



МАРОПІТАНТ 1% (розчин для ін'єкцій) листівка-вкладка

Опис

Прозорий розчин від безбарвного до жовтого кольору.

Склад

1 мл препарату містить діючу речовину:

маропітанту цитрат моногідрат в перерахунку на маропітант – 10 мг.

Допоміжні речовини: гідроксипропілбетадекс, бензиловий спирт, лимонна кислота або натрію гідроксид (для корекції рН), вода для ін'єкцій.

Фармакологічні властивості

ATC vet класифікаційний код: QA04 – Протиблювотні та протинудотні засоби. QA04AD90 – Маропітант.

Маропітант є високоселективним антагоністом рецептора нейрокініну 1 (NK1), він блокує дію субстанції Р, ключового нейромедіатора, який бере участь у процесі блювання, у центральній нервовій системі. Речовина Р (нейрокінін 1), нейропептид, що складається з 11 амінокислот, належить до сімейства тахікінінів (біологічно активних нейропептидів) і виявляється у високих концентраціях у центрі блювання. Дія речовини Р опосередковується трьома G-білковими рецепторами, позначеними NK1, NK2 і NK3. Більшість центральних і периферичних ефектів речовини Р опосередковується рецепторами NK1. Рецептори NK1 можуть бути виявлені як в центральній, так і в периферичній нервовій системі. Вони також присутні у стовбурі мозку, нейронах, ендотеліальних клітинах судин, травного каналу, легеневої тканини та м'язах. Речовина Р є кращим лігандом для рецептора NK1, переважного рецептора тахікініну в мозку. Маропітант імітує структуру речовини Р і взаємодіє з рецепторами NK1, тому вони не можуть зв'язувати речовину Р, таким чином зменшуючи стимуляцію еметичного центру. Шляхом інгібування зв'язування субстанції Р маропітант усуває як центральні, так і периферичні причини блювоти та пригнічує дію різноманітних блювотних засобів, таких як апоморфін, ксилазин, сироп іпекакуани та цисплатин у собак, а також ксилазин у котів.

Собаки

Фармакокінетичні параметри маропітанту за одноразового підшкірного введення собакам в дозі 1 мг маропітанту на 1 кг м.т. становлять: максимальна концентрація (C_{max}) у плазмі крові – 92 нг/мл через 0,75 години після введення (T_{max}); період напіввиведення ($t_{1/2}$) – 8,84 години.

Після підшкірного введення собакам 1 мг маропітанту на 1 кг м.т. один раз на добу протягом 5 діб його накопичення становить 146%.

За одноразового внутрішньовенного введення собакам 1 мг маропітанту на 1 кг м.т. його початкова концентрація в плазмі крові становить 363 нг/мл, об'єм розподілу в рівноважному стані (Vss) – 9,3 л/кг, системний кліренс – 1,5 л/год/кг, а період напіввиведення ($t_{1/2}$) – близько 5,8 годин.

Терапевтичний рівень маропітанту в плазмі крові собак досягається через 1 годину після застосування.

Біодоступність у собак після підшкірного введення – 90,7%. Маропітант демонструє лінійну кінетику за підшкірного введення в діапазоні доз 0,5–2 мг на 1 кг м.т.

Маропітант піддається метаболізму цитохромом P450 (CYP) у печінці. CYP2D15 і CYP3A12 були ідентифіковані в собак як ізоформи, що беруть участь у біотрансформації маропітанту в печінці.

Нирковий кліренс є незначимим шляхом елімінації: менше 1% від підшкірно введеної дози 1 мг/кг м.т., виявляється в сечі у вигляді маропітанту або його основного метаболіту. Зв'язування з білками плазми становить понад 99%.

Коти

Фармакокінетичні параметри маропітанту за одноразового підшкірного введення котам в дозі 1 мг на 1 кг м.т. становлять: максимальна концентрація (C_{max}) у плазмі крові – біля 165 нг/мл в середньому через 19 хвилин після введення (T_{max}); період напіввиведення ($t_{1/2}$) – 16,8 години. Після одноразового внутрішньовенного введення в дозі 1 мг на 1 кг м.т. початкова концентрація маропітанту у плазмі складає 1040 нг/мл, об'єм розподілу в рівноважному стані (Vss) – 2,3 л/кг, а системний кліренс – 0,51 л/год/кг, період напіввиведення ($t_{1/2}$) – приблизно 4,9 години.

