ЛП-№(007282)-(РГ-RU) от 14.04.2026

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Апрепитант-29Ф, 80 мг и 125 мг, набор капсул.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: апрепитант.

Апрепитант-29Ф, 80 мг, капсулы

Каждая капсула содержит 80 мг апрепитанта.

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: фруктоза, натрий (см. раздел 4.4).

Апрепитант-29Ф, 125 мг, капсулы

Каждая капсула содержит 125 мг апрепитанта.

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: фруктоза, натрий (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Набор капсул.

Апрепитант-29Ф, 80 мг, капсулы

Капсулы твердые № 2 цилиндрической формы с непрозрачной крышечкой белого цвета и непрозрачным корпусом белого цвета. Содержимое капсул – порошок белого или почти белого цвета.

Апрепитант-29Ф, 125 мг, капсулы

Капсулы твердые № 1 цилиндрической формы с непрозрачной крышечкой розового цвета и непрозрачным корпусом белого цвета. Содержимое капсул – порошок белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Апрепитант-29Ф показан к применению у взрослых в комбинации с другими противорвотными препаратами для предупреждения острой и отсроченной тошноты и рвоты, вызываемых высоко- или умеренно эметогенными противоопухолевыми препаратами.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Препарат Апрепитант-29Ф принимают в течение 3 дней в комбинации с глюкокортикостероидами и антагонистами 5-НТ3 рецепторов. Перед началом лечения следует

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

ознакомиться с инструкцией по применению антагониста 5-НТз рецепторов, назначаемого одновременно с препаратом Апрепитант-29Ф.

Рекомендуемая доза препарата при трехдневном режиме составляет 125 мг внутрь за 1 час до приема химиотерапевтических препаратов в 1-й день и 80 мг один раз в день утром во 2-й и 3-й дни.

Ниже в таблицах приводится схема приема препаратов в зависимости от степени эметогенности противоопухолевой терапии.

Высокоэметогенная химиотерапия:

Лекарственный препарат	**День 1**	**День 2**	**День 3**	**День 4**
Апрепитант-29Ф	125 мг внутрь за 1 час до начала химиотерапии	80 мг внутрь (утром)	80 мг внутрь (утром)	—
Дексаметазон	12 мг внутрь за 30 мин до начала химиотерапии	8 мг внутрь (утром)	8 мг внутрь (утром)	8 мг внутрь (утром)
Антагонисты 5-НТз рецепторов	См. инструкцию по применению антагонистов 5-НТз рецепторов	—	—	—

Умеренно эметогенная химиотерапия:

Лекарственный препарат	**День 1**	**День 2**	**День 3**
Апрепитант-29Ф	125 мг внутрь за 1 час до начала химиотерапии	80 мг внутрь (утром)	80 мг внутрь (утром)
Дексаметазон	12 мг внутрь за 30 мин до начала химиотерапии	—	—
Антагонисты 5-НТз рецепторов	См. инструкцию по применению антагонистов 5-НТз рецепторов	—	—

Особые группы пациентов

Коррекции дозы у пожилых пациентов или в зависимости от пола, расовой принадлежности, индекса массы тела не требуется.

Лица пожилого возраста

Коррекции дозы у пожилых пациентов в возрасте 65 лет и старше не требуется.

Пациенты с почечной недостаточностью

Не требуется коррекции доз у пациентов с тяжелой степенью почечной недостаточности (клиренс креатинина <30 мл/мин), а также у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Не требуется коррекции доз у пациентов с легкой или средней степенью печеночной недостаточности (от 5 до 9 баллов по шкале Чайлд-Пью).

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

Клинические данные по применению препарата у пациентов с тяжелой степенью печеночной недостаточности (>9 баллов по шкале Чайлд-Пью) отсутствуют.

