

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ОНДАНСЕТРОН
(ONDANSETRON)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: ondansetron; (3RS)-9-метил-3-[(2-метил-1H-імідазол-1-іл)-метил]-1,2,3,9-тетрагідро-4H-карбазол-4-ОН гідрохлориду дигідрат;

основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми, вкриті оболонкою жовтого кольору, з двоопуклою поверхнею, на поперечному розрізі видні два шари;

склад: 1 таблетка містить ондансетрону гідрохлориду дигідрату в перерахуванні на ондансетрон 4 мг або 8 мг;

допоміжні речовини: крохмаль прежелатинізований, лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, магнію стеарат, Opadry II Yellow.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Протиблювотні засоби і препарати, що усувають нудоту. Антагоністи 5HT₃-рецепторів серотоніну. Код АТС А04А А01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Протиблювотний засіб. Механізм дії зумовлений конкурентною високоселективною блокадою центральних і периферичних 5HT₃ рецепторів серотоніну. Пригнічує блювотний рефлекс, усуваючи та попереджаючи нудоту при застосуванні цитотоксичних хіміотерапевтичних засобів, променевої терапії, у післяопераційний період. При багаторазовому застосуванні уповільнює перистальтику і проходження вмісту по кишечнику.

Фармакокінетика. Препарат добре абсорбується у шлунково-кишковому тракті, біодоступність становить близько 60%, у зв'язку з ефектом "першого проходження" через печінку. Максимальна концентрація ондансетрону в крові досягається через 1,5 - 1,7 години. Вживання їжі подовжує період всмоктування на 17%, не впливаючи на максимальну концентрацію. Зв'язування з білками плазми - 70 - 76%.

Основна частина введеної дози (85 - 90%) гідроксильється у печінці за участі цитохрому P₄₅₀ до сполук індольного циклу, а далі кон'югує з глюкуроновою і сірчаною кислотами. Загальний об'єм розподілу становить 1,9 л/кг, період напіввиведення залежно від віку - від 3,5 до 5,5 години, загальний кліренс 5,9 мл/(хв · кг). Препарат екскретується з організму нирками, при цьому 5% введеної дози виводиться у незміненому вигляді. Фармакокінетичні параметри ондансетрону не змінюються при його багаторазовому застосуванні.

У дітей, а також у осіб з ураженнями печінки зменшується загальний кліренс, у пацієнтів похилого віку збільшується період напіввиведення і загальний кліренс препарату. У пацієнтів з помірною нирковою недостатністю (кліренс креатиніну 15 - 60 мл/хв) знижені системний кліренс і об'єм розподілу ондансетрону, результатом чого є клінічно незначуще невелике збільшення періоду напіввиведення препарату. У жінок рівень максимальної концентрації і біодоступність препарату вищі, а кліренс і рівень розподілу нижчі, ніж у чоловіків.

Показання для застосування. Профілактика і усунення нудоти та блювання при цитотоксичній хіміотерапії (початкові і повторні курси, включаючи застосування високих доз цисплатину) і променевої терапії (опромінення всієї поверхні тіла, часткове однократне високодозне або щоденне опромінення абдомінальної ділянки) в онкології. Профілактика і усунення нудоти і блювання у

Спосіб застосування і дози. При проведенні цитостатичної терапії режим дозування встановлюють індивідуально, залежно від ступеня вираженості блювотної реакції.

Помірна еметогенна хіміотерапія і променева терапія

Дорослим і дітям старше 12 років внутрішньо призначають: початково по 8 мг за 1-2 години до початку протипухлинної терапії з подальшим прийомом ще 8 мг через 8-12 годин. Для профілактики пізніх або тривалих нудоти та блювання після перших 24 годин слід продовжити застосування препарату по 8 мг кожні 12 годин. При частковому високодозному опроміненні абдомінальної ділянки призначають по 8 мг кожні 8 годин. Препарат приймають протягом усього курсу хіміо- і променевої терапії, а також 1-2 дні (за необхідності - 3-5 днів) після її закінчення.

