

PŘÍLOHA I
SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. NÁZEV VETERINÁRNÍHO LÉČIVÉHO PŘÍPRAVKU

Pergosafe 1 mg potahované tablety pro koně

2. KVALITATIVNÍ A KVANTITATIVNÍ SLOŽENÍ

Jedna tableta obsahuje:

Léčivá látka:

Pergolidum 1,0 mg
odpovídá 1,31 mg pergolidi mesilas

Pomocné látky:

Kvalitativní složení pomocných látek a dalších složek	Kvantitativní složení, pokud je tato informace nezbytná pro řádné podání veterinárního léčivého přípravku
Jádro:	
Monohydrát laktosy	
Sodná sůl kroskarmelosy	
Povidon	
Magnesium-stearát	
Žlutý oxid železitý (E 172)	0,12 mg
Potah:	
Polyvinylalkohol	
Mastek	
Oxid titaničitý (E 171)	2,86 mg
Glycerol-monooctanodekanoát	
Natrium-lauryl-sulfát	
Žlutý oxid železitý (E 172)	0,11 mg
Černý oxid železitý	25 µg
Červený oxid železitý (E 172)	6 µg

Béžová potahovaná tableta kulovitého tvaru

3. KLINICKÉ INFORMACE

3.1 Cílové druhy zvířat

Koně (kteří nejsou určeni pro lidskou spotřebu).

3.2 Indikace pro použití pro každý cílový druh zvířat

Symptomatická léčba klinických příznaků spojených s dysfunkcí pars intermedia hypofýzy (PPID) (Cushingův syndrom u koní).

3.3 Kontraindikace

Nepoužívat u koní se známou přecitlivělostí na pergolid-mesylát nebo jiné námelové deriváty nebo na některou z pomocných látek.

Nepoužívat u koní mladších 2 let.

3.4 Zvláštní upozornění

Ke stanovení diagnózy PPID je nutné provést vhodné endokrinologické laboratorní testy společně s vyhodnocením klinických příznaků.

3.5 Zvláštní opatření pro použití

Zvláštní opatření pro bezpečné použití u cílových druhů zvířat:

Protože je většina případů PPID diagnostikována u starších koní, vyskytují se u nich často i jiné patologické procesy. Sledování a frekvence testování viz bod 3.9.

Zvláštní opatření pro osobu, která podává veterinární léčivý přípravek zvířatům:

Tento přípravek může vyvolat hypersenzitivní (alergické) reakce. Lidé se známou přecitlivělostí na pergolid nebo jiné námelové deriváty by se měli vyhnout kontaktu s veterinárním léčivým přípravkem.

Tento přípravek může způsobovat nežádoucí účinky kvůli sníženým hladinám prolaktinu, což představuje mimořádné riziko pro těhotné a kojící ženy. Těhotné nebo kojící ženy by se měly vyhnout kontaktu s pokožkou nebo kontaktu rukou s ústy a při podávání přípravku by měly používat rukavice.

Náhodné požití, zejména dětmi, může způsobit nežádoucí účinky, jako je zvracení, závratě, letargie nebo nízký krevní tlak. Aby nedošlo k náhodnému požití, vložte blistr do krabičky a pečlivě jej uschovejte mimo dosah dětí. Zabraňte kontaktu rukou s ústy. Při používání tohoto přípravku nejezte, nepijte ani nekuřte. V případě náhodného požití vyhledejte ihned lékařskou pomoc a ukažte příbalovou informaci nebo etiketu praktickému lékaři.

Tento přípravek může vyvolat podráždění oka. Při manipulaci s tabletami zabraňte kontaktu s očima, včetně kontaktu rukou s očima. Při rozpouštění tablet minimalizujte expoziční rizika, např. tablety nedrťte. V případě kontaktu rozpuštěného přípravku s kůží opláchněte exponovanou kůži vodou. V případě vniknutí do očí ihned vypláchněte zasažené oko vodou a vyhledejte lékařskou pomoc.

Po použití si umyjte ruce.

Zvláštní opatření pro ochranu životního prostředí:

Neuplatňuje se.

