

## 1. ELÄINLÄÄKKEEN NIMI

Separon vet. 40 mg/ml injektioneste, liuos, sialle

## 2. LAADULLINEN JA MÄÄRÄLLINEN KOOSTUMUS

1 millilitra sisältää:

### Vaikuttava aine:

Atsaperoni 40 mg

### Apuaineet:

Natriummetabisulfiitti (E 223) 2,0 mg

Metyyli parahydroksibentsoaatti (E 218) 0,5 mg

Propyyli parahydroksibentsoaatti 0,05 mg

Täydellinen apuaineluettelo, katso kohta 6.1.

## 3. LÄÄKEMUOTO

Injektioneste, liuos.

Kirkas, vaaleankeltainen tai keltainen liuos.

## 4. KLIINiset TIEDOT

### 4.1 Kohde-eläinlaji(t)

Sika

### 4.2 Käyttöaiheet kohde-eläinlajeittain

Neuroleptinen rauhoitusaine sialle:

käytetään aggressiivisesti käyttäytyville eläimille

- uuteen ryhmään yhdistämisen jälkeen
- emakoille (omien porsaiden syöminen)

käytetään stressaantuneille eläimille ja stressin ehkäisyyn

- verenkiertoelimistön stressi
- kuljetukseen liittyvä stressi.

obstetriset tilat

esilääkityksenä paikallis- ja yleisanestesiassa

oireiden lievitykseen eläimillä, joilla on ravitsemuksellinen lihasten surkastuminen.

### 4.3 Vasta-aiheet

Ei saa käyttää kovin kylmissä olosuhteissa, sillä aäreisverenkierron vasodilaation vuoksi voi esiintyä sydän- ja verenkiertoelimistön kollapsia ja hypotermiaa (joita hypotalamuksen lämmönsäätelykeskuksen toiminnan estäminen lisää).

Tätä eläinlääkevalmistetta ei saa käyttää kuljetettaessa tai yhdistettäessä uusiin ryhmiin sikoja, jotka on tarkoitus teurastaa ennen varoajan päättymistä.

Ei saa käyttää tapauksissa, joissa esiintyy yliherkkyttä vaikuttavalle aineelle tai apuaineille.

### 4.4 Erityisvaroitukset kohde-eläinlajeittain

Hoidettujen eläinten on vaikutuksen alkaessa saatava olla yksin rauhallisessa paikassa. Rasvakudokseen annettu injektio saattaa johtaa ilmeisen riittämättömään tehoon. Vietnamilaisilla roikkovatsasioilla on havaittu satunnaisia kuolemantapauksia. Tämän on ajateltu johtuvan injektion antamisesta rasvakudokseen, mikä voi johtaa hitaaseen induktioon, ja herkästi lisäannosten antamiseen sekä mahdolliseen yliannostukseen. On tärkeää, että ohjeissa mainittua annosta ei ylitetä vietnamilaisilla roikkovatsasioilla. Älä anna uutta injektiota, jos eläin ei reagoi aloitusannokseen. Eläimen on toivuttava täydellisesti ennen kuin uusi injektio annetaan eri päivänä.

#### **4.5 Käyttöön liittyvät erityiset varotoimet**

##### Eläimiä koskevat erityiset varotoimet

Ei oleellinen.

Erityiset varotoimenpiteet, joita eläinlääkevalmistetta antavan henkilön on noudatettava  
Atsaperoni, natriumdisulfiitti ja metyyli- ja propyyli-p-hydroksibentsoaatti voivat aiheuttaa yliherkkyysoireita. Henkilöiden, jotka ovat yliherkkiä atsaperonille tai jollekin apuaineista, tulee välttää kosketusta valmisteeseen kanssa.

Tämä valmiste voi ärsyttää ihoa, silmiä ja suun limakalvoja. Vältä valmisteeseen joutumista iholle, silmiin ja suun limakalvoille. Pese mahdolliset roiskeet iholta, silmistä ja suun limakalvoilta välittömästi runsaalla vedellä. Jos ärsytys jatkuu, ota yhteyttä lääkäriin.

