

Emend®

Aprepitant USP

Description

Aprepitant (Emend®) is an antiemetic drug that belongs to a class of drugs called Substance P antagonists (SPA). It mediates its effect by blocking the Neurokinin 1 (NK₁) receptor.

Mode of action

Substance P/NK₁ receptor appears the final common pathway to regulate vomiting in medulla (the vomiting center in the brain). Aprepitant crosses the blood brain barrier and occupies brain NK₁ receptors. Aprepitant augments the antiemetic activity of the 5-HT₃-receptor antagonist Ondansetron and Corticosteroid; inhibits both the acute and delayed phases of Chemotherapy induced nausea and vomiting and Post-operative nausea and vomiting.

Pharmacokinetics

The mean absolute oral bioavailability of Aprepitant is approximately 60 to 65%. Aprepitant is greater than 95% bound to plasma proteins. The mean apparent volume of distribution at steady state is approximately 70 L in humans. Aprepitant is metabolized primarily by CYP3A4 with minor metabolism by CYP1A2 and CYP2C19. Aprepitant is eliminated primarily by metabolism; Aprepitant is not renally excreted. It is not known whether this drug is excreted in human milk.

Composition

Emend® 40 mg Capsule: Each Capsule Contains Aprepitant USP 40 mg.

Emend® 125 mg Capsule: Each Capsule Contains Aprepitant USP 125 mg.

Indications

1. Prevention of Postoperative Nausea and Vomiting.
2. Prevention of Chemotherapy Induced Nausea and Vomiting.
3. Cyclic Vomiting Syndrome.

Dosage & administration

01. Prevention of Postoperative Nausea and Vomiting:

The recommended oral dosage is 40 mg Cap. within 3 hours prior to induction of anesthesia.

02. Prevention of Chemotherapy Induced Nausea and Vomiting:

Aprepitant is given for 3 days as part of a regimen that includes a Corticosteroid and a 5-HT₃ antagonist. The recommended dose of Aprepitant is 125 mg orally 1 hour prior to Chemotherapy treatment (Day 1) and 80 mg orally once daily in the morning on Days 2 and 3.

03. Prevention of Chemotherapy Induced Nausea and Vomiting in children:

12-17 years of age:

1st day: Aprepitant 125 mg plus Ondansetron.

2nd & 3rd day: Aprepitant 80 mg plus Ondansetron

6 months to <12 years of age:

1st day: 3.0 mg/kg up to 125 mg plus Ondansetron.

2nd & 3rd day: 2.0 mg/kg up to 80 mg plus Ondansetron.

04. Cyclic Vomiting Syndrome:

Prophylactic schedule for cyclic vomiting syndrome:

<40 kg: 40 mg

>40-60 kg: 80 mg

>60 kg: 125 mg

Twice/week.

Acute schedule for cyclic vomiting syndrome:

>20 kg: 125 mg at day 1 followed by 80 mg at day 2 and 3.

<20 kg: 80 mg for 3 consecutive days.

<15 kg: 80 mg at day 1, 40 mg at day 2 and 3.

Contraindications

Aprepitant is a weak-to-moderate (dose-dependent) Cytochrome P450 isoenzyme 3A4 (CYP3A4) inhibitor. Aprepitant should not be used concurrently with Pimozide, Terfenadine, Astemizole, or Cisapride. Dose-dependent inhibition of CYP3A4 by Aprepitant could result in elevated plasma concentrations of these drugs.

Side effects

Constipation, diarrhea, dyspepsia & heartburn.

Use in pregnancy & lactation

USFDA Pregnancy Category **B** (No evidence of risk in humans). It is not known if Aprepitant passes into milk and if it can harm baby.

Precautions

01. Co administration of Aprepitant with Warfarin (a CYP2C9 substrate) may result in a clinically significant decrease in International Normalized Ratio (INR) of prothrombin time.
02. The efficacy of hormonal contraceptives during and for 28 days following the last dose of Aprepitant may be reduced.
03. Aprepitant is a dose-dependent inhibitor of CYP3A4, and should be used with caution in patients receiving concomitant medications that are primarily metabolized through CYP3A4.
04. Caution should be exercised when administered in patients with severe hepatic impairment.

