МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ЭМЕТРОН®

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер:

Торговое название: ЭМЕТРОН®

Международное непатентованное название: ондансетрон (ondansetron)

Лекарственная форма: таблетки покрытые пленочной оболочкой

1 таблетка содержит:

вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный - 0,60 мг, магния стеарат - 1,30 мг, тальк - 7,10 мг, крахмал прежелатинизированный - 18,00 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 40,00 мг, крахмал кукурузный - 54,50 мг, лактозы моногидрат - 118,50 мг;

состав оболочки: кремния диоксид коллоидный - 0,07 мг, краситель железа оксид желтый 0,12 мг, титана диоксид - 0,27 мг, макрогол 6000 - 0,79 мг, сепифильм 003 - 8,75

(Макрогола-40 стеарат (моно и диэфиры стеариновой кислоты и ПЭГ-40) (Е431) - 8,00 – 12,00 %, целлюлоза микрокристаллическая (Е460) - 35,00 – 45,00 %, гипромеллоза (Е464) - 45,00 – 55,00 %).

Описание

Таблетки покрытые пленочной оболочкой, 8 мг: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, желтого цвета, с гравировкой “8” на одной стороне и “RG” - на другой. На поперечном разрезе видны два слоя, цвет внутреннего слоя белый или почти белый.

Фармакотерапевтическая группа: Противорвотное средство, серотониновых рецепторов антагонист.

Код АТХ: A04AA01

56189

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Ондансетрон является селективным антагонистом $5HT_3$ - рецепторов (серотонина). Лекарственные средства для цитостатической химиотерапии и радиотерапия могут вызвать повышение концентрация серотонина, который путем активации афферентных волокон блуждающего нерва, содержащих рецепторы $5\text{-}HT_3$, вызывает рвотный рефлекс. Селективно блокирует серотониновые $5\text{-}HT_3$ – рецепторы нейронов центральной (рвотный центр) и периферической (желудочно-кишечный тракт) нервной системы, регулирующих рвотный рефлекс. Не нарушает координации движений, не вызывает седативного эффекта и снижения работоспособности. Не изменяет концентрацию пролактина в плазме.

Фармакокинетика

После приема внутрь ондансетрон полностью абсорбируется в желудочно-кишечном тракте и подвергается эффекту «первого прохождения» через печень. Максимальная концентрация ондансетрона в плазме крови достигается примерно через 1,5 после приема внутрь и составляет приблизительно 30 нг/мл после приема препарата в дозе 8 мг. Абсолютная биодоступность составляет около 60%. Биодоступность ондансетрона несколько увеличивается при одновременном приеме с пищей, но не изменяется при приеме антацидов. Связывание с белками плазмы крови составляет 70-76%. С почками в неизмененном виде выводится менее 5% ондансетрона.

Распределение ондансетрона при приеме внутрь, внутривенном или внутримышечном введении одинаково. Объем распределения при достижении равновесного состояния составляет около 140 л. Связывание с белками плазмы крови - 70-76%.

Ондансетрон элиминируется из организма, главным образом, в результате метаболизма в печени при участии нескольких микросомальных изоферментов (CYP1A2, CYP2D6, CYP3A4). Отсутсвие изофермента CYP2D6 не оказывает влияния на фармакокинетику ондансетрона. Менее 5% введенной дозы выводится почками в неизмененном виде.

Как после приема внутрь, так и при парентеральном введении период полувыведения составляет около 3 ч. Фармакокинетические параметры ондансетрона не изменяются при его повторном приеме.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У детей значения клиренса и объема распределения зависят от возраста. Коррекция дозы с учетом массы тела пациентов (от 0,1 мг/кг до 4 мг максимально) компенсирует эти изменения и нормализует системную экспозицию ондансетрона у детей.

56189

У пациентов с умеренной почечной недостаточностью (клиренс креатинина 15-60 мл/мин) снижены системный клиренс и объем распределения, что приводит к небольшому и клинически незначимому увеличению периода полувыведения ($T_{1/2}$ – 5,4 ч).

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

У пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью значительно снижается клиренс ондансетрона, в результате чего период полувыведения увеличивается (до 15-32 ч), а биодоступность при пероральном приеме достигает 100 % вследствие снижения пресистемного метаболизма.

У пожилых пациентов наблюдается небольшое увеличение биодоступности до 65 % и периода полувыведения до 5 ч.

