**Коротка характеристика препарату**

**1. Назва**

МАРОПІТАНТ 1%

**2. 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.

**3. Фармацевтична форма**

Розчин для ін’єкцій

**4. Фармакологічні властивості**

***АТС vet класифікаційний код: QA04 - Протиблювотні та протинудотні засоби. QA04AD90 - Маропітант.***

Маропітант є високоселективним антагоністом рецептора нейрокініну 1 (NK1), він блокує дію субстанції P, ключового нейромедіатора, який бере участь у процесі блювання, у центральній нервовій системі. Речовина P (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 P опосередковується трьома G-білковими рецепторами, позначеними NK1, NK2 і NK3. Більшість центральних і периферичних ефектів речовини P 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, легеневій тканині та м’язах. Речовина Р є кращим лігандом для рецептора NK1, переважного рецептора тахікініну в мозку.

Маропітант імітує структуру речовини P і взаємодіє з рецепторами NK1, тому вони не можуть зв’язувати речовину P, 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 (Cmax) у плазмі крові - 92 нг/мл через 0,75 години після введення (Tmax); період напіввиведення (t1/2) - 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 (t1/2) - 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 (Cmax) у плазмі крові - біля 165 нг/мл в середньому через 19 хвилин після введення (Tmax), період напіввиведення (t1/2) - 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 (t1/2) - 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 метаболіується у печінці під дією цитохрому Р450 (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 виводилоcя 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%.

**5. Клінічні особливості**

**5.1 Вид тварин**

Собаки та коти.

**5.2 Показання до 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.

**5.3 Протипоказання**

Не застосовувати за підвищеної чутливості до компонентів препарату.

Не застосовувати виснаженим, хворим та тваринам зі зниженою масою тіла.

**5.4 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’єкцію.

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.

**5.5 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 кошенятам 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% спостерігалося в дослідженнях на здорових собаках породи бігль, яким застосовували 8 мг/кг м.т. перорально; однак таке підвищення навряд чи матиме клінічне значення.

**5.6 Використання під час вагітності, лактації, несучості**

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.

**5.7 Взаємодія з іншими засобами та інші форми взаємодії**

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

**5.8 Дози і способи введення тваринам різного віку**

*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.

**5.9 Передозування (симптоми, невідкладні заходи, антидоти)**

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 переносили передозування, за виключенням появи тимчасових реакцій у місці ін’єкції за підшкірного введення. Про передозування у дорослих котів не повідомлялося.

**5.10 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.

**5.11 Період виведення (каренція)**

Не регламентується.

**5.12 Спеціальні застереження для осіб і обслуговуючого персоналу**

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.

**6. Фармацевтичні особливості**

**6.1 Форми несумісності (основні)**

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

**6.2 Термін придатності**

2 роки. Термін придатності після першого відбору із флакона за умови зберігання в герметично закритій тарі за температури від 2 до 8 ºС - 28 діб.

**6.3 Особливі заходи зберігання**

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

**6.4 Природа і склад контейнера первинного пакування**

Флакони скляні, закупорені пробками гумовими і обтиснуті ковпачками алюмінієвими, об’ємом 10 та 50 мл.

**6.5 Особливі заходи безпеки при поводженні з невикористаним препаратом або із його залишками**

Невикористаний або протермінований препарат утилізують відповідно до чинного законодавства.

**7. Назва та місцезнаходження власника реєстраційного посвідчення**

ТОВ «ВП «Укрзооветпромпостач»

вул. Кавказька, 1, с. Плахтянка, Бучанський р-н.,

Київська обл., 08030, Україна.

www.ukrzoovet.com.ua

**8. Назва та місцезнаходження виробника**

ТОВ «ВП «Укрзооветпромпостач»

вул. Кавказька, 1, с. Плахтянка, Бучанський р-н.,

Київська обл., 08030, Україна.

www.ukrzoovet.com.ua

**9. Додаткова інформація**