Vahinkoinjektio tai aineen nieleminen voi aiheuttaa sedaation. Valmisteen pistämistä itseensä vahingossa on vältettävä. Välttääksesi vahinkoinjektion kuljeta tätä eläinlääkevalmistetta vain ruiskussa, jossa ei ole neulaa. Jos vahingossa injoi itseesi valmistetta, käänny välittömästi lääkärin puoleen ja näytä hänelle pakkausseloste tai myyntipäällys. ÄLÄ AJA AUTOA.

Raskaana olevat naiset eivät saa antaa tätä eläinlääkevalmistetta. Tietoja atsaperonin esiintymisestä imettävien naisten rintamaidossa ei ole. Imettävien naisten pitää käsitellä tätä eläinlääkevalmistetta äärimmäisen varovasti.

Pese kädet käytön jälkeen.

#### **4.6 Haittavaikutukset (yleisyys ja vakavuus)**

Suurimman suositellun annoksen käytön yhteydessä saattaa esiintyä kuolaamista, vapinaa ja läähätystä. Nämä haittavaikutukset häviävät itsestään eikä niistä jää pysyviä vaurioita. Karjuilla voi esiintyä palautuvaa siittimen esiinluiskahdusta.

#### **4.7 Käyttö tiineyden, imetyksen tai muninnan aikana**

Voidaan käyttää tiineyden ja imetyksen aikana.

#### **4.8 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset**

- Atsaperoni vahvistaa kaikkien keskushermostoa lamaavien aineiden ja verenpainetta alentavien aineiden vaikutusta (perifeerisistä  $\alpha$ -adrenolyysistä johtuen).
- Adrenolyyttisten aineiden aiheuttama takykardian voimistuminen.
- Samanaikainen käyttö  $\alpha$ - ja  $\beta$ -sympatomimeettien, kuten esimerkiksi adrenaliinin (epinefriinin), kanssa johtaa matalaan verenpaineeseen eli hypotensioon (adrenaliinin aiheuttama käänteinen muutos).

#### **4.9 Annostus ja antotapa**

Lihakseen.

Saa antaa vain injektiona lihakseen, korvan taakse. Injektiossa on käytettävä pitkää injektioneulaa. Injektio on annettava mahdollisimman lähelle korvaa sen taakse, kohtisuorasti ihoon nähden. Jos injektio annetaan painavalle eläimelle niskaan käyttäen lyhyttä injektioneulaa, vaarana on, että osa lääkkeestä pistetään rasvakudokseen. Tällöin injektion teho voi olla mitätön.

Älä anna uutta injektiota, jos eläin ei reagoi aloitusannokseen. Eläimen on toivuttava täydellisesti ennen kuin uusi injektio annetaan eri päivänä.

Aggressiivinen käytös (toisilleen tuntemattomien sikojen yhdistäminen samaan ryhmään, omien porsaiden syöminen), porsiminen

2 mg atsaperonia/painokilo (ts. 1 ml valmistetta 20 kg:n ruumiinpainoa kohti)

#### Stressi

– Verenkiertoelimistön stressi  
0,4 mg atsaperonia/painokilo (ts. 0,2 ml valmistetta 20 kg:n ruumiinpainoa kohti)

– Kuljetukseen liittyvä stressi  
Porsaiden, vieroitettujen porsaiden ja karjujen kuljetus  
1,0 mg atsaperonia/painokilo (ts. 0,5 ml valmistetta 20 kg:n ruumiinpainoa kohti)

Emakoiden ja lihasikojen kuljetus  
0,4 mg atsaperonia/painokilo (ts. 0,2 ml valmistetta 20 kg:n ruumiinpainoa kohti)

Esilääkitys paikallis- ja yleisanestesiassa, ravitsemuksellinen lihassurkastuma

1–2 mg atsaperonia/painokilo (ts. 0,5 - 1 ml valmistetta 20 kg:n ruumiinpainoa kohti)

On käytettävä asianmukaisella asteikolla varustettua ruiskua, jotta tarvittava annostilavuus voidaan antaa tarkasti. Tämä on erityisen tärkeää pieniä määriä injektioitaessa. Valmistetta saa antaa enintään 5 ml yhteen injektiokohtaan.

