

VETERINĀRO ZĀĻU APRAKSTS

V/NRP/03/1618

1. VETERINĀRO ZĀĻU NOSAUKUMS

Galastop 50 µg/ml šķīdums iekšķīgai lietošanai suņiem

2. KVALITATĪVAIS UN KVANTITATĪVAIS SASTĀVS

1 ml satur:

Aktīvā viela:

Kabergolīns 50 µg

Palīgvielas:

Pilnu palīgvielu sarakstu skatīt 6.1. apakšpunktā.

3. ZĀĻU FORMA

Šķīdums iekšķīgai lietošanai.

Bāli dzeltens, viskozs šķīdums.

4. KLĪNISKĀ INFORMĀCIJA

4.1 Mērķa sugas

Suņi.

4.2 Lietošanas indikācijas, norādot mērķa sugas

Viltus grūsnības ārstēšanai kucēm.

Kabergolīns kavē prolaktīna sekrēciju, tādēļ ātri tiek novērstas viltus grūsnības pazīmes, ieskaitot laktāciju un uzvedības maiņu.

Laktācijas nomākšanai kucēm.

Laktācijas nomākšana kucēm var būt nepieciešama noteiktos klīniskos gadījumos, piemēram, pēc kucēnu atņemšanas tūlīt pēc dzemdībām vai pēc agrīnas kucēnu atšķiršanas.

Kabergolīns kavē prolaktīna sekrēciju, kā rezultātā tiek novērsta laktācija un piena dziedzeru izmērs samazinās.

4.3 Kontrindikācijas

Nelietot grūsniem dzīvniekiem, jo zāles var izraisīt abortu.

Ārstētiem dzīvniekiem Galastop var izraisīt īslaicīgu hipotensiju. Nelietot vienlaicīgi ar hipotensīvām zālēm. Nelietot tieši pēc ķirurģiskām manipulācijām, kamēr dzīvnieks vēl ir anestēzijas līdzekļu iedarbībā.

Nelietot kopā ar dopamīna antagonistiem.

Nelietot gadījumos, ja konstatēta pastiprināta jutība pret aktīvo vielu vai kādu no palīgvielām.

4.4 Īpaši brīdinājumi katrai mērķa sugai

Papildus ārstēšanai jāierobežo dzīvniekam pieejamais ūdens daudzums, ogļhidrātu uzņemšana un fiziskās aktivitātes.

4.5 Īpaši piesardzības pasākumi lietošanā

Īpaši piesardzības pasākumi, lietojot dzīvniekiem

Kabergolīns var izraisīt abortu kucēm grūsnības vēlīnā periodā, tāpēc nelietot Galastop grūsnām kucēm (skatīt 4.3. apakšpunktu).

Kabergolīns var izraisīt īslaicīgu hipotensiju ārstēšanas laikā. Lietojot Galastop dzīvniekiem vienlaicīgi ar hipotensīvajiem līdzekļiem vai tieši pēc ķirurģiskas iejaukšanās, kamēr dzīvnieks vēl atrodas anestēzijas līdzekļu iedarbībā, rezultātā var rasties nopietnāka hipotensija. Tādēļ šāda lietošana ir kontrindicēta.

Īpaši piesardzības pasākumi, kas jāievēro personai, kura lieto veterinārās zāles dzīvnieku ārstēšanai

Pēc lietošanas mazgāt rokas.

Izvairīties no saskares ar ādu un acīm. Pēc nejaušas saskares ar ādu vai iekļūšanas acīs, skarto vietu skalot ar lielu ūdens daudzumu.

Sievietes reproduktīvā vecumā un sievietes, kuras baro bērnu ar krūti, nedrīkst strādāt ar šīm zālēm vai zāļu ievadīšanas laikā viņām jālieto aizsargcimdi.

Personām ar pastiprinātu jutību pret kabergolīnu vai pret kādu citu zāļu sastāvdaļu vajadzētu izvairīties no saskares ar šīm veterinārajām zālēm.

4.6 Iespējamās blakusparādības (biežums un bīstamība)

Grūsnība

Eksperimentālie dati liecina, ka kabergolīns spēj izraisīt abortu kucēm vēlīnajā grūsnības posmā, tāpēc Galastop grūsnām kucēm ir kontrindicēts (skat. 4.7.apakšpunktu).

