

МАРОКС	
розчин для ін'єкцій	
ОПИС	Прозорий розчин жовтого кольору.
СКЛАД	1 мл препарату містить діючу речовину: маропітанту цитрат у перерахунку на маропітант – 10 мг. Допоміжні речовини: сульфобутиловий ефір бета-циклодекстрину, метакрезол, вода для ін'єкцій.
ФАРМАКОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ	ATCvet класифікаційний код QA04 – Протиблювотні та протинудотні засоби. QA04AD90 Маропітант. Маропітант є високоелективним 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 тахікінів (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'язях. 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. Інгібуючи зв'язування субстанції Р у блювотному центрі, маропітант забезпечує ефективність широкого спектру дії проти нервових (центральної) та гуморальних (периферичних) причин блювоти, а також виявляє протиблювотну дію на центральні і периферичні еметогени, включаючи апоморфін і сироп блювотного кореня (у собак) і ксилазину (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 днів 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 (V_{ss}) - 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 незначним 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 (V_{ss}) - 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 днів поспіль накопичення становить 250%. Маропітант метаболізується у печінці під дією цитохрому P450 (CYP) шляхом біотрансформації ферментами CYP1A та CYP3A, які ідентифіковані як котачі ізоформи. Після підшкірного введення в дозі 1 мг на 1 кг м.т. менше 1% маропітанту виводилося із сечею або фекаліями у незмінену 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.

ДОЗУВАННЯ	Підшкірно або внутрішньовенно. Препарат вводять підшкірно або внутрішньовенно 1 раз на добу у дозі 1 мг маропітанту на 1 кг маси тіла (1 мл препарату на 10 кг маси тіла) протягом 5 діб посліпль. Внутрішньовенне введення препарату слід проводити одноразово, не змішуючи препарат з іншими розчинами. Щоб запобігти блюванню, препарат слід вводити за 1 годину. Тривалість ефекту становить приблизно 24 години, тому лікування можна проводити на ніч перед введенням препарату, який може спричинити блювання, наприклад, при хіміотерапії. Оскільки варіація фармакокінетики є великою, а маропітант накопичується в організмі після повторного прийому один раз на добу, для деяких осіб може бути достатньо дози, нижчої за рекомендовані, навіть при повторному дозуванні.
ПРОТИПОКАЗАННЯ	Не застосовувати тваринам зі зниженою масою тіла, а також виснаженим і хворим тваринам! Не застосовувати за підвищеної чутливості до компонентів препарату! Не застосовувати вагітним та лактуючим тваринам! При застосуванні не змішувати препарат з іншими ветеринарними препаратами в одному шприці!
ЗАСТЕРЕЖЕННЯ	<i>Побічна дія</i> 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'єкцію. У дуже рідкісних випадках можуть виникати реакції анафілактичного типу (алергічний набряк, кропив'янка, еритема, колапс, задишка, блідість слизових оболонок, неврологічні розлади (атаксія, судими/судоми або тремтіння м'язів)). Алергічні реакції, як правило, проходять протягом 48 годин після припинення застосування препарату та відповідного лікування. <i>Особливі застереження при використанні</i> 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: цуценятam віком до 8 тижнів та кошенятam 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 лікарем ветеринарної медицини. 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. <i>Застосування у період вагітності або лактації</i> Безпечно застосування МАРОКС не оцінювалось у собак або котів, які використовуються для розмноження та у вагітних чи лактуючих самиць. Застосовувати препарат тваринам у період вагітності та лактації, рекомендують за рішенням лікаря ветеринарної медицини, коли користь від препарату переважає можливі ризики. <i>Взаємодія з іншими засобами та інші форми взаємодії</i> 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), серцеви, протисудомні та ветеринарні препарати для корекції поведінки. Необхідно стежити за сумісністю препаратів для тих тварин, які потребують ад'ювантної терапії. <i>Спеціальні застереження для осіб і обслуговуючого персоналу</i> Не палити, не пити, не приймати їжу під час роботи з препаратом! Препарат зберігати подалі від джерел тепла та вогню.
ФОРМА ВИПУСКУ	Скляні флакони об'ємом 10, 20, 50 мл, вкладені у картонні пакчи по 1 флакону.
ЗБЕРІГАННЯ	Сухе темне, недоступне для дітей місце за температури не вище 30 °С. Не заморозувати! Після першого проколювання флакону розчин для ін'єкцій МАРОКС потрібно зберігати у холодильнику за температури 2-8 °С та використати протягом 60 діб з моменту першого проколювання. Пробку можна проколювати не більше 25 разів. Термін придатності – 2 роки.
для застосування у ветеринарній медицині!	
ВЛАСНИК РЕЕСТРАЦІЙНОГО ПОСВІДЧЕННЯ	ТОВ «БІОТЕСТЛАБ» Україна 08601, Київська область, м. Васильків, вул. Володимирська, 57А
ВИРОБНИК ГОТОВОГО ПРОДУКТУ	ТОВ «БІОТЕСТЛАБ» Україна 08601, Київська область, Обухівський район, м. Васильків, вул. Лістового Олександра, 1/3 www.bioteslab.ua