Фармакокінетика маропітанту в організмі котів залежить від віку: кліренс у 4-місячних кошенят вищий, ніж у дорослих котів.

Концентрація маропітанту в плазмі крові котів досягає терапевтичного рівня через 1 годину після введення.

Біодоступність маропітанту у котів після підшкірного введення становить 91,3%. Маропітант демонструє лінійну кінетику при підшкірному введенні у дозах 0,25–3 мг на 1 кг м.т.

Після підшкірного введення 1 мг маропітанту на 1 кг м.т. один раз на добу протягом 5 діб поспіль накопичення становить 250%.

Маропітант метаболізується у печінці під дією цитохрому P450 (CYP) шляхом біотрансформації ферментами CYP1A та CYP3A, які ідентифіковані як котячі ізоформи.

Після підшкірного введення в дозі 1 мг на 1 кг м.т. менше 1% маропітанту виводилося із сечею або фекаліями у незміненому вигляді, його основний метаболіт у кількості 10,4% дози виділявся із сечею та 9,3% дози – з фекаліями. Зв'язування маропітанту з білками плазми крові у котів становить 99,1%.

Застосування

Собаки:

- для лікування та профілактики нудоти, спричиненої хіміотерапією;
- для запобігання блювання, за винятком того, що спричинене локомоційною хворобою;
- для лікування хворих тварин з симптомом блювання в поєднанні з іншими підтримуючими заходами;
- для попередження післяопераційної нудоти та блювання і покращення відновлення після загальної анестезії після застосування агоніста μ -опіатних рецепторів морфіну.

Коти:

- для лікування та профілактики нудоти, спричиненої хіміотерапією;
- для лікування блювоти в поєднанні з іншими підтримуючими заходами.



Протипоказання

Не застосовувати за підвищеної чутливості до компонентів препарату.
Не застосовувати виснаженим, хворим та тваринам зі зниженою масою тіла.

Дозування

Собаки:

- віком 2-4 місяці - 0,1 мл препарату на 1 кг м.т. (відповідає 1 мг маропітанту на 1 кг м.т.), підшкірно, один раз на добу, курс лікування – до 5 діб;
- віком від 4 місяців – 0,1 мл препарату на 1 кг м.т. (відповідає 1 мг маропітанту на 1 кг м.т.), внутрішньовенно протягом 1–2 хвилин або підшкірно, один раз на добу, курс лікування – до 5 діб.

Для запобігання блювання, викликаного еметогенними або хіміотерапевтичними засобами, собакам віком від 4 місяців препарат слід вводити як зазначено вище більш, ніж за 60 хв до застосування засобу, що спричиняє блювоту.

Коти:

- віком від 4 місяців – 0,1 мл препарату на 1 кг м.т. (відповідає 1 мг маропітанту на 1 кг м.т.) внутрішньовенно протягом 1–2 хвилин або підшкірно, один раз на добу, курс лікування – до 5 діб.

Перед застосуванням препарату слід провести відповідні діагностичні оцінки для виявлення причин блювання, що можуть бути пов'язані з виснажливими станами, включаючи шлунково-кишкові обструкції.

Якщо блювання не припиняється, не зважаючи на лікування, необхідно провести повторну оцінку випадку.

Перед підшкірним введенням препарат бажано попередньо охолодити, щоб зменшити больові реакції.

Застереження

Побічна дія

Під час застосування препарату в рекомендованих дозах побічних явищ, як правило, не спостерігається.

За підшкірного введення може виникати біль у місці ін'єкції, що минає протягом кількох хвилин без лікування. У котів дуже часто спостерігається помірна та тяжка реакція на ін'єкції.

У дуже рідкісних випадках можуть виникати реакції анафілактичного типу (алергічний набряк, кропив'янка, еритема, колапс, задишка, блідість слизових оболонок, неврологічні розлади (атаксія, судоми/судоми або тремтіння м'язів)).