Karjuille ei pidä antaa yli 1 mg/kg:n annosta, sillä suurempi annos voi aiheuttaa siittimen esiinluiskahduksen, jolloin siitin voi vahingoittua.

Kumitulpan saa lävistää enintään 20 kertaa. Kun samasta injektiopullosta otetaan useita annoksia, on suositeltavaa käyttää aspiraationeulaa tai moniannosruiskua, jotta tulpaa ei lävistettäisi liian usein.

#### **4.10 Yliannostus (oireet, hätätoimenpiteet, vastalääkkeet) (tarvittaessa)**

Yliannostustapauksessa heräämisen yhteydessä voi esiintyä aggressiivista käytöstä. Vietnamilaisilla roikkovatsasioilla toistuva annostus voi johtaa kuolemaan johtuen aloitusannoksen imeytymisestä rasvakudokseen.

#### **4.11 Varoaika (varojat)**

Teurastus: 18 vrk.

### **5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET**

Farmakoterapeuttinen ryhmä: Psykoosilääkkeet, butyrofenonijohdokset, atsaperoni  
ATCvet-koodi: QN05AD90

#### **5.1 Farmakodynamiikka**

Atsaperoni on butyrofenoneihin kuuluva neuroleptinen aine, jota käytetään sioille sen rauhoittavien (sedatiivisten) ja aggressiota lievittävien vaikutusten vuoksi.

Se on keskus- ja ääreishermostoon vaikuttava dopamiinireseptorin salpaaja, joka saa aikaan annosriippuvaisen sedaation. Suuret annokset saavat aikaan ekstrapyramidaalisia motorisia oireita, mukaan lukien katalepsian. Aineen käytön yhteydessä on osoitettu apomorfiini-antagonistinen antiemeettinen vaikutus. Hypotalamuksen lämmönsäätelykeskuksen estäminen ja ääreisverisuonten samanaikainen laajeneminen johtavat ruumiinlämmön lievään laskuun. Atsaperoni ehkäisee opiaattien hengityslamaa aiheuttavaa vaikutusta, ja sioille terapeuttisina annoksina annettuna saa aikaan hengityksen syvenemisen. Dopamiinin inhibitorisen vaikutuksen poistaminen lisää prolaktiinin

vapautumista ja pitkäaikaisen annon jälkeen aiheuttaa muutoksia aivolisäkkeessä, naaraiden lisääntymiselimissä ja maitorauhasissa, erityisesti rotilla.

Atsaperoni vaikuttaa myös keskus- ja ääreishermoston noradrenergiseen järjestelmään. Se aiheuttaa lievää bradykardiaa, johon liittyy pienentynyt sydämen minuuttitilavuus, sekä ääreisverisuonten laajenemista, johon liittyy verenpaineen lasku. Suurina pitoisuuksina atsaperoni antagonisoi histamiinia ja serotoniinia.

Sioilla sedaatio kestää 1 - 3 tuntia. Sedaatio ja aggressiota vähentävät vaikutukset alkavat 5 - 10 minuutin kuluessa terapeuttien annosten antamisen jälkeen. Kaikki atsaperonin vaikutukset häviävät 6 - 8 tunnissa.

## 5.2 Farmakokineetiikka

Parenteraalisesti annettuna atsaperoni jakautuu nopeasti elimistöön ja saavuttaa huippupitoisuudet veressä, aivoissa ja maksassa 30 minuutin kuluttua. Aivoissa saavutetut pitoisuudet ovat 2 - 6 kertaa suurempia kuin veressä saavutetut pitoisuudet. Atsaperonin ja sen metaboliittien huippupitoisuus plasmassa saavutetaan 45 minuuttia annoksen antamisen jälkeen. Eliminaatio plasmasta on kaksivaiheinen: atsaperonin puoliintumisajat ovat 20 ja 150 minuuttia, kun mukaan luetaan sen metaboliitit, 1,5 tuntia ja 6 tuntia.

