

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO WETERYNARYJNEGO

2016 09 14

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO WETERYNARYJNEGO

Optivermin, 50 mg + 500 mg, tabletki dla psów i kotów

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 tabletka zawiera:

Substancje czynne:

prazykwantel 50 mg

fenbendazol 500 mg

Wykaz wszystkich substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka.

Białe lub prawie białe, okrągłe, płaskie tabletki z krzyżykiem dzielącym.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Docelowe gatunki zwierząt

Pies, kot.

4.2. Wskazania lecznicze dla poszczególnych docelowych gatunków zwierząt

Preparat jest przeznaczony do zwalczania inwazji pasożytów wewnętrznych u psów i kotów w tym: *Toxocara canis*, *Toxascaris leonina*, *Uncinaria stenocephala*, *Ancylostoma caninum*, *Trichuris vulpis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Dipylidium caninum*, *Taenia spp.*, *Multiceps multiceps*, *Mesocostoides spp.*

4.3. Przeciwwskazania

W związku z uznaniem oksfendazolu (jeden z głównych metabolitów fenbendazolu) za związek potencjalnie teratogeny produktu nie powinno się podawać we wczesnej ciąży.

4.4. Specjalne ostrzeżenia dla każdego z docelowych gatunków zwierząt

Brak

4.5. Specjalne środki ostrożności dotyczące stosowania

Specjalne środki ostrożności dotyczące stosowania u zwierząt

W wypadku likwidowania inwazji *Dipylidium caninum* należy jednocześnie zwalczać pchły.

Lek podaje się wraz z karmą lub bezpośrednio; nie ma specjalnych zaleceń, co do diety w czasie i przed podaniem.

Specjalne środki ostrożności dla osób podających produkt leczniczy weterynaryjny zwierzętom

Brak.

4.6. Działania niepożądane (częstotliwość i stopień nasilenia)

Nie stwierdzono.

4.7. Stosowanie w ciąży, laktacji lub w okresie nieśności

W związku z uznaniem oksfendazolu (jeden z głównych metabolitów fenbendazolu) za związek potencjalnie teratogeny nie powinno się preparatu podawać we wczesnej ciąży. Bezpieczeństwo produktu leczniczego weterynaryjnego stosowanego w czasie laktacji nie zostało określone.

4.8. Interakcje z innymi produktami leczniczymi lub inne rodzaje interakcji

Nieznane.

4.9. Dawkowanie i droga(-i) podawania

Psy, koty.

Jednorazowa dawka prazykwantelu wynosi 5 mg/kg mc. a fenbendazolu 50 mg/kg mc.

Praktycznie podaje się 1 tabletkę/10 kg mc. Zaleca się podawać lek przez 3 kolejne dni.

Lek podaje się wraz z karmą lub bezpośrednio doustnie; nie ma specjalnych zaleceń, co do diety w czasie i przed podaniem leku.

4.10. Przedawkowanie (objawy, sposób postępowania przy udzielaniu natychmiastowej pomocy, odtrutki), jeżeli konieczne

Przy znacznym przedawkowaniu (ponad sześciokrotnym) mogą wystąpić biegunki lub wymioty.

4.11. Okres(-y) karencji

Nie dotyczy.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki przeciworobacze

Kod ATCvet: QP52AA51

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Prazykwantel

Prazykwantel jest syntetyczną pochodną izochinolonopyrazyny. Działa na wszystkie gatunki tasiemców, a także na ich formy larwalne oraz na przywry.

Działanie prazykwantelu polega na wywołaniu spastycznego paralizu mięśni pasożyta spowodowanego depolaryzacją błony komórek mięśniowych. Pierwszym efektem działania jest natychmiastowy spastyczny skurcz mięśni pasożyta oraz gwałtowna wakuolizacja syncytialnej powłoki ciała (tegumentu). Prazykwantel uszkadza normalną funkcję pokrywy ciała, utrudnione jest pobieranie glukozy z otoczenia oraz stymuluje produkcję mleczanów. Błona jest bardziej przepuszczalna dla glukozy i jest bardziej wrażliwa na działanie enzymów proteolitycznych.