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

Показания к применению

- Профилактика и купирование тошноты и рвоты, вызванных цитотоксической химио- или радиотерапией.
- Профилактика и купирование тошноты и рвоты в послеоперационном периоде.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к любому компоненту препарата.
- Беременность и период кормления грудью.
- Детский возраст до 12 лет (для дозировки 8 мг).

С осторожностью

Пациентам с наследственной непереносимостью лактозы, врожденной лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

Способ применения и дозы

Цитостатическая терапия

Выбор режима дозирования определяется выраженностью эметогенного действия проводимой противоопухолевой терапии.

Для взрослых и детей старше 12 лет суточная доза, как правило, составляет

8 - 24 мг, рекомендуются следующие режимы:

При умеренной выраженности эметогенного действия химиотерапии или радиотерапии:

- 8 мг внутрь за 1-2 ч до начала терапии, затем еще 8 мг внутрь через 12 ч после начала

терапии.

При высокой выраженности эметогенного действия химиотерапии или радиотерапии:

Рекомендуемая доза для взрослых (данные по применению у детей отсутствуют) составляет 24 мг одновременно с дексаметазоном внутрь в дозе 12 мг за 1-2 ч до начала проведения 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.

Предупреждение послеоперационной тошноты и рвоты

- *взрослым* назначают 16 мг внутрь за 1 час до начала общей анестезии;
- *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 8 мг в сутки.

Пациенты с медленным метаболизмом спартеина/ дебризохина

Коррекции суточной дозы или частоты приема ондансетрона не требуется.

Побочное действие

Со стороны иммунной системы: крапивница, бронхоспазм, ларингоспазм, ангионевротический отек, реакции гиперчувствительности немедленного типа, иногда тяжелые, включая анафилаксию.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, судороги, спонтанные двигательные расстройства, включая экстрапирамидные 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 артериального давления.

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 атриовентикулярной блокадой II степени. Во всех случаях явления полностью обратимы.

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Так как 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, фенилбутазон, фенитоин (вероятно и другие гидантоины), рифампицин, толбутамид;
- с ингибиторами цитохрома Р450 (изоферменты CYP2D6 и CYP3A) (аллопуринол, макролидные антибиотики, антидепрессанты - ингибиторы МАО, хлорамфеникол, циметидин, пероральные контрацептивы, содержащие эстрогены, дилтиазем, дисульфирам, вальпроевая кислота, вальпроат семинатрия, эритромицин, флуконазол, фторхинолоны, изониазид, кетоконазол, ловастатин, метронидазол, омепразол, пропранолол, хинидин, хинин, верапамил).
- не вступает во взаимодействие с алкоголем, темазепамом, фуросемидом, трамадолом и пропофолом.

Особые указания и меры предосторожности при применении препарата

Ондансетрон не следует назначать детям с площадью поверхностей тела менее 0,6 $м^2$. Ондансетрон нельзя применять для профилактики и лечения послеоперационной тошноты и рвоты у детей после операции на органах брюшной полости. У пациентов, у которых ранее при применении других селективных антагонистов $5HT_3$-рецепторов, наблюдались реакции повышенной чувствительности, при применении ондансетрона также могут развиться аналогичные реакции. Так как ондансетрон замедляет моторику кишечника, пациенты с признаками непроходимости кишечника после применения препарата требуют регулярного наблюдения врача.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и работе с техникой

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 функций.

Форма выпуска

Таблетки покрытые пленочной оболочкой, 8 мг: 10 таблеток в блистере из ПВХ и фольги алюминиевой. 1 блистер в картонной пачке с инструкцией по применению.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Препарат отпускается по рецепту.

Производитель

ОАО «Гедеон Рихтер»

1103 Будапешт, ул. Дёмрёи, 19-21, Венгрия

Претензии потребителей направлять по адресу:

Московское Представительство ОАО «Гедеон Рихтер»

119049 г. Москва, 4-й Добрынинский пер., дом 8,

Тел.:(495) 363–3950, Факс:(495) 363–3949

Заместитель Директора Представительства
ОАО «Гедеон Рихтер» (Венгрия) Москва Беда М.В.

Представительство ОАО "Гедеон Рихтер" (Венгрия) * Рег. № 84692 * RG ДЛЯ ДОКУМЕНТОВ I * МОСКВА *

МЗСР РФ ФГБУ НЦЭСМП ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 0 0 0 0 0 0 0 0 0 9

56189