Drug interactions

Aprepitant is a substrate for CYP3A4; therefore, coadministration of Aprepitant with drugs that inhibit or induce CYP3A4 activity may result in increased or reduced plasma concentrations of Aprepitant. It is an inducer of CYP2C9; therefore, coadministration of Aprepitant with drugs that are metabolized by CYP2C9 (e.g., Warfarin, Tolbutamide), may result in lower plasma concentrations of these drugs.)

Over dosage

No specific information is available on the treatment of over dosage. Drowsiness and headache were reported in one patient who ingested 1440 mg of Aprepitant. In the event of overdose, Aprepitant should be discontinued and general supportive treatment and monitoring should be provided. Because of the antiemetic activity of Aprepitant, drug-induced emesis may not be effective.

Storage

Store in a cool (Below 25°C temperature) and dry place protected from light.

Packaging

Emend® 40 mg Capsule: Each carton contains 10X1 capsules in blister pack.

Emend® 125 mg Capsule: Each carton contains 1X1 capsule in blister pack.



Manufactured by
Opsonin Pharma Limited
Rupatali, Barishal, Bangladesh.
® Registered Trade Mark.

ইমেভ®

এপ্রিপিট্যান্ট ইউএসপি

বিবরণ

এপ্রিপিট্যান্ট (ইমেভ®) হচ্ছে একটি বমিরোধক ঔষধ যা সাবস্ট্যান্স পি এন্টোফিনিট গ্রাপের অর্ভুক্ত। এটি নিউকাইন-১ (NK1) রিসেপ্টরকে বাধা প্রদান করার মাধ্যমে কাজ করে।

কার্যপদ্ধতি

সাবস্ট্যান্স P/NK1 রিসেপ্টর হচ্ছে মেডুলার (মিস্টিকের বমি কেন্দ্র) বমি নিয়ন্ত্রণের সর্বশেষ সাধারণ পদ্ধতি। এপ্রিপিট্যান্ট গ্রাপ ত্রেইন ব্যরিয়ার অতিক্রম করে এবং NK1 রিসেপ্টরের সাথে বন্ধন তৈরি করে। এপ্রিপিট্যান্ট 5-HT3-রিসেপ্টর আরোধক অভানসেট্রন এবং কার্টিকোষ্টেরয়েড এর বমি প্রতিরোধী ক্রিয়াকে বাড়িয়ে দেয় এবং অঙ্গোপচার পরবর্তী বমি-বমি ভাব ও বমি প্রতিরোধে সহায়তা করে।

ওষুধের উপর শরীরের ক্রিয়া (ফার্মাকোকাইনেটিক্স)

এপ্রিপিট্যান্ট এর মৌখিক সেবনের ক্ষেত্রে গড় প্রাপ্ত্য থায় ৬০-৬৫%। এপ্রিপিট্যান্ট গ্লাজমা প্রোটিনে ৯৫% এর বেশি আবক্ষ থাকে। স্থির অবস্থায় গড় পরিবর্বনীয় আয়তন হচ্ছে ৭০ লিটার। এপ্রিপিট্যান্ট প্রাথমিকভাবে CYP3A4 দ্বারা এবং কিছু অংশ CYP1A2 এবং CYP2C19 দ্বারা বিপাক হয়। এপ্রিপিট্যান্ট প্রাথমিকভাবে বিপাক দ্বারা অপসারিত হয়। এটি কিউনোর মাধ্যমে অপসারিত হয় না। এটি বুকের দুধে নিষ্পত্তি হয় কিন্তু এ তথ্য জানা নেই।

উপাদান

ইমেভ® ৪০ মিথা ক্যাপসুল: প্রতিটি ক্যাপসুলে আছে এপ্রিপিট্যান্ট ইউএসপি ৪০ মিথা।

ইমেভ® ১২৫ মিথা ক্যাপসুল: প্রতিটি ক্যাপসুলে আছে এপ্রিপিট্যান্ট ইউএসপি ১২৫ মিথা।

নির্দেশনা

- (১) অঙ্গোপচার পরবর্তী বমি-বমি ভাব ও বমি প্রতিরোধে।
- (২) কেমোথেরাপি দ্বারা আবিষ্ট বমি-বমি ভাব ও বমি প্রতিরোধে।
- (৩) বারবার হয় এমন বমি-র চিকিৎসায়।