Високоеметогенна хіміотерапія

Дорослим і дітям старше 12 років внутрішньо призначають 24 мг ондансетрону (одночасно з дексаметазону фосфатом) за 1-2 години до початку хіміотерапії. Для профілактики пізнього блювання у наступні дні по 8 мг 2 рази на добу протягом усього курсу хіміотерапії, а також 5 днів після її закінчення.

При хіміотерапії у дітей 4-12 років препарат призначають: початково по 4 мг 3 рази на добу (за 30 хвилин до початку курсу, далі через 4 та 8 годин). Для профілактики пізнього блювання призначають по 4 мг кожні 8 годин 1-2 дні, далі по 4 мг 2 рази на добу протягом усього курсу, а також 5 днів після його закінчення.

Післяопераційні нудота і блювання

Дорослим і дітям старше 12 років призначають по 16 мг за 1 годину до анестезії. Дітям до 12 років не призначають.

Максимальна добова доза ондансетрону становить 32 мг, для пацієнтів з вираженими порушеннями функції печінки – 8 мг.

Побічна дія. *З боку центральної нервової системи:* головний біль, запаморочення, спонтанні рухові розлади, напади судом, пригнічення центральної нервової системи, парестезії, слабкість, екстрапірамідна симптоматика, непритомність;

з боку серцево-судинної системи: відчуття жару і припливу крові до обличчя, аритмія, тахікардія або брадикардія, гіпотензія або гіпертензія;

з боку травної системи: запор, діарея, гикавка, сухість у роті, транзиторне підвищення активності амінотрансфераз, недостатність функції печінки;

алергічні реакції: кропив'янка, бронхоспазм, у поодиноких випадках – анафілактичні реакції;

інші: кашель, болі у грудній клітці (ангінозного типу).

Протипоказання. Підвищена чутливість до компонентів препарату; вагітність (особливо I триместр); період лактації; дитячий вік: при хіміо- і променевої терапії - до 4 років, при анестезії - до 12 років; недостатність функції печінки, хірургічні операції на черевній порожнині.

Передозування. При передозуванні можливо загострення симптомів, що описані у розділі «Побічна дія».

Лікування: відміна препарату і симптоматична терапія, спрямована на підтримку життєво важливих функцій. Специфічного антидоту немає.

Особливості застосування. У період лікування Ондансетроном годування груддю необхідно припинити.

При дуже вираженій блювотній реакції в результаті хіміотерапії ефективність препарату можна підвищити шляхом разового внутрішньовенного введення глюкокортикоїдів (наприклад 20 мг дексаметазону натрію фосфату) до початку хіміотерапії.

З обережністю призначати пацієнтам, які мають в анамнезі реакції гіперчутливості до інших

Сторінка 3 з 3. Видавець: Державний експертний центр МОЗ України
селективних антагоністів серотонінових 5HT₃-рецепторів. З обережністю та під ретельним медичним наглядом слід застосовувати препарат при лікуванні пацієнтів з ознаками підгострої непрохідності кишечника.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Одночасне застосування інгібіторів мікросомальних печінкових ферментів системи цитохрому P₄₅₀ може збільшувати час напіввиведення і знижувати загальний кліренс препарату.

При одночасному застосуванні з індукторами мікросомальних печінкових ферментів системи цитохрому P₄₅₀ (барбітурати, карбамазепін, каризопродол, глутетимід, гризеофульвін, закис азоту, папаверін, фенілбутазон, фенітоїн, гідантоїни, рифампіцин, толбутамід та ін.) можливо зниження клінічної ефективності препарату.

Умови та термін зберігання. Зберігати в сухому, захищеному від світла та недоступному для дітей місці при температурі не вище 25°C.

Термін придатності 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток у контурній чарунковій упаковці та пачці.

Виробник. ЗАТ НВЦ „Борщагівський хіміко-фармацевтичний завод”.

Адреса. Україна, 03134, м. Київ, вул. Миру, 17.