Prazykwantel zmniejsza zużycie tlenu przez wągry tasiemców i zahamowanie wycinowywania się wągrów. Następuje odczyn zapalny, który usuwa pasożyty.

Lek jest mniej aktywny przeciw młodocianym formom niż przeciw młodym i dojrzałym pasożytom.

Prazykwantel zwiększa dostępność antygenów pasożyta dla przeciwciał.

Fenbendazol

Fenbendazol należy do benzimidazoli. Spektrum działania obejmuje formy larwalne i dorosłe nicieni żołądkowo-jelitowych i płucnych. Fenbendazol wykazuje działanie jajobójcze.

Benzimidazole przede wszystkim działają poprzez wiązanie się z białkami cytoszkieletu (tubuliną) i blokują w ten sposób tworzenie się mikrotubul, co jest podstawą normalnego funkcjonowania komórek eukariotycznych.

W konsekwencji zablokowania ruchu komórkowych organelli u nicieni, szczególnie zablokowanie transportu ziarnistości sekrecyjnych powoduje ich nadmierne nagromadzenie się w cytoplazmie. Negatywny wpływ takiego gromadzenia się wspomnianych ziarnistości w cytoplazmie może być dwójaki:

1. pozbawienie powierzchni wchłaniającej, 'płaszcz' substancji ochronnych oraz enzymów potrzebnych do trawienia i wchłaniania substancji odżywczych
2. enzymy proteolityczne i hydrolityczne, które są normalnie transportowane w formie nieaktywnej dla uniknięcia autolizy, mogą uaktywnić się i powodować autolizę.

Uszkodzenia są nieodwracalne i w tych komórkach i są letalne dla pasożyta. Komórki gospodarza pozostają nietknięte. Nie do końca jest wyjaśniona różnica wrażliwości komórek gospodarza i pasożyta na działanie leku.

Uzasadnienie połączenia

Podstawowym uzasadnieniem połączenia obu substancji czynnych jest rozszerzenie spektrum działania na pasożyty wewnętrzne psów i kotów: prazykwantel – tasiemce i przywry, fenbendazol – nicienie.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Prazykwantel

Wchłanianie. Tabletki Optivermin zgodnie z normą zakładową w teście rozpuszczania uwalniają po 30 minutach nie mniej niż 90% prazykwantelu.

Psy: po doustnym podaniu prazykwantelu w dawce 5 mg/kg m.c. – t_{max} = 1-2 godziny, C_{max} = 0,239±0,104 ppm.

Koty: doustnym podaniu prazykwantelu w dawce 5 mg/kg m.c. – t_{max} = 1 godzina, C_{max} = 1,018 ± 1,170 ppm.

Stężenie leku i jego metabolitów szybko spada i po 24 godzinach jest już praktycznie niewykrywalne.

Dystrybucja. Lek po wchłonięciu jest wiązany z białkami osocza w 80%. Po doustnym podaniu prazykwantelu obserwowany jest tzw. 'efekt pierwszego przejścia'. Polega ono na szybszym wykrywaniu metabolitów prazykwantelu w osoczu krwi po podaniu doustnym (metabolizowanie zaczyna się już w czasie 'pierwszego przejścia' przez wątrobę) niż po podaniu podskórnym. Po podaniu doustnym lek nie jest znajdowany w płynie mózgowo-rdzeniowym i łożysku. Najwyższa koncentracja prazykwantelu znajdowana jest w wątrobie, nerkach i przewodzie pokarmowym.

Metabolizowanie prazykwantelu zaczyna się 15 minut po podaniu doustnym. U psów rozkładane jest 84% podanej dawki. Osiem godzin po podaniu ilość niezmiennego leku w osoczu wynosi mniej niż 0,1%.

Prazykwantel jest metabolizowany w wątrobie i ulega głównie hydrolizacji – około 50–60% metabolitów stanowią związki z dwiema grupami hydroksylowymi. Głównym metabolitem jest 2-(4-hydroksycykloheksanokarbonylo)-4-okso-1,2,3,6,7,11b-heksahydro-4H-pyrazyno[2,1-a]isochinolina. Metabolity są sprzęgane z kwasem glukuronowym i/lub siarkowym.