Atsaperoni metaboloituu nopeasti. Neljän tunnin kuluttua ihon alle annostelun jälkeen vain noin 12 % annoksesta on elimistössä muuttumattomana lääkeaineena. Pääasiallinen metaboliitti, atsaperoli, syntyy butanonin pelkistymisen kautta. Useimmissa elimistön kudoksissa atsaperolin pitoisuus on suurempi kuin atsaperonin, kun taas atsaperonin pitoisuus on suurempi injektio kohdassa. Muita aineenvaihduntareittejä sioilla ovat pyridiini-ryhmän hydroksylaatio ja oksidatiivinen dearylaatio, mikä voi johtaa piperatsiinirenkään N-formylaatioon. Metaboliittimallit ovat samanlaisia elimistön kaikissa eri kudoksissa, vaikka injektio kohdassa havaittiin vain atsaperonia ja atsaperolia.

Atsaperolin sedatiivinen vaikutus on noin ¼ atsaperonin sedatiivisesta vaikutuksesta ja sen ruumiinlämpöä laskeva vaikutus noin 1/30 atsaperonin vastaavasta vaikutuksesta.  $\alpha$ -(4-fluorofenyyli)-1-piperatsiinibutanonin neuroleptinen vaikutus on noin 1/10 atsaperonin neuroleptisestä vaikutuksesta.

Sen jälkeen, kun atsaperonia annostellaan sioille terapeuttisina annoksina, annoksesta 70 – 90 % erittyy 48 tunnin aikana munuaisten kautta ja 1 – 6 % vastaavasti ulosteen kautta.

## 6. FARMASEUTTISET TIEDOT

### 6.1 Apuaineet

Natriummetabisulfiitti (E 223)  
Metyyliparahydroksibentsoaatti (E 218)  
Propyyli parahydroksibentsoaatti  
Viinihappo  
Natriumhydroksidi (pH:n säätämistä varten)  
Injektionesteisiin käytettävä vesi

### 6.2 Tärkeimmät yhteensopimattomuudet

Koska yhteensopimattomuustutkimuksia ei ole tehty, tätä eläinlääkevalmistetta ei saa sekoittaa muiden eläinlääkevalmisteiden kanssa.

### 6.3 Kestoaika

Avaamattoman 100 ml:n pakkauksen kesto aika: 3 vuotta.  
Avaamattoman 50 ml:n pakkauksen kesto aika: 2 vuotta.  
Sisäpakkauksen ensimmäisen avaamisen jälkeinen kesto aika: 28 vuorokautta.

### 6.4 Säilytystä koskevat erityiset varotoimet

Ei erityisiä säilytysohjeita.

### **6.5 Pakkaustyyppi ja sisäpakkauksen kuvaus**

Kirkas lasinen tyyppin I (Ph. Eur.) injektiopullo, jossa on tyyppin I (Ph. Eur.) klorobutyylikumitulppa ja alumiininen irti vedettävä korkki tai alumiininen/muovinen repäisykorkki.

Pakkauskoko: Pahvikotelo 1 x 50 ml, 1 x 100 ml

Kaikkia pakkauskokoja ei välttämättä ole markkinoilla.

### **6.6 Erityiset varotoimet käyttämättömien lääkevalmisteiden tai niistä peräisin olevien jätemateriaalien hävittämiselle**

Käyttämättömät eläinlääkevalmisteet tai niistä peräisin olevat jätemateriaalit on hävitettävä paikallisten määräysten mukaisesti.

## **7. MYYNTILUVAN HALTIJA**

Richter Pharma AG, Feldgasse 19, 4600 Wels, Itävalta

## **8. MYYNTILUPIEN NUMERO(T)**

MTnr. 36458

## **9. ENSIMMÄISEN MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ / UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

Ensimmäisen myyntiluvan myöntämispäivämäärä:

## **10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

12.10.2021

## **MYYNTIÄ, TOIMITTAMISTA JA/TAI KÄYTTÖÄ KOSKEVA KIELTO**

Ei oleellinen.

