

СОГЛАСОВАНО

Заместитель Руководителя
Россельхознадзора

Н. А. ВЛАСОВ

04.07.2017

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата Пексион[®] для снижения частоты генерализованных приступов, вызванных идиопатической эпилепсией у собак

(Организация-разработчик: фирма “Бёрингер Ингельхайм Ветмедика ГмбХ”, Бингер Штрассе 173, Д-55216 Ингельхайм/Рейн, Германия / “Boehringer Ingelheim Vetmedica GmbH”, Binger Strasse 173, D-55216 Ingelheim/Rhein, Germany)

I. ОБЩИЕ СВЕДЕНИЯ

1. Торговое наименование лекарственного препарата: Пексион[®] (Pexion[®]).

Международное непатентованное наименование лекарственного препарата: имепитоин.

2. Лекарственная форма: таблетки для перорального применения. Препарат выпускают в двух дозировках, содержащих в качестве действующего вещества имепитоин - 100 мг и 400 мг и вспомогательные вещества: моногидрат лактозы, микрокристаллическую целлюлозу, гипромеллозу, стеарат магния, гликолят натрия крахмала.

3. По внешнему виду препарат представляет собой таблетки овальной формы белого цвета с линией разлома по середине и символами “I 01” (на таблетке 100 мг имепитоина) и “I 02” (на таблетке 400 мг имепитоина).

Срок годности препарата при соблюдении условий хранения – 3 года со дня производства. Срок годности препарата после вскрытия флакона – 8 месяцев. Лекарственный препарат запрещается применять по истечении срока годности.

4. Препарат расфасован по 100 или 250 таблеток в пластиковые флаконы. Флаконы упаковывают с инструкцией по применению в индивидуальные картонные коробки.

5. Пексион[®] хранят в закрытой упаковке производителя отдельно от продуктов питания и кормов в защищенном от прямых солнечных лучей месте при температуре от 10 °С до 25 °С.

6. Лекарственный препарат следует хранить в местах, недоступных для детей.

7. Неиспользованный лекарственный препарат утилизируют в соответствии с требованиями законодательства.

8. Пексион[®] отпускается без рецепта ветеринарного врача.

II. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

9. Фармакотерапевтическая группа: противоэпилептические лекарственные средства.

10. Входящий в состав имепитоин (1,4-хлорфенил-4-морфолиноимидазол-2-он) относится к соединению группы противоэпилептических (противосудорожных) веществ центрального действия, которое проникает через гематоэнцефалический барьер без вовлечения в активный транспорт или активное выведение, что приводит к быстрому достижению равновесия его концентрации в плазме и клетках головного мозга.

Имепитоин ингибирует приступы через потенциацию ГАМК_A (GABA_A) - рецептор-медиаторных эффектов на нейронах. Кроме этого у него есть низкая эффективность в блокировании кальциевых каналов, что может способствовать антиконвульсивным свойствам препарата.

Имепитоин обладает слабым анксиолитическим (подавляющим страх, тревогу) действием.

Снижение или отсутствие противоэпилептического эффекта при продолжительном лечении Пексион® в течение 6 месяцев не наблюдалось.

Абсорбция

Фармакокинетические исследования указывают, что имепитоин хорошо (>92%) абсорбируется после перорального применения, и тем самым достигается быстрый первоначальный эффект. После перорального применения таблетки имепитоина из расчета 30 мг/кг натощак пик его концентрации в крови быстро достигает максимума приблизительно через 2 часа (T_{max}) до значения 18 мкг/мл (C_{max}). Применение таблеток имепитоина с кормом снижает концентрацию в крови на 30%, но не приводит к значительному изменению в T_{max} и C_{max}. Особых половых различий не выявлено.

Распределение

Линейность появляется в диапазоне терапевтических доз импетоина.

Имепитоин имеет относительно высокий объем распределения (579 до 1548 мл/кг). Связывание импетоина с белками плазмы *in vivo* составляет всего 60-70%. Накопление имепитоина в плазме не происходит с момента достижения стабильной концентрации.

Метаболизм

Имепитоин активно метаболизируется до элиминации. В моче и кале были определены четыре основных неактивных метаболита, которые образуются путем окислительной модификации.

Выделение

Имепитоин быстро выводится из крови (от 260 до 568 мл/часов/кг) с периодом полувыведения равным примерно от 1.5 до 2 часов. Основная часть импетоина и его метаболитов выводятся через фекалии, а не через мочу, поэтому не стоит ожидать больших отклонений в фармакокинетике и

накопления препарата у собак с нарушениями функций мочеполовой системы.

Пексион® по степени воздействия на организм относится к умеренно опасным веществам (3 класс опасности по ГОСТ 12.1.007-76).

III. ПОРЯДОК ПРИМЕНЕНИЯ

11. Пексион® назначают для снижения частоты генерализованных приступов, вызванных идиопатической эпилепсией у собак.

12. Противопоказанием к применению является индивидуальная повышенная чувствительность животного к компонентам препарата (в том числе в анамнезе), выраженные нарушения функции почек, печени, сердечно-сосудистой системы, желудочно-кишечного тракта. Запрещается применение Пексион® племенным кобелям, животным массой меньше 5 кг.

Препарат не рекомендуют применять при эпилептическом статусе (status epilepticus) и кластерных эпилептических приступах.

13. Пексион® применяют собакам после подтверждения врачом диагноза «идиопатическая эпилепсия», перорально два раза в день с интервалом 12 часов, в одно и то же время суток, в начальной разовой дозе 10 мг имепитоина на 1 кг массы тела животного (см.таблицу).