Дети

Безопасность и эффективность применения препарата Апрепитант-29Ф у детей от 0 до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Капсулы препарата принимают вне зависимости от приема пищи. Капсулы следует проглатывать целиком.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к апрепитанту или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- одновременное применение с пимозидом, терфенадином, астемизолом и цизапридом.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Препарат Апрепитант-29Ф следует применять с осторожностью у пациентов, одновременно получающих лекарственные препараты, которые метаболизируются главным образом через изофермент CYP3A4 и имеют узкий терапевтический диапазон, такие как циклоспорин, такролимус, сиролимус, эверолимус, алфентанил, производные алкалоидов спорыньи, фентанил и хинидин (см. раздел 4.5.).

Также совместное применение с иринотеканом должно быть проведено с особой осторожностью ввиду возможного увеличения токсичности.

Одновременное применение препарата Апрепитант-29Ф с варфарином может привести к клинически значимому снижению международного нормализованного отношения (МНО) протромбинового времени. У пациентов, получающих длительную терапию варфарином, следует тщательно контролировать МНО во время лечения препаратом Апрепитант-29Ф и в течение 14 дней, в особенности через 7-10 дней, после начала 3-х дневной схемы препарата Апрепитант-29Ф при каждом цикле химиотерапии.

Эффективность гормональных контрацептивов может снизиться во время и в течение 28 дней после лечения препаратом Апрепитант-29Ф. Во время лечения препаратом и в течение 2 месяцев после приема последней дозы препарата Апрепитант-29Ф следует использовать альтернативные методы контрацепции.

Вспомогательные вещества

Фруктоза

Препарат Апрепитант-29Ф содержит 72, 33 мг фруктозы в каждой капсуле с дозировкой 80,0 мг и 115, 00 мг фруктозы в каждой капсуле с дозировкой 125,00 мг.

Натрий

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на одну капсулу, то есть, по сути, не содержит натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Апрепитант является субстратом, умеренным ингибитором и индуктором изофермента CYP3A4. Апрепитант также является индуктором изофермента CYP2C9.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

Влияние апрепитанта на фармакокинетику других лекарственных препаратов

При одновременном применении апрепитант, как умеренный ингибитор изофермента CYP3A4, может повышать концентрацию в плазме пероральных лекарственных препаратов, метаболизм которых происходит под действием изофермента CYP3A4. В меньшей мере апрепитант может повышать концентрацию в плазме принимаемых одновременно внутривенных лекарственных препаратов, метаболизм которых происходит под действием изофермента CYP3A4.

Препарат Апрепитант-29Ф не следует применять одновременно с пимозидом, терфенадином, астемизолом и цизапридом. Ингибирование изофермента CYP3A4 апрепитантом может привести к повышению концентрации этих препаратов в плазме и к потенциально серьезным и опасным для жизни явлениям.

Препарат Апрепитант-29Ф необходимо применять с осторожностью пациентам, получающим сопутствующую терапию препаратами, метаболизирующимися главным образом через изофермент CYP3A4 и имеющими узкий терапевтический диапазон, такими как циклоспорин, такролимус, сиролимус, эверолимус, алфентанил, диэрготамин, эрготамин, фентанил и хинидин (см. раздел 4.4).

Апрепитант индуцирует метаболизм варфарина и толбутамида. Одновременное применение апрепитанта с этими или другими препаратами, которые метаболизируются изоферментом CYP2C9 (например, фенитоин), может привести к снижению их концентрации в плазме. Не отмечено влияния апрепитанта на площадь под кривой «концентрация – время» R (+)- или S (-)- варфарина, однако при совместном применении наблюдалось снижение минимальной концентрации S(-)-варфарина, которое сопровождалось снижением МНО на 14 % через 5 дней после окончания приема апрепитанта. У пациентов, получающих терапию варфарином в течение длительного периода времени, следует тщательно мониторировать МНО в течение 2 недель, и особенно на 7-10 дни после начала приема препарата по 3-дневной схеме, во время каждого цикла химиотерапии. Апрепитант уменьшает площадь под кривой «концентрация – время» толбутамида, являющегося субстратом изофермента CYP2C9, на 23 % в 4 день, на 28 % в 8 день и на 15 % в 15 день. При этом толбутамид в однократной дозе 500 мг принимался перед началом 3-х дневной схемы терапии апрепитантом в день 4, 8 и 15.