3.6 Nežádoucí účinky

Koně:

Vzácné (1 až 10 zvířat / 10 000 ošetřených zvířat):	Inapetence, anorexie ¹ , letargie ¹ . Příznaky centrální nervové soustavy ² (např. deprese ² , ataxie ²). Průjem, kolika
Velmi vzácné (< 1 zvíře / 10 000 ošetřených zvířat, včetně ojedinělých hlášení):	Pocení

¹ přechodná

² mírné

Hlášení nežádoucích účinků je důležité. Umožňuje nepřetržité sledování bezpečnosti veterinárního léčivého přípravku. Hlášení je třeba zaslat, pokud možno, prostřednictvím veterinárního lékaře, buď držiteli rozhodnutí o registraci, nebo jeho místnímu zástupci, nebo příslušnému vnitrostátnímu orgánu prostřednictvím národního systému hlášení. Podrobné kontaktní údaje naleznete v bodě 'Kontaktní údaje' příbalové informace.

3.7 Použití v průběhu březosti, laktace nebo snášky

Březost:

Použit pouze po zvážení poměru terapeutického prospěchu a rizika příslušným veterinárním lékařem. Bezpečnost tohoto veterinárního léčivého přípravku nebyla prokázána u březích klisen. Laboratorní studie u myši a králíků nepodaly důkaz o teratogenních účincích. U myši byla zjištěna snížená plodnost při dávce 5,6 mg/kg živé hmotnosti denně.

Laktace:

Použití se nedoporučuje u lakujících klisen, u nichž nebyla prokázána bezpečnost tohoto veterinárního léčivého přípravku. U myši byla snížena živá hmotnost a míra přežití potomstva přisouzena farmakologické inhibici vylučování prolaktinu, mající za následek selhání laktace.

3.8 Interakce s jinými léčivými přípravky a další formy interakce

Používat s opatrností v případě, že je veterinární léčivý přípravek podáván společně s jinými léčivy, o nichž je známo, že ovlivňují vazbu na bílkoviny.

Nepodávejte souběžně s antagonisty dopaminu, jako jsou neuroleptika (fenothiaziny – např. acepromazin), domperidon nebo metoklopramid, protože tyto mohou snižovat účinnost pergolidu.

3.9 Cesty podání a dávkování

Perorální podání, jednou denně.

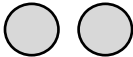
Pro snazší podání by požadovaná denní dávka měla být dána do malého množství vody anebo smíchána s melasou nebo jiným sladidlem a míchána, dokud se nerozpustí. V tomto případě je zapotřebí rozpuštěné tablety podávat injekční stříkačkou. Celé množství je potřeba podat okamžitě. Tablety nedrtit, viz bod 4.5.

Počáteční dávka

Počáteční dávka je přibližně 2 µg pergolidu/kg (rozpětí dávky: 1,3 až 2,5 µg/kg; viz tabulka níže). Udržovací dávka by pak měla být titrována podle individuální odezvy stanovené sledováním (viz níže), což vede k průměrné udržovací dávce 2 µg pergolidu/kg živé hmotnosti s rozpětím od 0,6 až 10 µg pergolidu/kg živé hmotnosti.

Počáteční dávky se doporučují následující:

Živá hmotnost koně	0,5 mg tableta		1 mg tableta	2 mg tableta	Počáteční dávka	Rozpětí dávky
200 – 400 kg					0,5 mg	1,3 – 2,5 µg/kg
401 – 600 kg					1,0 mg	1,7 – 2,5 µg/kg
nebo						

401 – 600 kg					1,0 mg	1,7 – 2,5 µg/kg
601 – 850 kg		+			1,5 mg	1,8 – 2,5 µg/kg
nebo						
601 – 850 kg					1,5 mg	1,8 – 2,5 µg/kg
851 – 1000 kg					2,0 mg	2,0 – 2,4 µg/kg
nebo						
851 – 1000 kg					2,0 mg	2,0 – 2,4 µg/kg

Udržovací dávka

U této nemoci se předpokládá celoživotní léčba.