Hipotensija:

Eksperimentālie dati liecina, ka kabergolīns var izraisīt hipotensīvu efektu. Šo blakusparādību nevar uzskatīt kā nevēlamu blakusparādību pēc klīniskas lietošanas, jo iedarbības pakāpe nav liela un nav sagaidāma veseliem dzīvniekiem.

Tomēr, ja dzīvniekiem ir zems asinsspiediens cita iemesla dēļ (piemēram, vienlaicīga hipotensīvo līdzekļu lietošana, anestēzijas vielu ietekme), kabergolīns var izraisīt blakusparādību, tāpēc tiek iekļauts brīdinājums par Galastop lietošanu šādos apstākļos (skat. 4.5. apakšpunktu).

Vemšana

Klīniskajos pētījumos tika pierādīts, ka kabergolīns var izraisīt vemšanu suņiem. Šī iedarbība ir atkarīga no devas, tā ir izteikta devā no 10µg/kg un vairāk (ED₅₀ – izsauc vemšanu 50% suņiem – rēķinot uz 19 µg/kg).

Klīniskajos pētījumos no 361 ārstētajām kucēm 28 kucēm (8%) novēroja vemšanu un 58 kucēm (16%) novēroja anoreksiju.

Vairākumā gadījumos blakusparādības ir īslaicīgas un maznozīmīgas, kuras parādās pēc vienas vai divām ārstēšanas reizēm. Tikai 3 kucēm klīniskajos pētījumos (mazāk nekā 1%), ārstēšanu apturēja vemšanas dēļ.

Dažos gadījumos pirmajās 2 dienās pēc ārstēšanas novēroja miegainību.

4.7 Lietošana grūsnības, laktācijas vai dēšanas laikā

Galastop var izraisīt abortu vēlīnās grūsnības stadijās un to nedrīkst lietot grūsniem dzīvniekiem.

Galastop ir indicēts laktācijas nomākšanai: kabergolīna radītā prolaktīna sekrēcijas inhibīcija izraisa pēkšņu laktācijas pārtraukšanos un piena dziedzeru samazināšanos. Zāles nedrīkst lietot laktējošiem dzīvniekiem, ja vien nav nepieciešama laktācijas nomākšana.

4.8 Mijiedarbība ar citām zālēm un citi mijiedarbības veidi

Nav pieejama informācija par šo zāļu drošumu un iedarbīgumu, ja to lieto kopā ar citām veterinārajām zālēm. Kabergolīna darbības mehānisma pamatā ir tieša iedarbība uz dopamīna receptoriem. Nelietot

Galastop vienlaicīgi ar zālēm, kurām piemīt dopamīna antagonistiskas īpašības (fenotiazīni, butirofenoni), tas var samazināt laktācijas nomākuma efektu.

4.9 Devas un lietošanas veids

Iekšķīgai lietošanai tieši mutē vai sajaucot ar barību.
Šķīdumu ievadīt ar pipeti vai šļirci.

Deva ir 0,1 ml/kg ķermeņa svara (atbilst 5µg kabergolīna/kg ķermeņa svara) vienu reizi dienā 4-6 dienas pēc kārtas, atkarībā no klīnisko simptomu smaguma pakāpes.

Suņiem ar ķermeņa svaru līdz 5 kg ieteicams devu noteikt pilienos, 3 pilieni atbilst 0,1 ml.
Ja pēc ārstēšanas kursa simptomi neizzūd vai tie atjaunojas ārstēšanas beigās, ārstēšanas kursu var atkārtot.

Viltus grūsnības ārstēšanas klīniskie izmeklējumi parāda, ka zāļu efektivitāte ir 80-100%. Uzvedības pazīmes tiek nomāktas pirmās, kam seko piena dziedzeru lieluma samazināšanās un laktācijas izbeigšanās.