Антагонисты 5-НТ3

Взаимодействие апрепитанта с препаратами, являющимися субстратами переносчика Р-гликопротеина, маловероятно вследствие отсутствия взаимодействия апрепитанта с дигоксином. Апрепитант не оказывает клинически значимого влияния на фармакокинетику антагонистов 5-НТ3 рецепторов: ондансетрона, гранисетрона и гидродоласетрона (активного метаболита доласетрона).

Глюкокортикостероиды

При одновременном приеме апрепитанта и глюкокортикостероидов отмечено увеличение площади под кривой «концентрация – время» для дексаметазона, принимаемого внутрь, в 2,2 раза, для метилпреднизолона, вводимого внутривенно, в 1,3 раза и метилпреднизолона, принимаемого внутрь, в 2,5 раза. В связи с этим для достижения необходимого эффекта стандартную дозу дексаметазона при применении его внутрь в комбинации с апрепитантом снижают на 50 %, дозу метилпреднизолона при введении внутривенно снижают приблизительно на 25 %, при применении внутрь - на 50 %.

Химиотерапевтические препараты

При применении апрепитанта вместе с химиотерапевтическими препаратами, метаболизм которых главным образом или частично происходит при участии изофермента CYP3A4 (этопозид, винорелбин, доцетаксел, ифосфамид, циклофосфамид, иринотекан и паклитаксел), дозы этих препаратов можно не корректировать. Однако рекомендуется соблюдать

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

осторожность в отношении пациентов, получающих данные препараты, и вести за ними дополнительное наблюдение. В пострегистрационных исследованиях были зафиксированы случаи нейротоксичности, которые могут рассматриваться как возможное побочное действие ифосфамида, применяемого совместно с апрепитантом.

Доцетаксел

В отдельном исследовании фармакокинетики при пероральном приеме апрепитанта (схема применения 125 мг/80 мг) какого-либо влияния на фармакокинетику доцетаксела отмечено не было.

Винорелбин

В отдельном исследовании фармакокинетики при пероральном приеме апрепитанта (схема применения 125 мг/80 мг) какого-либо влияния на фармакокинетику винорелбина отмечено не было.

Пероральные контрацептивы

Эффективность гормональных контрацептивов в период приема и в течение 28 дней после окончания приема апрепитанта может быть снижена. Во время лечения препаратом и в течение 2 месяцев после приема последней дозы препарата следует применять альтернативные или резервные методы контрацепции.

Мидазолам

При одновременном пероральном приеме мидазолама и апрепитанта отмечено увеличение площади под кривой «концентрация – время» мидазолама. Потенциальный эффект повышения концентрации в плазме мидазолама или других бензодиазепинов, метаболизм которых осуществляется через изофермент CYP3A4 (алпразолам, триазолам), следует принимать во внимание при одновременном назначении этих лекарственных препаратов с апрепитантом.

Влияние других лекарственных препаратов на фармакокинетику апрепитанта

Одновременный прием апрепитанта с препаратами, которые ингибируют активность изофермента CYP3A4, может привести к увеличению концентрации апрепитанта в плазме. Следовательно, необходимо с осторожностью назначать апрепитант в комбинации с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 (например, кетоконазолом). Однако одновременный прием апрепитанта с умеренными ингибиторами изофермента CYP3A4 (например, дилтиаземом, итраконазолом, вориконазолом, позаконазолом, кларитромицином, телитромицином и ингибиторами протеазы) не вызывает клинически значимых изменений концентрации апрепитанта в плазме.

Одновременный прием апрепитанта с препаратами, которые являются сильными индукторами изофермента CYP3A4 (например, рифампицином, фенитоином, карбамазепином, фенобарбиталом), может привести к уменьшению концентрации апрепитанта в плазме и, таким образом, к снижению его эффективности. Также одновременное применение апрепитанта с препаратами зверобоя продырявленного не рекомендуется.