## PRODUKTRESUMÉ

### 1. DET VETERINÄRMEDICINSKA LÄKEMEDLETS NAMN

Separon vet. 40 mg/ml injektionsvätska, lösning för svin

### 2. KVALITATIV OCH KVANTITATIV SAMMANSÄTTNING

1 milliliter innehåller:

#### Aktiv substans:

Azaperon 40 mg

#### Hjälpämnen:

Natriummetabisulfid (E223) 2,0 mg  
Metylparahydroxibensoat (E218) 0,5 mg  
Propylparahydroxibensoat 0,05 mg

För fullständig förteckning över hjälpämnen, se avsnitt 6.1.

### 3. LÄKEMEDELSFORM

Injektionsvätska, lösning.

Klar, ljusgul till gul lösning.

### 4. KLINISKA UPPGIFTER

#### 4.1 Djurslag

Svin

#### 4.2 Indikationer, med djurslag specificerade

Ett sederande neuroleptikum för svin:

För användning till djur med aggressivt beteende

- efter omgruppering
- till suggor (suggan biter ihjäl kultingarna)

För användning till stressade djur och för att förebygga stress

- kardiovaskulär stress
- transportrelaterad stress

Obstetrik konditioner

Som premedicinering vid lokal anestesi eller narkos

För symtomlindring hos djur med nutritionell muskeldystrofi

#### 4.3 Kontraindikationer

Använd inte vid mycket kalla förhållanden eftersom kardiovaskulär kollaps och hypotermi (ökad genom hämning av värmeregleringcentrum i hypotalamus) kan uppkomma på grund av perifer vasodilatation.

Detta läkemedel är kontraindicerat för användning vid transport eller för omgruppering av svin som kommer att slaktas före avslutad karenstid.

Använd inte vid överkänslighet mot den aktiva substansen eller mot något av hjälpämnen.

#### 4.4 Särskilda varningar för respektive djurslag

I väntan på insättande av läkemedlets effekt ska behandlade djur lämnas ensamma i en tyst omgivning. Injektion i fettvävnad kan leda till skenbar otillräcklig effekt.

Enstaka dödsfall har observerats hos vietnamesiska hängbukssvin. Detta tros bero på injektion i fett som leder till långsam induktion och tendens att använda ytterligare doser som leder till överdosering. Det är viktigt att den angivna dosen inte överskrids hos denna ras.

Upprepa inte injektionen om djuret inte responderar på första dosen; avvakta full återhämtning innan re-injektion ges en annan dag.

#### 4.5 Särskilda försiktighetsåtgärder vid användning

##### Särskilda försiktighetsåtgärder för djur

Ej relevant.

##### Särskilda försiktighetsåtgärder för personer som administrerar läkemedlet till djur

Azaperon, natriummetabisulfid och metyl- och propylparahydroxibensoat kan orsaka överkänslighetsreaktioner. Personer som är överkänsliga för azaperon eller något av hjälpämnen ska undvika kontakt med läkemedlet.

Detta läkemedel kan vara irriterande för hud, ögon och munslemhinna. Undvik kontakt med hud, ögon och munslemhinna. Tvätta bort stänk från hud, ögon och munslemhinna omedelbart med rikligt med vatten. Uppsök läkare om irritationen kvarstår.

Oavsiktlig självinjektion eller intag kan leda till sedering. Försiktighet ska iakttas för att undvika oavsiktlig självinjektion. Transportera detta läkemedel endast i spruta utan injektionsnål för att förhindra oavsiktlig självinjektion. Vid oavsiktlig självinjektion, uppsök genast läkare och visa denna information eller etiketten. **KÖR INTE BIL.**

Detta läkemedel bör inte hanteras av gravida kvinnor. Data saknas om förekomst av azaperon i bröstmjölken hos ammande kvinnor. Ammande kvinnor ska hantera läkemedlet med extrem försiktighet.

Tvätta händerna efter användning.

#### 4.6 Biverkningar (frekvens och allvarlighetsgrad)

Salivavsöndring, tremor och flämtning kan uppkomma vid den högsta rekommenderade dosen. Dessa biverkningar försvinner spontant och efterlämnar ingen bestående skada.

Reversibel penisprolaps kan uppkomma hos galtar.

#### 4.7 Användning under dräktighet, laktation eller äggläggning

Kan användas under dräktighet och laktation.

