.

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 сердечнососудистой системы: боли в грудной клетке, в ряде случаев с депрессией сегмента ST, аритмии, брадикардия, снижение артериального давления.

Со стороны нервной системы: 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, гипокалиемия.

Передозировка

В случаях предполагаемой передозировки показана симптоматическая терапия.

При передозировке таблетками Эмесет® не рекомендуется применение ипекакуаны, так как маловероятно, что этот препарат будет эффективен в период антиэметического действия ондансетрона.

Специфический антидот не известен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Так как ондансетрон метаболизируется ферментной системой (цитохром P_{450}) печени, требуется осторожность при совместном применении:

- с ферментативными индукторами P450 (CYP2D6 и CYP3A) (барбитураты, карбамазепин, каризопродол, глютетимид, гризеофульвин, закись азота, папаверин, фенилбутазон, фенитоин (вероятно и другие гидантоины), рифампицин, толбутамид);
- с ингибиторами ферментов P450 (CYP2D6 и CYP3A) (аллопуринол, макролидные антибиотики, антидепрессанты – ингибиторы МАО, хлорамфеникол, циметидин, пероральные контрацептивы, содержащие эстрогены, дилтиазем, дисульфирам, вальпроевая кислота, вальпроат натрия, эритромицин, флюконазол, фторхинолоны, изониазид, кетоконазол, ловастатин, метронидазол, омепразол, пропранолол, хинидин, хинин, верапамил).

Особые указания

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

Так как ондансетрон замедляет моторику кишечника, больные с признаками кишечной непроходимости после применения препарата требуют особого 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°С.

Во время проведения инфузии защиты от света не требуется; разведенный инъекционный раствор сохраняет свою стабильность как минимум в течение 24 часов при естественном свете или нормальном освещении.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 2 мг/мл.

По 4 мг/2 мл и 8 мг/4 мл в ампулах с точкой и линией надлома. По 5 ампул в пластиковом поддоне вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Таблетки покрытые пленочной оболочкой по 4 мг и 8 мг. По 6 таблеток в стрипе из АЛ/АЛ. По 1 стрипу вместе с инструкцией по применению в картонной пачке. По 10 пачек в картонной коробке.

Условия хранения

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, хранить при температуре не выше 25°С в защищенном от света месте.

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения хранить при температуре не выше 30°С в защищенном от света месте. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
Раствор для внутривенного и внутримышечного введения – 3 года.
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой – 3 года.
Препарат не следует использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
По рецепту.

Производитель
«Ципла Лимитед», Индия
Зарегистрированный офис
Мумбаи Централ, Мумбаи 400 008, Индия

Претензии потребителей направлять по адресу:
117105, г. Москва, Нагорный проезд, 12В
Тел/факс: (495) 502-90-01; 514-18-11

И.о. директора ИДКЭЛС А.Н. Васильев

Представитель компании
«Ципла Лимитед» С.В.Журавлева