У пациентов с артериальной гипертензией легкой и средней степени прием таблетки апрепитанта, содержащей дозу, сопоставимую с 230 мг препарата в капсулах, в комбинации с дилтиаземом в дозе 120 мг 3 раза в день в течение 5 дней приводил к увеличению площади под кривой «концентрация – время» апрепитанта в 2 раза и одновременному увеличению площади под кривой «концентрация – время» дилтиазема в 1,7 раза. Эти фармакокинетические эффекты не приводили к клинически значимым изменениям ЭКГ, частоты сердечных сокращений или артериального давления по сравнению с изменениями данных показателей при приеме только дилтиазема.

Одновременный прием апрепитанта 1 раз в сутки в форме таблетки в дозе, сопоставимой с

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

85 мг или 170 мг препарата в капсулах, и пароксетина в дозе 20 мг раз в день приводил к уменьшению площади под кривой «концентрация – время» приблизительно на 25 % и C_{max} приблизительно на 20 % как для апрепитанта, так и для пароксетина.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Контрацепция у мужчин и женщин

Эффективность гормональных контрацептивов в период приема и в течение 28 дней после окончания приема апрепитанта может быть снижена. Во время лечения препаратом и в течение 2 месяцев после приема последней дозы препарата следует применять альтернативные или резервные методы контрацепции.

Беременность

Хорошо контролируемых исследований у беременных женщин не проводилось. Препарат не рекомендуется применять во время беременности.

Лактация

Несмотря на то, что данных о проникновении апрепитанта в грудное молоко у кормящих женщин нет, следует принять решение о прекращении грудного вскармливания или отмене препарата в связи с возможным нежелательным действием апрепитанта на грудных детей.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Исследований по изучению влияния препарата Апрепитант-29Ф на способность управлять

транспортными средствами или работать с механизмами не проводилось. Следует принимать во внимание потенциальную возможность развития таких нежелательных реакций (НР), как головокружение, сонливость, заторможенность и расстройство зрения. При появлении описанных НР следует воздержаться от выполнения указанных видов деятельности.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Безопасность апрепитанта оценивалась приблизительно у 6500 пациентов.

Профилактика тошноты и рвоты, вызванных химиотерапией

Высокоэметогенная терапия

В клиническом исследовании принимали участие 544 пациента, получавших высокоэметогенную терапию и апрепитант в первом цикле. 413 пациентов из данной группы продолжили терапию (максимальное число курсов химиотерапии – 6). Трехдневный режим приема апрепитанта в комбинации с ондансетроном и дексаметазоном хорошо переносился пациентами. Большинство НР, зафиксированных в клинических исследованиях, были определены как реакции легкой и средней степени тяжести.

Наиболее часто встречаемыми НР на фоне высокоэметогенной химиотерапии у пациентов, получавших апрепитант в комбинации с антагонистами 5-НТз рецепторов и дексаметазоном, и наблюдаемыми с большей частотой, чем при терапии антагонистами 5-НТз рецепторов и дексаметазоном были: икота (4,6 %), повышение активности аланинаминотрансферазы (2,8 %), диспепсия (2,6 %), запор (2,4 %), головная боль (2,0 %) и снижение аппетита (2,0 %).

В дополнительном клиническом исследовании у 1169 пациентов, получавших различные виды высокоэметогенной химиотерапии и режимы профилактики тошноты и рвоты с применением апрепитанта и антагонистов 5-НТз рецепторов и дексаметазона либо только антагонистов

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

5-НТз рецепторов и дексаметазона, профиль НР был одинаковым.

Умеренно эметогенная терапия

В клиническом исследовании с участием 868 пациентов наиболее часто встречаемой НР на фоне умеренно эметогенной химиотерапии у пациентов, получавших апрепитант в комбинации с антагонистами 5-НТз рецепторов и дексаметазоном, и отмечаемым с большей частотой, чем при терапии антагонистами 5-НТз рецепторов и дексаметазоном, была утомляемость (1,4 %).

Резюме нежелательных реакций

В объединенном анализе исследований высокоэметогенной и умеренно эметогенной химиотерапии у пациентов, получавших лечение апрепитантом в трехдневном режиме, наблюдались следующие, связанные с приемом препарата НР, причем с большей частотой, чем при стандартной терапии.