মাত্রা ও ধারণা

(১) অঙ্গোপচার পরবর্তী বমি-বমি ভাব ও বমি প্রতিরোধে: সুপারিশকৃত মুখে সেবনযোগ্য মাত্রা হচ্ছে ৪০ মিথা ক্যাপসুল, চেতনানাশক ব্যবহারের ৩ ঘন্টা পূর্বে।
(২) কেমোথেরাপি দ্বারা আবিষ্ট বমি-বমি ভাব ও বমি প্রতিরোধে: এপ্রিপিট্যান্ট ৩ দিনের জন্য চিকিৎসাপ্রের সাথে দেওয়া হয় যাতে কার্টিকোষ্টেরয়েড এবং একটি 5-HT3 অবরোধক থাকে। এপ্রিপিট্যান্ট এর সুপারিশকৃত মাত্রা হচ্ছে মুখে সেব্য ১২৫ মিথা, প্রথমদিনে কেমোথেরাপি চিকিৎসার ১ ঘন্টা পূর্বে এবং ২য় ও ৩য় দিন সকালে মুখে সেব্য ৮০ মিথা।
(৩) শিশুদের ক্ষেত্রে কেমোথেরাপি দ্বারা আবিষ্ট বমি-বমি ভাব ও বমি প্রতিরোধে:

১২-১৭ বছরের বয়স:
১ম দিন: এপ্রিপিট্যান্ট ১২৫ মিথা সাথে অনডানসেট্রন

২য় ও ৩য় দিন: এপ্রিপিট্যান্ট ৮০ মিথা সাথে অনডানসেট্রন

৬ মাস - ১২ বছরের নিচে:

১ম দিন: এপ্রিপিট্যান্ট ৩ মিথা/কেজি সর্বোচ্চ ১২৫ মিথা পর্যন্ত সাথে অনডানসেট্রন

২য় ও ৩য় দিন: এপ্রিপিট্যান্ট ২ মিথা/কেজি সর্বোচ্চ ৮০ মিথা পর্যন্ত সাথে অনডানসেট্রন

(৪) বারবার হয় এমন বমি-র চিকিৎসায়:

প্রতিরোধ চিকিৎসায়

<৪০ কেজি: ৪০ মিথা

৪০-৬০ কেজি: ৮০ মিথা

>৬০ কেজি: ১২৫ মিথা সম্ভাব্য দুইবার।

তীব্র বারবার বমি-র চিকিৎসা:

>২০ কেজি: ১ম দিন ১২৫ মিথা এবং ২য় ও ৩য় দিন ৮০ মিথা।

<২০ কেজি: ৮০ মিথা করে পরপর ৩ দিন।

<১৫ কেজি: ১ম দিন ৮০ মিথা এবং ২য় ও ৩য় দিন ৪০ মিথা করে।

ব্যবহৃত ব্যবহার (যেসেব ক্ষেত্রে ব্যবহার করা যাবে না)

এপ্রিপিট্যান্ট হচ্ছে মৃদু থেকে মধ্যম প্রকৃতির (মাত্রার উপর নির্ভরশীল) CYP3A4 এর প্রতিরোধক। এপ্রিপিট্যান্টকে পিমোজাইড, টারফেনাডিন, অ্যাটেমিজিল অথবা সিসপ্রাইড এর সাথে একত্রে ব্যবহার করা উচিত নয়।

এপ্রিপিট্যান্ট দ্বারা (মাত্রার উপর নির্ভরশীল) CYP3A4 এর প্রতিরোধ রক্তেরসে এই সকল ঔষধের ঘনমাত্রা বাড়িয়ে দিতে পারে।