Разовая доза (количество таблеток на приём) в начале применения Пексион®:

Вес животного (кг)	Число таблеток	
	Таблетка 100 мг	Таблетка 400 мг
5,0	½	-
5,1-10,0	1	-
10,1-15,0	1 ½	-
15,1-20,0	-	½
20,1-40,0	-	1
40,1-60,0	-	1 ½
>60	-	2

В случае, если в течение 7 – 10 дней лечения частота приступов эпилепсии не снижается, то дозу препарата увеличивают на 50% до 100%, но суточная доза препарата не должна превышать 60 мг/кг массы. Суточную пероральную дозу делят на два приёма с промежутком примерно 12 часов. Таблетка может быть разделена по линии разлома для точности дозировки согласно массы тела.

Действие Пексион® характеризуется снижением частоты и интенсивности или предупреждением эпилептических приступов. Применение схемы с использованием Пексион® у животных, которые подвергались лечению другими противоэпилептическими лекарственными средствами и

находятся в стадии ремиссии, следует осуществлять с осторожностью постепенно и под контролем ветеринарного врача.

У некоторых животных наблюдается отсутствие действия препарата, при этом частота приступов не меняется или увеличивается, что может быть связано с клиническим проявлением других болезней. Для таких животных рекомендуется дальнейшее уточнение диагноза. Для снятия приступов при слабой эффективности Пексион® назначают другие противоэпилептические средства.

14. При передозировке препарата у животного могут наблюдаться нарушения со стороны центральной нервной системы (угнетение, закрытие век, слезотечение, сухость слизистой глаз и нистагм), желудочно-кишечные расстройства, QT интервала в кардиограмме. Указанные симптомы, как правило, обратимы и исчезают в течение 24 часов. При передозировке препарата в 5 раз может наблюдаться потеря веса.

У кобелей при 10-кратной передозировке наблюдается диффузная атрофия семявыносящих канальцев и связанное с этим уменьшение количества спермы.

15. Особенности фармакологического действия на организм животных при первом применении препарата и при его отмене не выявлено.

16. Данные по применению препарата кормящим и ценным сукам отсутствуют.

17. Следует избегать нарушения рекомендуемого интервала между введениями препарата, так как это может привести к снижению его эффективности. В случае пропуска очередной дозы, ее следует ввести как можно быстрее, далее применение препарата продолжают в соответствии с настоящей инструкцией.

18. При применении препарата в соответствии с настоящей инструкцией в редких случаях возможно проявление: полифагии (в начале лечения), полиурии, вялости, атаксии, тремора, рвоты и/или диареи, сонливости, гиперсальвации, атаксия, апатии, выпадение третьего века, ослабленное зрение, повышение слуховой чувствительности.

У собак, страдающих эпилепсией, может наблюдаться повышенная агрессивность сразу после приступа, а также изменение поведения, сопутствующее эпилепсии.

Применение Пексион®, как и других анксиолитических препаратов, действующих на рецепторы бензодиазепина, может привести к появлению страха, который в свою очередь способствует увеличению или снижению агрессивности в поведении.

19. Информации о несовместимости Пексион® с лекарственными препаратами других фармакологических групп отсутствует.

20. Пексион® не предназначен для применения продуктивным животным.

IV. МЕРЫ ЛИЧНОЙ ПРОФИЛАКТИКИ

21. При работе с лекарственным препаратом Пексион® следует соблюдать общие правила личной гигиены и техники безопасности, предусмотренные при работе с лекарственными препаратами. По окончании работы руки следует вымыть тёплой водой с мылом.

22. При случайном контакте лекарственного препарата со слизистыми оболочками глаза их необходимо промыть большим количеством воды. Людям с гиперчувствительностью к компонентам препарата следует избегать прямого контакта с Пексион®.

23. В случаях появления аллергических реакций или при случайном попадании препарата в организм человека (особенно ребёнка) следует немедленно обратиться в медицинское учреждение (при себе иметь инструкцию по применению препарата или этикетку).

Наименование и адрес
производственной площадки
производителя лекарственного
препарата для ветеринарного
применения:

Берингер Ингельхайм Промеко,
С.А. де С.В., Кайе Маиз 49, Баррис
Шальтокан, Дел. Сочимилько, С.П.
16090 Мехико, Д.Ф., Мексика /
Boehringer Ingelheim Promeco, S.A. de
C.V., Calle Maiz 49, Barrio Xaltocan,
Del. Xochimilco, C.P. 16090 Mexicc
City, D.F., Mexico.

Наименование, адрес
организации, уполномоченной
владельцем регистрационного
удостоверения лекарственного
препарата на принятие претензий от
потребителя:

ООО “Берингер Ингельхайм”,
125171, Москва, Ленинградское
шоссе, 16А, стр.3.

Инструкция разработана “Бёрингер Ингельхайм Ветмедика ГмбХ”/ “Boehringer Ingelheim Vetmedica GmbH” (Бингер Штрассе 173, Д-55216 Ингельхайм/Рейн, Германия / Binger Strasse 173, D-55216 Ingelheim/Rhein, Germany) совместно с ООО “БиоМедВетСервис” (г. Москва, 127410, ул. Поморская, д.48а).

Рекомендовано к регистрации в Российской Федерации ФГБУ «ВГНКИ».

Номер регистрационного удостоверения: 276-3-8.17-3762 СТВУ-3-8.17/05016