Většina koní reaguje na léčbu a je stabilizována při průměrné dávce 2 µg pergolidu/kg živé hmotnosti. Klinické zlepšení u pergolidu je očekáváno během 6 až 12 týdnů. Koně mohou na léčbu klinicky odpovídat při nižších nebo proměnlivých dávkách, a proto se doporučuje titrovat na nejnižší účinnou dávku na základě individuální odezvy na léčbu, zdali je účinná nebo nese známky intolerance. Někteří koně mohou požadovat dávku až 10 µg pergolidu/kg živé hmotnosti denně. V těchto vzácných situacích se doporučuje vhodné dodatečné sledování.

Po počáteční diagnóze opakujte endokrinologické testování pro titraci dávky a sledování léčby v intervalech 4 až 6 týdnů, dokud nedojde ke stabilizaci nebo zlepšení klinických příznaků nebo výsledků laboratorních testů.

Pokud se během prvních 4 až 6 týdnů klinické příznaky nebo výsledky laboratorních testů nezlepší, celková denní dávka může být zvýšena o 0,50 mg. V případě, že se klinické příznaky zlepší, ale nebudou zatím optimální, může se veterinární lékař rozhodnout dávku titrovat či netitrovat s ohledem na individuální odpověď/toleranci dávky.

Dokud klinické příznaky nebudou adekvátně potlačeny (klinické hodnocení a/nebo laboratorní testy), doporučuje se zvyšovat celkovou denní dávku v přírůstcích 0,5 mg (pokud bude léčivo v této dávce snášeno) každé 4 až 6 týdnů, dokud nedojde ke stabilizaci. Pokud se objeví známky intolerance dávky, léčbu je nutné ukončit na 2 až 3 dny a znovu poté obnovit na polovině předchozí dávky. Celková denní dávka pak může být zpětně titrována na požadovaný klinický účinek v přírůstcích 0,5 mg každé 2 až 4 týdny. Pokud dojde k vynechání dávky, další plánovanou dávku je nutno podat podle předpisu.

Po stabilizaci je nutné provádět pravidelná klinická vyšetření a laboratorní testy každých 6 měsíců za účelem sledování léčby a dávky. Pokud není žádná zjevná odezva na léčbu, měla by být diagnóza přehodnocena.

3.10 Příznaky předávkování (a kde je relevantní, první pomoc a antidota)

Informace nejsou k dispozici.

3.11 Zvláštní omezení pro použití a zvláštní podmínky pro použití, včetně omezení používání antimikrobních a antiparazitárních veterinárních léčivých přípravků, za účelem snížení rizika rozvoje rezistence

Neuplatňuje se.

3.12 Ochranné lhůty

Nepoužívat u koní, jejichž maso je určeno pro lidskou spotřebu.

Kůň ošetřený tímto přípravkem nesmí být již nikdy určen pro lidskou spotřebu.

Kůň musí být prohlášen za nezpůsobilého pro lidskou spotřebu podle národní legislativy o průkazech pro koně.

Nepoužívat u klisen, jejichž mléko je určeno pro lidskou spotřebu.

4. FARMAKOLOGICKÉ INFORMACE

4.1 ATCvet kód: QN04BC02

4.2 Farmakodynamika

Pergolid je syntetický námelový derivát, který je silný, dlouhodobě působící agonista receptoru dopaminu. Farmakologické studie jak *in vitro*, tak *in vivo*, prokázaly aktivitu pergolidu jakožto selektivního agonisty dopaminu s malým nebo žádným účinkem na dráhy norepinefrinu, epinefrinu nebo serotoninu v terapeutických dávkách. Stejně jako u jiných agonistů dopaminu pergolid inhibuje uvolňování prolaktinu. U koní s dysfunkcí pars intermedia hypofýzy (PPID) pergolid uplatňuje svůj terapeutický účinek stimulací dopaminových receptorů. Dále se u koní s PPID prokázalo, že snižují plazmové hladiny ACTH, MSH a jiných proopiomelanokortinových peptidů.