4.10 Pārdozēšana (simptomi, rīcība ārkārtas situācijā, antidoti), ja nepieciešams

Klīniskajos pētījumos tika pierādīts, ka Galastop pārdozēšana var palielināt vemšanas iespējamību pēc ārstēšanas un, iespējams, arī hipotensijas iespējamību pēc ārstēšanas.
Jāveic vispārēji atbalsta pasākumi, lai izvadītu neabsorbētās zāles un uzturētu asinsspiedienu, ja nepieciešams. Maz ticams, ka dopamīna antagonistu būs nepieciešami, bet to nevar izslēgt.

4.11 Ierobežojumu periods(-i) dzīvnieku produkcijas izmantošanā

Nav piemērojams.

5. FARMAKOLOĢISKĀS ĪPAŠĪBAS

Farmakoterapeitiskā grupa: prolaktīna inhibitori.
ATĶ vet kods: QG02CB03.

5.1 Farmakodinamiskās īpašības

Kabergolīns ir prolaktīna inhibitors, kas pieder ergolīna atvasinājumu grupai ar dopamīna antagonista aktivitāti.

Kabergolīna farmakodinamika tika pētīta dažādos *in vitro* un *in vivo* pētījumos. Svarīgākie slēdzieni ir sekojoši:

- Kabergolīns ir spēcīgs prolaktīna inhibitors (caur hipofīzes priekšējo daivu), un tādēļ procesi, ko regulē prolaktīns, piemēram, laktācija tiek kavēti. Maksimālā inhibīcija tiek sasniegta pēc 4-8 stundām un ilgst vairākas dienas atkarībā no lietotās devas. Kabergolīna antiprolaktīnā darbība turpinās ilgāk kā metergolīna, bromokriptīna un pergolīda darbība.
- Kabergolīna darbības mehānisma pamatā ir tieša iedarbība uz hipofīzes laktotrofo šūnu dopamīna receptoriem, šī mijiedarbība ir pastāvīga.
- Kabergolīnam nepiemīt cita iedarbība uz endokrīno sistēmu, tas tikai inhibē prolaktīna sekrēciju.
- Kabergolīns centrālajā nervu sistēmā darbojas kā dopamīna agonists, selektīvi mijiedarbojoties ar dopamīnerģiskajiem D₂ receptoriem.
- Kabergolīnam ir zināma līdzība ar noradrenerģiskiem receptoriem, bet tas neietekmē noradrenālīna vai serotonīna metabolismu.
- Attiecībā uz citiem ergolīna derivātiem, kabergolīnam piemīt emētisks efekts (līdzīgs pēc potences ar pergolīdu un bromokriptīnu).

- Ievadot parenterāli vai lielās devās iekšķīgi, kabergolīns var pazemināt asinsspiedienu.

5.2 Farmakokinētiskie dati

Farmakokinētiskie pētījumi tika veikti gan žurkām, gan suņiem. Žurkām tika dots radio-iezīmēts kabergolīns, dodot iekšķīgi vai intravenozi, devā 0,5 mg/kg ķermeņa svara. Suņiem tika dota dienas deva 80 µg/kg ķermeņa svara (suņi tika ārstēti 30 dienas; farmakokinētisko novērtēšanu veica 1. un 28. dienā).

Absorbciija:

- Absorbciija pēc iekšķīgas lietošanas ir gandrīz pilnīga (žurkām);
- T_{max} = 1 stunda pirmajā dienā un 0,5-2 stundas (vidēji 75 minūtes) 28.dienā (suņiem);
- C_{max} diapazonā no 1140 līdz 3155 pg/ml (vidēji 2147 pg/ml) pirmajā dienā un no 455 līdz 4217 pg/ml (vidēji 2336 pg/ml) 28.dienā (suņiem);
- $AUC_{(0-24\ h)}$ pirmajā dienā no 3896 līdz 10216 pg.h.ml⁻¹ (vidēji 7056 pg.h.ml⁻¹) un 28.dienā no 3231 līdz 19043 pg.h.ml⁻¹ (vidēji 11137 pg.h.ml⁻¹) (suņiem).

Izplatīšanās organismā:

Plazmas koncentrācija audos (AUC) bija augstāka aknām, hipofīzei, virsnierēm, liesai, nierēm, plaušām (260-100), tiem seko olnīcas, dzemde, sirds (50-30). Smadzenēs līmenis ir līdzīgs kā plazmā (žurkām).