Для оценки частоты встречаемости НР использованы следующие критерии: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, но <1/10), нечасто (≥1/1 000, но <1/100), редко (≥1/10 000, но <1/1 000), очень редко (<1/10 000), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Инфекции и инвазии

Редко: кандидоз, стафилококковая инфекция.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Нечасто: анемия, фебрильная нейтропения.

Нарушения метаболизма и питания

Часто: снижение аппетита.

Редко: полидипсия.

Психические нарушения

Нечасто: тревожность.

Редко: дезориентация, эйфория.

Нарушения со стороны нервной системы

Нечасто: головокружение, сонливость.

Редко: когнитивные нарушения, заторможенность, извращение вкуса.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: конъюнктивит.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Редко: шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца

Нечасто: учащенное сердцебиение.

Редко: брадикардия, сердечно-сосудистые нарушения.

Нарушения со стороны сосудов

Нечасто: приступообразные ощущения жара («приливы»).

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Часто: икота.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

Редко: боль в горле, чиханье, кашель, постназальный синдром, раздражение глотки.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: диспепсия.

Нечасто: отрыжка, тошнота, гастроэзофагеальный рефлюкс, рвота, боль в животе, сухость во рту, метеоризм.

Редко: твердый кал, перфоративная язва двенадцатиперстной кишки, нейтропенический колит, стоматит, вздутие живота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: сыпь, акне.

Редко: фотосенсибилизация, повышенная потливость, себорея, повышение жирности кожи, зудящая сыпь.

Нарушения со стороны мышечной, костной и соединительной ткани

Редко: мышечные спазмы, мышечная слабость.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Нечасто: дизурия.

Редко: поллакиурия.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Часто: утомляемость.

Нечасто: астения, недомогание.

Редко: отеки, ощущение дискомфорта в области грудной клетки, нарушение походки.

Лабораторные и инструментальные данные

Часто: повышение активности аланинаминотрансферазы.

Нечасто: повышение активности аспартатаминотрансферазы, повышение активности щелочной фосфатазы.

Редко: увеличение диуреза, эритроцитурия, гипонатриемия, снижение массы тела, глюкозурия, нейтропения.

Профиль НР у пациентов, получающих высокоэметогенную и умеренно эметогенную химиотерапию, при проведении повторных курсов (максимальное число курсов – 6) с применением апрепитанта был сопоставим с таковым во время 1-ого цикла химиотерапии.

Данные пострегистрационных исследований

В пострегистрационный период было сообщено о НР, приведенных ниже. Вследствие того, что отчеты поступали от добровольцев из групп населения с неопределенной численностью, невозможно достоверно определить ожидаемую частоту или причинную связь с приемом препарата.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: реакции гиперчувствительности, включая анафилактические реакции.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Редко: синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Частота неизвестна: зуд, сыпь, крапивница.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых НР после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых НР лекарственного препарата через национальные системы сообщения о НР государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы

Имеющиеся данные по применению высоких доз апрепитанта без химиотерапии (однократно до 600 мг или по 375 мг ежедневно в течение 42 дней) свидетельствуют о хорошей переносимости препарата. Сообщалось о возникновении сонливости и головной боли у одного пациента, принявшего 1440 мг апрепитанта.

Лечение

В случае передозировки дальнейшую терапию препаратом следует прекратить, за пациентом следует установить тщательное наблюдение. Антидот к препарату не известен. При необходимости проводят симптоматическое лечение. В связи с противорвотным действием апрепитанта лекарственные препараты, вызывающие рвоту, скорее всего, будут неэффективны. Гемодиализ неэффективен.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: противорвотные средства; другие противорвотные средства.

Код АТХ: A04AD12.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Апрепитант – это селективный высокоаффинный антагонист рецепторов нейрокинина 1 (NK1) субстанции Р. Избирательность связывания апрепитанта с NK1 рецепторами по крайней мере в 3000 раз выше, чем для других ферментов, переносчиков ионных каналов и участков рецепторов, включая дофаминовые и серотониновые рецепторы, которые являются мишенями существующих в настоящее время препаратов, применяющихся для лечения тошноты и рвоты, связанных с химиотерапией.