Алергічні реакції, як правило, проходять протягом 48 годин після припинення застосування препарату та відповідного лікування.

Особливі застереження при використанні

Препарат слід застосовувати разом з іншими ветеринарними та допоміжними заходами, такими як контроль дієти та замісна терапія, одночасно усуваючи основні причини блювання.

Препарат слід з обережністю застосовувати у таких випадках: цуценятам віком до 8 тижнів та кошенятм віком до 16 тижнів, а також для вагітних або лактуючих собак і кішок, тому використовувати для цих вікових груп та типів тварин згідно з оцінкою користі та ризику відповідальним ветеринарним лікарем. Маропітант метаболізується в печінці, тому його слід з обережністю застосовувати тваринам із захворюваннями печінки. Оскільки маропітант накопичується в організмі протягом 14-денного періоду лікування внаслідок метаболічного насичення, ретельний моніторинг функції печінки та будь-яких небажаних явищ слід здійснювати під час тривалого лікування.

Препарат слід застосовувати з обережністю тваринам, які страждають або мають схильність до серцевих захворювань, оскільки маропітант має спорідненість до Са- та К-іонних каналів. Збільшення інтервалу QT на ЕКГ приблизно на 10% спостерігалось в дослідженнях на здорових собаках породи бігль, яким застосовували 8 мг/кг м.т. перорально; однак таке підвищення навряд чи матиме клінічне значення.

Використання під час вагітності, лактації

Безпечність маропітанту не досліджувалась на вагітних та лактуючих суках та кішках.

Застосовувати препарат тваринам у період вагітності та лактації, рекомендують за рішенням лікаря ветеринарної медицини, коли користь від препарату переважає можливі ризики.

Взаємодія з іншими засобами та інші форми взаємодії

Препарат не слід застосовувати одночасно з антагоністами Са-іонних каналів, оскільки маропітант має спорідненість до Са-іонних каналів.

Маропітант активно зв'язується з білками плазми крові, тому потрібно з обережністю застосовувати з іншими препаратами, що мають високий ступінь зв'язування з білками: нестероїдні протизапальні препарати (НПЗП), серцеві, протисудомні та ветеринарні препарати для корекції поведінки.

Передозування

Собаки та молоді коти, яким щодня вводили до 5 мг маропітанту на 1 кг м.т. (у 5 разів вище терапевтичної дози) протягом 15 діб поспіль (у 3 рази довше рекомендованої тривалості введення), добре перенесли передозування, за виключенням появи тимчасових реакцій у місці ін'єкції за підшкірного введення. Про передозування у дорослих котів не повідомлялося.

Спеціальні застереження

За внутрішньовенного введення препарату його не слід змішувати з іншими засобами.

Препарат необхідно вводити не менше ніж за 1 годину перед застосуванням лікарських засобів, що викликають блювання, тривалість ефективної дії препарату становить приблизно 24 години.

Спеціальні застереження для осіб і обслуговуючого персоналу, котрі застосовують препарат тваринам

Персонал, який працює з препаратом, повинен дотримуватися основних правил гігієни та безпеки, прийнятих під час роботи з ветеринарними препаратами.

Після роботи з препаратом необхідно ретельно вимити руки з милом.

За випадкового потрапляння препарату на шкіру, слизові оболонки або в очі їх необхідно промити великою кількістю проточної води.

Форма випуску

Флакони скляні, закупорені пробками гумовими і обтиснуті ковпачками алюмінієвими, об'ємом 10 та 50 мл, в картонній коробці або без.

Зберігання

У сухому темному та недоступному для дітей місці за температури від 5 до 25 °С.

Термін придатності – 2 роки.

Термін придатності після першого відбору із флакона за умови зберігання в герметично закритій тарі за температури від 2 до 8 °С – 28 діб.

Лише для ветеринарної медицини!

Власник реєстраційного посвідчення та виробник готового продукту:

ТОВ «ВП «Укрзооветпромстач»
вул. Кавказька, 1, с. Плахтянка, Бучанський р-н,
Київська обл., 08030, Україна.
www.ukrzoovet.com.ua