Biopieejamība:

* Novērtējot plazmas metabolītu noturību, kopumā četriem metabolītiem (FCE 21589, FCE 21904 un diviem nezināmiem), kas atrodas plazmā, 26% no radio iezīmētā kabergolīna ir neizmainītā veidā 2-48 stundas pēc iekšķīgas lietošanas. Plašāks metabolītu apjoms, kas jau uzrādās pirmajā paraugu ņemšanas laikā (0,5-1,0 stundās), parāda ātru vienmērīgu kabergolīna presistēmiskas izcelsmes biotransformāciju (žurkām).

* Novērtējot izdalītos metabolītus urīnā līdz 24 stundām pēc iekšķīgas lietošanas un intravenozas ievadīšanas, apmēram 25% no izdalītā radioiezīmētā daudzuma sastāda zāles neizmainītā veidā, apmēram 50% 6-ADL (FCE 21589) un atlikušie 25% citi pašlaik nezināmi metabolīti (žurkām).

Eliminācija:

* Plazmas eliminācijas pusperiods suņiem $t_{1/2}$ pirmajā dienā ~ 19 stundas; 28.dienā ~ 10 stundas.

* Eliminācijas pusperiods audiem žurkām: eliminācijas līmenis vairumā audu ($t_{1/2}$ ~ 17 stundas) izņemot hipofīzi, kur izdalīšanās noris īpaši lēni ($t_{1/2}$ ~ 60 stundas).

* Izdalīšanās ceļš žurkām: galvenokārt ar fekālijām; ne vairāk kā 10% ar urīnu.

6. FARMACEITISKĀ INFORMĀCIJA

6.1 Palīgvielu saraksts

Frakcionēta kokosriekstu eļļa (Miglyol 812)

6.2 Būtiska nesaderība

Nelietot maisījumā ar citām veterinārajām zālēm.

6.3 Derīguma termiņš

Veterināro zāļu derīguma termiņš izplatīšanai paredzētā iepakojumā: 3 gadi.

Derīguma termiņš pēc pirmās tiešā iepakojuma atvēršanas: 12 dienas.

6.4 Īpaši uzglabāšanas nosacījumi

Uzglabāt temperatūrā līdz 25°C.

Uzglabāt oriģinālā iepakojumā, lai pasargātu no gaismas.
Sargāt no sasaldēšanas.
Uzglabāt cieši noslēgtu.

6.5 Tiešā iepakojuma veids un saturs

Iepakojuma veidi:

3 ml flakons ar pipeti.
7 ml flakons ar pipeti.
15 ml flakons ar pipeti.

Tiešais iepakojums:

Dzintara krāsas III tipa stikla flakons ar uzskrūvējamu polietilēna vāciņu un caurspīdīgu, graduētu I tipa stikla pipeti.

Sekundārais iepakojums:

Kartona kaste ar vienu 3 ml, 7 ml vai 15 ml flakonu.

Ne visi iepakojuma izmēri var tikt izplatīti.

6.6 Īpaši norādījumi neizlietotu veterināro zāļu vai to atkritumu iznīcināšanai

Jebkuras neizlietotas veterinārās zāles vai to atkritumi jāiznīcina saskaņā ar nacionālajiem tiesību aktiem.

7. REĢISTRĀCIJAS APLIECĪBAS ĪPAŠNIEKS

CEVA SANTE ANIMALE
Z.I. La Ballastiere,
33500 Libourne,
Francija

8. REĢISTRĀCIJAS APLIECĪBAS NUMURS(-I)

V/NRP/03/1618

9. REĢISTRĀCIJAS /PĀRREĢISTRĀCIJAS DATUMS

Pirmās reģistrācijas datums: 16/12/2003
Pēdējās pārreģistrācijas datums: 08/12/2008

10. TEKSTA PĒDĒJĀS PĀRSKATĪŠANAS DATUMS

04/2019

RAŽOŠANAS, IEVEŠANAS, IZPLATĪŠANAS, TIRDZNIECĪBAS, PIEGĀDES UN/VAI LIETOŠANAS AIZLIEGUMS

Recepšu veterinārās zāles.