Prazykwantel niezmetyabolizowany jest praktycznie niewydalany. Lek ten jest wydalany głównie przez nerki, częściowo z kałem. Metabolity leku są wydalane do przewodu pokarmowego z żółcią i bezpośrednio do śluzówki. Po 24 godzinach od podania doustnego leku nie stwierdza się w organizmie.

Fenbendazol

W testach rozpuszczania preparatu Optivermin po 30 minutach uwalniane jest nie mniej niż 75% fenbendazolu.

Psy: C_{max} = 0,64 µg/ml po dawce 20 mg/kg mc. i 0,47 µg/ml po dawce 100 mg/kg mc., t_{max} odpowiednio po 9,33 h i 3,17 h. Codzienne podawanie fenbendazolu w dawce 20 mg/kg mc.

20

powoduje przedłużone stężenie w osoczu wynoszące około 0,2 µg/ml. AUC (µg/ml h) wynosi odpowiednio dla wyżej wymienionych dawek 9,74 i 7,20.

Fenbendazol jest metabolizowany w wątrobie na drodze sulfoksydacji w wyniku czego powstaje fenbendazol-SO (oksfendazol). Oksfendazol również posiada aktywność przeciwoznacz. W dalszej oksydacji stopniowo oksfendazol jest przetwarzany do sulfonu (fenbendazol-SO₂).

Półokres eliminacji wynosi u psów 12 godzin i nie ma różnic pomiędzy podaniem dożylnym a doustnym. Metabolity i fenbendazol są wydane głównie z kałem i częściowo z moczem.

Wpływ na środowisko

Nie prowadzono badań dotyczących ekotoksyczności preparatu.

Ze względu na fakt, że produkt jest stosowany indywidualnie u zwierząt towarzyszących, przedstawienie danych dotyczących wpływu na środowisko nie jest wymagane.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Sodu laurylosiarczan
Powidon K25
Krospowidon
Magnezu stearynian

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Ponieważ nie wykonano badań dotyczących zgodności, produktu leczniczego weterynaryjnego nie wolno mieszać z innymi produktami leczniczymi.

6.3 Okres ważności

Okres ważności produktu leczniczego weterynaryjnego zapakowanego do sprzedaży: **4 lata**.
Okres ważności po pierwszym otwarciu opakowania bezpośredniego: 90 dni.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

6.5 Rodzaj i skład opakowania bezpośredniego

Pojemnik z HDPE z wieczkiem z LDPE, zawierający 50 tabletek, pakowany pojedynczo w pudełko tekturowe.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania nieużytego produktu leczniczego weterynaryjnego lub pochodzących z niego odpadów

Niewykorzystany produkt leczniczy weterynaryjny lub jego odpady należy unieszkodliwić w sposób zgodny z obowiązującymi przepisami.

7. NAZWA I ADRES PODMIOTU ODPOWIEDZIALNEGO

Vetoquinol Biowet Sp. z o.o.
ul. Kosynierów Gdyńskich 13-14
66-400 Gorzów Wlkp.

Urząd Rejonowy Produktów Leczniczych,
Wyrobów Medycznych i Pożywności Żywnościowych
Al. Jerozolimskie 119 01-223 Warszawa
NIP: 521-02-18-102 REGON: 015240501

au

8. NUMER(-Y) POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

1525/04

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU/DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 29.04. 2004 r.

Data przedłużenia pozwolenia: 19.02.2015 r.

10. DATA OSTATNIEJ AKTUALIZACJI TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO WETERYNARYJNEGO

19.02.2015 r.

ZAKAZ WYTWARZANIA, IMPORTU, POSIADANIA, SPRZEDAŻY, DOSTAWY I/LUB STOSOWANIA

Nie dotyczy.

19.02.2016
Specjalista d/s Rejestracji Leków
Kotwicki P.O.
mgr inż. Radosław Olek