#### 4.8 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner

- Azaperon har en potentiell effekt på alla substanser som är centralt hämmande och substanser som är hypotensiva (på grund av perifer  $\alpha$ -adrenolys).
- Förstärkning av takykardi orsakad av adrenolytiska medel.
- Samtidig användning med  $\alpha$ - och  $\beta$ -sympatomimetiska substanser såsom epinefrin (adrenalin) leder till hypotoni ("adrenalinreversering").

#### 4.9 Dosering och administreringsätt

För intramuskulär användning.

Ges som strikt intramuskulär injektion, bakom örat. En lång injektionsnål ska användas och injektionen ska ges så nära bakom örat som möjligt och vinkelrätt mot huden. Det finns en risk att en del av

läkemedlet injiceras i fett om tunga djur injiceras med en kort nål i nacken. I detta fall kan injektionen ha obetydlig effekt.

Upprepa inte injektionen om djuret inte responderar på första dosen; avvakta full återhämtning innan re-injektion ges en annan dag.

Aggressivt beteende (omgruppering, ihjälbitning av kultingar), obstetrik  
2 mg azaperon/kg kroppsvikt (dvs. 1 ml läkemedel per 20 kg kroppsvikt)

#### Stress

- Kardiovaskulär stress

0,4 mg azaperon/kg kroppsvikt (dvs. 0,2 ml läkemedel per 20 kg kroppsvikt)

- Transportrelaterad stress

Transport av kultingar, avvanda kultingar och galtar

1,0 mg azaperon/kg kroppsvikt (dvs. 0,5 ml läkemedel per 20 kg kroppsvikt)

Transport av sugor och slaktsvin

0,4 mg azaperon/kg kroppsvikt (dvs. 0,2 ml läkemedel per 20 kg kroppsvikt)

Förmedicinering vid lokal anestesi och narkos, nutritionell muskeldystrofi

1 – 2 mg azaperon/kg kroppsvikt (dvs. 0,5-1 ml läkemedel per 20 kg kroppsvikt)

En lämplig graderad spruta måste användas för korrekt administrering av den dosvolym som krävs. Detta är särskilt viktigt vid injektion av små volymer. Administrera högst 5 ml per injektionsställe.

En dos på 1 mg/kg ska inte överskridas hos galtar eftersom en högre dos kan leda till prolaps av penis som därefter kan skadas.

Gummiproppen kan punkteras maximalt 20 gånger. Vid användning av injektionsflaskan flera gånger rekommenderas en aspirationsnål eller en flerdosspruta för att undvika överdriven perforering av proppen

#### **4.10 Överdoser (symptom, akuta åtgärder, motgift), om nödvändigt**

Aggressivt beteende kan uppkomma under uppvaknade vid överdosering.

Upprepad dosering till vietnamesiska hängbukssvin kan leda till dödsfall på grund av absorption av den initiala dosen i fett.

#### **4.11 Karenstid(er)**

Kött och slaktbiprodukter: 18 dygn

### **5. FARMAKOLOGISKA EGENSKAPER**

Farmakoterapeutisk grupp: Neuroleptika, butyrofenonderivat, azaperon.

ATCvet-kod: QN05AD90.

#### **5.1 Farmakodynamiska egenskaper**

Azaperon är ett neuroleptikum av butyrofenontyp som används till svin för dess sedativa och antiaggressiva effekter.

Det är en central och perifer dopaminreceptorblockerare som ger dosrelaterad sedering. Högre doser ger extrapyramidala motoriska symptom inklusive katalepsi. En amorfin-antagonistisk antiemetisk effekt har påvisats. Hämning av värmeregleringscentrum i hypotalamus och samtidig dilatation av perifera blodkärl leder till en liten temperaturminskning. Azaperon motverkar den andningsdepressiva



effekten av opiater och ger djupare andning vid administrering till svin vid terapeutiska doser. Elimineringen av den hämmande effekten av dopamin ger upphov till frisättning av prolaktin och, efter kronisk administrering, till förändringar i hypofysen, reproduktionsorgan och bröstkörtlar hos honor, särskilt hos råttor.