В доклинических исследованиях было показано, что антагонисты NK1 рецепторов предупреждают развитие рвоты, вызванной химиотерапевтическими препаратами (например, цисплатином), за счет центрального механизма действия. Апрепитант проникает в головной мозг и связывается с мозговыми NK1 рецепторами. Обладая длительным центральным действием, апрепитант ингибирует как острую, так и отсроченную фазы рвоты, вызванной

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

цисплатином, а также усиливает при этом противорвотное действие ондансетрона и дексаметазона.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Средняя абсолютная биодоступность при пероральном приеме апрепитанта составляет приблизительно 60-65 %, а средняя максимальная концентрация апрепитанта в плазме (C_{max}) наблюдается приблизительно через 4 часа (T_{max}) после приема препарата. Прием капсулы одновременно с приемом пищи не оказывает клинически значимого влияния на биодоступность апрепитанта.

Фармакокинетика апрепитанта в диапазоне клинических доз является нелинейной.

После перорального приема препарата в дозе 125 мг в 1-й день и затем в дозе 80 мг в сутки во 2-ой и 3-й дни площадь под кривой «концентрация – время» на протяжении 24 часов составляла приблизительно 19,5 мкг × час/мл в 1-й день и 20,1 мкг × час/мл на 3-й день. C_{max} составила 1,5 мкг/мл и 1,4 мкг/мл в 1-й и 3-й дни соответственно и достигалась приблизительно через 4 часа (T_{max}) после приема препарата.

Распределение

Апрепитант связывается с белками плазмы более чем на 95 %. Равновесный объем распределения (среднее геометрическое Vd_{ss}) у человека составляет приблизительно 66 л. Апрепитант проникает через плаценту у крыс и гематоэнцефалический барьер у крыс и хорьков.

У человека апрепитант проникает через гематоэнцефалический барьер.

Биотрансформация

Апрепитант подвергается интенсивному метаболизму в печени посредством окисления в морфолиновом кольце и его боковых цепях в основном под действием изофермента CYP3A4, и лишь небольшая часть препарата метаболизируется через изоферменты CYP1A2 и CYP2C19 (CYP2D6, CYP2C9 или CYP2E1 в метаболизме апрепитанта не участвуют).

Элиминация

Апрепитант элиминируется главным образом в виде метаболитов через кишечник (86 %) и почками (5 %). Кажущийся плазменный клиренс апрепитанта составляет приблизительно от 60 до 84 мл/мин. Кажущийся конечный период полувыведения составляет приблизительно от 9 до 13 часов.

Особые группы пациентов

Пол

Коррекции доз препарата в зависимости от пола не требуется. После однократного перорального приема препарата площадь под кривой «концентрация – время» (AUC_{0-24}) и C_{max} препарата у женщин были на 9 % и 17 % соответственно выше, чем у мужчин. Период полувыведения ($T_{1/2}$) апрепитанта у женщин был приблизительно на 25 % меньше, чем у мужчин, а значимых различий во времени достижения максимальной концентрации (T_{max}) между женщинами и мужчинами не отмечалось. Данные различия в фармакокинетике препарата признаны клинически незначимыми.

Раса

Коррекции дозы препарата в зависимости от расы не требуется.

Индекс массы тела

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

Не влияет на фармакокинетику апрепитанта.

Почечная недостаточность

Коррекции дозы у пациентов с тяжелой степенью почечной недостаточности и пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе, не требуется.

Пациенты с тяжелой степенью почечной недостаточности (клиренс креатинина <30 мл/мин) и пациенты с терминальной стадией почечной недостаточности, нуждающиеся в гемодиализе, получали препарат однократно в дозе 240 мг.

У пациентов с тяжелой степенью почечной недостаточности площадь под кривой «концентрация – время» для суммарного апрепитанта (как связанного, так и не связанного с белками) была снижена на 21 %, а C_{max} была снижена на 32 % по сравнению со здоровыми добровольцами.