পর্যবেক্ষণ

কোষ্ঠ কাটিল্য, ডায়রিয়া, বদহজম এবং বুক জ্বালাপোড়া।

গর্ভবত্তা ও স্তনদানকালে ব্যবহার

প্রেগনেন্সি কাটাগরি বি (মানুষের ক্ষেত্রে ক্ষতির কোন প্রমাণ নেই), এপ্রিপিট্যান্ট মাত্দাক্ষে যায় কিন্তু না বা বাচ্চার ক্ষতি করে কিন্তু না এ তথ্য জানা নেই।

সতর্কতা

(১) ওরাফারিন CYP2C9 (একটি বিক্রিয়ক) এর সাথে একত্রে ব্যবহার করলে এটি প্রোগ্রাম সময়ের ইন্টারন্যাশনাল নরমালাইজড রেশিও (আই এন আর) তাপ্রমাণপূর্ণভাবে কমিয়ে দিতে পারে।

(২) এপ্রিপিট্যান্ট ব্যবহারের সময় বা সর্বশেষ ২৮ দিনের মধ্যে হরমোনাল গর্ভনিরোধক ব্যবহারের করলে এর সক্রিয়তা কমে যেতে পারে।

(৩) এপ্রিপিট্যান্ট হচ্ছে CYP3A4 এর একটি মাত্রানির্ভর প্রতিরোধক, সুতরাং যেসকল রোগীকে CYP3A4 দ্বারা বিপাকযোগ্য ঔষধ দিয়ে চিকিৎসা করা হয় তাদের সাথে একত্রে ব্যবহারে সতর্কতা অবলম্বন করতে হবে।

(৪) প্রক্ট যক্ত সমস্যায় আত্রাত রোগীর ক্ষেত্রে সতর্কতা অবলম্বন করতে হবে।

অন্য ঔষধের সাথে প্রতিক্রিয়া

এপ্রিপিট্যান্ট হচ্ছে CYP3A4 এর একটি বিক্রিয়ক। সুতরাং যেসকল ঔষধ CYP3A4 এর কাজকে বাড়িয়ে দেয় অথবা কমিয়ে দেয় তাদের সাথে একত্রে ধর্যোগ করলে রক্তেরসে এপ্রিপিট্যান্ট এর ঘনমাত্রা বাড়তে বা কমতে পারে। এটি CYP2C9 কে অবিষ্ট করে। সুতরাং যেসকল ঔষধ CYP2C9 দ্বারা বিপাক হয় (ওয়ারফারিন, টলনিউটামাইড) তাদের ক্ষেত্রে একত্রে ধর্যোগ করলে রক্তেরসে এই সকল ঔষধের ঘনমাত্রা কমে যেতে পারে।

মাত্রাধিক্রিয়া

মাত্রাধিক্রিয়ে চিকিৎসার ক্ষেত্রে কোন নির্দিষ্ট তথ্য পাওয়া যায়নি। একজন রোগীর ক্ষেত্রে ঘূর্ম ঘূর্ম ভাব এবং মাথাব্যাখ্যা উভয়ের করা হয়েছে যে ১৪৪০ মিথা এপ্রিপিট্যান্ট সেবন করেছিল। মাত্রাধিক্রিয়ে একত্রে এপ্রিপিট্যান্ট বন্ধ করে দিতে হবে এবং সাধারণ সহায়ক চিকিৎসা এবং পর্যবেক্ষণ চালাতে হবে। এপ্রিপিট্যান্ট এর বমি প্রতিরোধী ক্রিয়ার ফলে ঔষধ দ্বারা বমি করানোর কৌশল কার্যকর না ও হতে পারে।

সংরক্ষণ

আলো থেকে দূরে ঠাড়া (২৫°সে. এর নিচে) ও শুক্রস্থানে রাখুন।

উপস্থাপনা

ইমেভ® ৪০ মিথা ক্যাপসুল: প্রতিটি কার্টনে স্লিপ্টার প্যাকে রয়েছে ১০১১ ক্যাপসুল।

ইমেভ® ১২৫ মিথা ক্যাপসুল: প্রতি কার্টনে স্লিপ্টার প্যাকে রয়েছে ১১১ ক্যাপসুল।


Opsonin
Opsonin Pharma
Ideas for healthcare

Manufactured by
Opsonin Pharma Limited
Rupatali, Barishal, Bangladesh.
® Registered Trade Mark.