4.3 Farmakokinetika

Farmakokinetické informace u koně jsou dostupné pro perorální dávky 2, 4 a 10 µg pergolidu/kg živé hmotnosti. Bylo prokázáno, že pergolid je rychle absorbován s krátkou dobou dosažení maximální koncentrace.

Maximální koncentrace (C_{max}) po dávce 10 µg/kg byly nízké a proměnlivé s průměrem 4 ng/ml a průměrným terminálním poločasem ($T_{1/2}$) ~ 6 hodin. Střední doba maximální koncentrace (T_{max}) byla ~ 0,4 hodiny a plocha pod křivkou (AUC) byla ~ 14 ng x hodiny/ml.

V citlivější analytické zkoušce byly koncentrace v plazmě po dávce 2 µg pergolidu/kg velmi nízké a proměnlivé s maximální koncentrací v rozsahu od 0,138 do 0,551 ng/ml. Maximální koncentrace byly dosaženy za 1,25 +/- 0,5 hodiny (T_{max}). Koncentrace v plazmě u většiny koní byly měřitelné pouze 6 hodin po podání dávky. Avšak jeden kůň měl měřitelné koncentrace po dobu 24 hodin. Terminální poločasy nebyly vypočítány, protože u většiny koní nebyla křivka závislosti koncentrace v plazmě na čase úplně ujasněna.

Maximální koncentrace (C_{max}) po dávce 4 µg/kg byly nízké a proměnlivé s rozpětím od 0,4 – 4,2 ng/ml s průměrem 1,8 ng/ml a průměrným terminálním poločasem ($T_{1/2}$) ~ 6 hodin. Střední doba maximální koncentrace (T_{max}) byla ~ 0,6 hodiny a AUC byla ~ 3,4 ng x hodiny/ml.

Pergolid-mesy lát je u lidí a laboratorních zvířat přibližně z 90 % vázán na plazmatické bílkoviny. Je vylučován ledvinami.

5. FARMACEUTICKÉ ÚDAJE

5.1 Hlavní inkompatibility

Neuplatňuje se.

5.2 Doba použitelnosti

Doba použitelnosti veterinárního léčivého přípravku v neporušeném obalu: 30 měsíců.

5.3 Zvláštní opatření pro uchovávání

Uchovávejte v původním obalu, aby byl přípravek chráněn před světlem.

5.4 Druh a složení vnitřního obalu

PVC/PE/PVDC-hliníkový blistr obsahující 10 tablet.

OPA/hliník/PVC-hliníkový blistr obsahující 10 tablet.

Papírová krabička s 10, 30, 60, 90, 100, 120, 160 nebo 240 tabletami.

Na trhu nemusí být všechny velikosti balení.

5.5 Zvláštní opatření pro likvidaci nepoužitých veterinárních léčivých přípravků nebo odpadů, které pochází z těchto přípravků

Léčivé přípravky se nesmí likvidovat prostřednictvím odpadní vody či domovního odpadu.

Všechny nepoužité veterinární léčivé přípravky nebo odpady, které pochází z tohoto přípravku, likvidujte odevzdáním v souladu s místními požadavky a národními systémy sběru, které jsou platné pro příslušný veterinární léčivý přípravek.

6. JMÉNO DRŽITELE ROZHODNUTÍ O REGISTRACI

Alfasan Nederland BV

7. REGISTRAČNÍ ČÍSLO(A)

96/036/21-C

8. DATUM PRVNÍ REGISTRACE

Datum první registrace: 18. 8. 2021

9. DATUM POSLEDNÍ AKTUALIZACE SOUHRNU ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

Květen 2023

10. KLASIFIKACE VETERINÁRNÍCH LÉČIVÝCH PŘÍPRAVKŮ

Veterinární léčivý přípravek je vydáván pouze na předpis.

Podrobné informace o tomto veterinárním léčivém přípravku jsou k dispozici v databázi přípravků Unie (<https://medicines.health.europa.eu/veterinary>).

Podrobné informace o tomto veterinárním léčivém přípravku naleznete také v národní databázi (<https://www.uskvbl.cz>).