

# Осетрон: инструкция по применению

Латинское название: Osetron

Действующее вещество: ондансетрон

Код АТХ: А04АА01

Производитель: Д-р Редди`с Лабораторис Лтд. (Индия)

Условие отпуска из аптеки: по рецепту

Условия хранения: вдали от детей и света

Срок годности: 3 года

## Введение

«Осетрон» – противорвотный препарат центрального действия, который применяется против тошноты и рвоты вследствие химиолучевой терапии или оперативного вмешательства. Эффекты обусловлены селективным антагонизмом центральных и периферических 5-гидрокситриптаминовых рецепторов 3 типа. Наиболее распространенные возможные побочные действия – ощущение тепла, местные реакции гиперчувствительности и головная боль. «Осетрон» может дозозависимо удлинять QT-интервал и вызывать сердечные аритмии.

## Состав и форма выпуска

Действующее вещество:

- Ондансетрон.

Вспомогательные вещества:

- Лимонная кислота
- Хлорид натрия
- Молочный сахар
- Жидкость для инъекций.

«Осетрон» выпускается в виде таблеток, покрытых оболочкой, по 4 и 8 мг активного вещества. 1 мл раствора в ампулах содержит 2 мг ондансетрона.

## Фармакологические свойства

«Осетрон» – противорвотное средство, которое является антагонистом периферических и центральных 5-НТЗ-рецепторов. Серотонин выделяется в больших количествах из энтерохромаффинных клеток тонкого кишечника в ответ на цитостатическую или лучевую терапию. Ондансетрон демонстрирует хорошую противорвотную активность при химио- и радиотерапии опухолевых заболеваний. В отличие от других противорвотных средств, «Осетрон» не оказывает существенного влияния на дофаминовые, гистаминовые или мускариновые рецепторы.

*Интересно! Ондансетрон был разработан в Лондоне фармацевтической компанией Glaxo Group (теперь GlaxoSmithKline), которая подала заявку на патент в январе 1984 года.*

После приема ондансетрона пациент испытывает заметное уменьшение тошноты. Помимо чувства голода, серотонин также регулирует активность желудочно-кишечного тракта. Если повышается концентрация серотонина, это стимулирует общие висцеральные афферентные волокна и рвотный центр в центральной нервной системе.

Детальный механизм действия, с помощью которого антагонисты 5-HT<sub>3</sub> регулируют температуру тела и предотвращают рвоту, до конца не изучен. Испанские ученые предполагают, что ондансетрон ингибирует действие серотонина на преоптическую и переднюю области гипоталамуса.

После перорального введения «Осетрона» максимальные уровни в плазме достигаются в течение 90 минут. Биодоступность составляет около 55%, период полувыведения из плазмы – 180 минут. Экскреция происходит преимущественно в форме глюкуроновой кислоты или сульфатных конъюгатов. Неизвестно, являются ли метаболиты фармакологически активными. У пожилых людей метаболический клиренс «Осетрона», по-видимому, уменьшается, что отражается, среди прочего, в продолжительном периоде полувыведения в плазме (около 5 часов). Прямые корреляции между концентрацией в плазме и противорвотной эффективностью не были выявлены в исследованиях.

### Показания к применению

Ондансетрон – вспомогательное средство при цитостатической или лучевой терапии. Он также показан для лечения послеоперационной тошноты. Рвота, вызванная цитостатиками, является проблемой, которая может значительно повлиять на качество жизни пациентов со злокачественными заболеваниями. Особенно часто вызывает тошноту и рвоту цисплатин в более высоких дозах. С клинической точки зрения можно выделить три формы цитотоксической рвоты:

- Острая, которая возникает в течение 24 часов после введения цитотоксических препаратов
- Отсроченная, которая начинается на следующий день после терапии и может длиться четыре или пять дней
- Упреждающая, которая появляется в результате неблагоприятного опыта даже до введения цитотоксических препаратов.

В открытых исследованиях эффект ондансетрона также изучался у детей. В течение первых 24 часов 87% детей полностью избавлялись от рвоты при применении препарата. Однако в следующие 4 дня удовлетворительный противорвотный эффект сохранялся только у тех детей, которые получали менее мощные цитотоксические препараты. Ондансетрон также использовался на стадии подготовки к трансплантации костного мозга.

### Инструкция по применению

Рекомендации по дозировке зависят от используемых цитостатических средств. Если необходимо назначить цисплатин, рекомендуется ввести начальную 8 мг короткую инфузию, а затем две такие же дозы через 240 минут.

Ежесуточная доза не должна превышать 40 мг. При умеренно-эметогенной химиотерапии рекомендуется принимать ежедневно 1-2 таблетки препарата. При высокоэметогенной химиорадиотерапии назначают 2-4 таблетки ежедневно.

У детей старше 4 лет разрешается лечение с уменьшенными дозами. Пациенты с ранее существовавшим заболеванием печени не должны принимать ондансетрон. Более низкая начальная доза рекомендуется у пожилых людей.

### Противопоказания, побочные действия, передозировка, лекарственное взаимодействие

Ондансетрон категорически запрещено принимать при гиперчувствительности и мальабсорбции глюкозо-галактозы. При печеночной недостаточности общая суточная доза препарата не должна превышать восьми миллиграммов. Пациентам с врожденным синдромом удлиненного интервала QT (особая сердечная аритмия) не следует лечиться препаратом. Беременным женщинам и во время лактации также запрещено использовать препарат.

Только после тщательного рассмотрения пользы и рисков со стороны врача и под его контролем пациенты могут лечиться ондансетроном при других видах аритмий. При определенных условиях препарат можно принимать пациентам со слабостью сердечной мышцы или патологической брадикардией.

Основные побочные эффекты:

- Ощущение тепла в голове и верхней части живота
- Головокружение
- Сухость во рту
- Запоры и диарея (чаще встречаются при длительном введении)
- Опасные для жизни реакции гиперчувствительности: снижение артериального давления, замедление пульса, бронхokonстрикция и сыпь
- Сердечная аритмия
- Стенокардия
- Диспепсия
- Незначительное увеличение температуры тела
- Изжога
- Жажда
- Метеоризм
- Абдоминальные судороги
- Изменения вкуса.

При передозировке могут усиливаться диспепсические расстройства, сердечная аритмия или сужение бронхов. Специфического антидота не существует.

Ондансетрон метаболизируется различными изоферментами CYP – CYP3A4, CYP2D6 и CYP1A2. Сильные индукторы CYP3A4 могут снизить эффективность медикамента. Дальнейшие неблагоприятные взаимодействия описаны с апоморфином, селективными ингибиторами обратного захвата серотонина и трамадолом.

«Осетрон» следует использовать с осторожностью в сочетании с лекарственными средствами, которые продлевают QT-интервал. Антиаритмические средства из классов IA и III, антипсихотики, тетрациклические антидепрессанты, антибиотики, эритромицин (при введении в вену), пентамидин, терфенадин и мизоластин нельзя принимать вместе с «Осетроном».