Azaperon har också effekter på det centrala och perifera noradrenerga systemet. Det orsakar lätt bradykardi med nedsatt hjärtminutvolym och dilatation av perifera blodkärl med ett blodtrycksfall. Azaperon motverkar histamin och serotonin vid höga koncentrationer.

Hos svin varar sederingen 1-3 timmar och anslag av sedering och antiaggressiva effekter ses inom 5-10 minuter efter terapeutiska doser. Alla effekter av azaperon har släppt efter 6-8 timmar.

## **5.2 Farmakokinetiska egenskaper**

Parenteralt administrerat azaperon distribueras snabbt och når maximala koncentrationer i blodet, hjärnan och levern efter 30 minuter. De nivåer som nås i hjärnan är 2-6 gånger högre än de i blod. Tiden till maximala plasmakoncentrationer av azaperon och dess metaboliter är 45 minuter efter dos. Eliminering från plasma är bifasisk med halveringstider på 20 och 150 minuter för azaperon och 1,5 och 6 timmar för azaperon inklusive metaboliter.

Azaperon metaboliseras snabbt. Fyra timmar efter subkutan administrering finns bara cirka 12 % av dosen som oförändrat läkemedel. Huvudmetaboliten azaperol produceras genom reduktion av butanon. Dess koncentration är högre än den för azaperon i de flesta kroppsvävnader medan azaperonkoncentrationen är högre vid injektionsstället. Andra metabola vägar hos svin inkluderar hydroxylering av pyridinringen och oxidativ dealkylering, vilka kan leda till N-formylering av piperazinringen. Metabolitmönster var likartade i olika kroppsvävnader medan bara azaperon och azaperol detekterades vid injektionsstället.

Azaperol har cirka ¼ av den sedativa effekten och cirka 1/30 av den temperatursänkande effekten av azaperon och  $\alpha$ -(4-fluorofenyl)-1-piperazin butanon har cirka 1/10 den neuroleptiska effekten av azaperon.

Efter administrering av terapeutiska doser av azaperon till svin utsöndras 70-90 % av dosen inom 48 timmar via njurarna och 1 - 6 % av dosen respektive via feces.

## **6. FARMACEUTISKA UPPGIFTER**

### **6.1 Förteckning över hjälpämnen**

Natriummetabisulfid (E223)  
Metylparahydroxibensoat (E218)  
Propylparahydroxibensoat  
Vinsyra  
Natriumhydroxid (för pH-justering)  
Vatten för injektionsvätskor

### **6.2 Viktiga inkompatibiliteter**

Då blandbarhetsstudier saknas ska detta läkemedel inte blandas med andra läkemedel.

### **6.3 Hållbarhet**

Hållbarhet i oöppnad förpackning 100 ml: 3 år.  
Hållbarhet i oöppnad förpackning 50 ml: 2 år.  
Hållbarhet i öppnad innerförpackning: 28 dagar.

### **6.4 Särskilda förvaringsanvisningar**

Inga särskilda förvaringsanvisningar.

## **6.5 Inre förpackning (förpackningstyp och material)**

Injektionsflaska av klart glas av typ I (Ph. Eur.) med propp av klorobutylgummi av typ I (Ph. Eur.) och snäpplock av aluminium eller aluminium/plast.

Förpackningsstorlek: Kartong med 1 x 50 ml eller 1 x 100 ml  
Eventuellt kommer inte alla förpackningsstorlekar att marknadsföras.

## **6.6 Särskilda försiktighetsåtgärder för destruktions av ej använt läkemedel eller avfall efter användningen**

Ej använt läkemedel och avfall ska kasseras enligt gällande anvisningar.

## **7. INNEHAVARE AV GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING**

Richter Pharma AG, Feldgasse 19, 4600 Wels, Österrike

## **8. NUMMER PÅ GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING**

MTnr. 36458

## **9. DATUM FÖR FÖRSTA GODKÄNNANDE/FÖRNYAT GODKÄNNANDE**

Datum för första godkännandet:

## **10 DATUM FÖR ÖVERSYN AV PRODUKTRESUMÉN**

12.10.2021

## **FÖRBUD MOT FÖRSÄLJNING, TILLHANDAHÅLLANDE OCH/ELLER ANVÄNDNING**

Ej relevant.