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе, площадь под кривой «концентрация – время» для суммарного апрепитанта была снижена на 42 %, а C_{max} - на 32 %. В связи с небольшим снижением связывания апрепитанта с белками у пациентов с почечной недостаточностью площадь под кривой «концентрация – время» фармакологически активного несвязанного апрепитанта у таких пациентов достоверно не отличалась от таковой у здоровых лиц. Гемодиализ, проведенный через 4 и 48 часов после приема препарата, не оказывал значимого влияния на фармакокинетику апрепитанта. В диализате обнаруживалось менее 0,2 % дозы препарата.

Печеночная недостаточность

Коррекции доз препарата у пациентов с легкой и средней степенью печеночной недостаточности не требуется. У пациентов с легкой степенью печеночной недостаточности (5-6 баллов по шкале Чайлд-Пью) после приема разовой дозы 125 мг препарата в 1-й день и 80 мг в день во 2-й и 3-й дни площадь под кривой «концентрация – время» на протяжении 24-часов была на 11% меньше в 1-й день и на 36 % ниже на 3-й день, чем у здоровых добровольцев, получивших те же дозы препарата. У пациентов со средней степенью печеночной недостаточности (7-9 баллов по шкале Чайлд- Пью) площадь под кривой «концентрация – время» апрепитанта на протяжении 24-часов была на 10 % больше в 1-й день и на 18 % больше на 3-й день, чем у здоровых добровольцев, получивших те же дозы. Данные различия не признаны клинически значимыми.

Опыта применения препарата у пациентов с тяжелой степенью печеночной недостаточности (>9 баллов по шкале Чайлд-Пью) нет.

Лица пожилого возраста

Коррекции дозы препарата у пожилых пациентов не требуется. После перорального приема разовой дозы 125 мг препарата в 1-й день и 80 мг 1 раз в день во 2-й и 5-й дни площадь под кривой «концентрация – время» на протяжении 24 часов у пожилых лиц (>65 лет) была на 21 % больше в 1-й день и на 36 % больше на 5-й день, чем у лиц младше 65 лет. C_{max} при этом была на 10 % выше в 1–й день и на 24 % выше на 5-й день. Данные различия не являлись клинически значимыми.

Дети

Фармакокинетика апрепитанта у пациентов в возрасте младше 18 лет не изучалась.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Апрепитант-29Ф, 80 мг, капсулы

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

Содержимое капсулы:

- фруктоза;
- целлюлоза микрокристаллическая (102);
- гипролоза (гидроксипропилцеллюлоза);
- кроскармеллоза натрия;
- натрия стеарилфумарат;
- натрия лаурилсульфат;

Корпус/крышечка:

- пуллулан;
- гелановая камедь (Е418);
- калия хлорид;
- вода;
- цинка оксид.

Апрепитант-29Ф, 125 мг, капсулы

Содержимое капсулы:

- фруктоза;
- целлюлоза микрокристаллическая (102);
- гипролоза (гидроксипропилцеллюлоза);
- кроскармеллоза натрия;
- натрия стеарилфумарат;
- натрия лаурилсульфат.

Корпус:

- пуллулан;
- гелановая камедь (Е418);
- калия хлорид;
- вода;
- цинка оксид;

Крышечка:

- пуллулан;
- гелановая камедь (Е418);
- калия хлорид;
- вода;
- кармин (Е120);
- цинка оксид.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

1 капсула 125 мг в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

2 капсулы по 80 мг в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1 контурная ячейковая упаковка, содержащая 1 капсулу 125 мг, и 1 контурная ячейковая упаковка, содержащая 2 капсулы по 80 мг каждая, вместе с листком-вкладышем в пачке из картона для потребительской тары подгрупп хромовый или хром-эрзац.

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ООО «29 февраля»

192148, г. Санкт-Петербург, проспект Железнодорожный, д. 40, лит. Д, помещ. 5-Н

тел. +7 (812) 703-06-84

адрес электронной почты: product@29-february.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «29 февраля»

192148, г. Санкт-Петербург, проспект Железнодорожный, д. 40, лит. Д, помещ 5-Н

тел.: +7 (812) 703-06-84

телефон горячей линии: +7 (800)777-91-49

адрес электронной почты: product@29-february.com

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(007282)-(РГ-RU)

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 09.04.2026 № 7303
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0006)

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Апрепитант-29Ф доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC