

1. ELÄINLÄÄKKEEN NIMI

Prascend 1 mg tabletit hevoselle

2. LAADULLINEN JA MÄÄRÄLLINEN KOOSTUMUS

Yksi tabletti sisältää:

Vaikuttava aine:

1,0 mg pergolidia (1,31 mg pergolidimesilaattina).

Apuaineet:

Apuaineiden ja muiden ainesosien laadullinen koostumus
Kroskarmelloosinatrium
Punainen rautaoksidi (E 172)
Laktoosimonohydraatti
Magnesiumstearaatti
Povidoni K30

Vaaleanpunainen, suorakulmainen, jakouurrettu tabletti, jonka toiselle puolelle on kaiverrettu Boehringer Ingelheimin -logo ja kirjaimet ”PRD”. Tabletti on jaettavissa kahteen yhtä suureen osaan.

3. KLIINISET TIEDOT

3.1 Kohde-eläinlaji(t)

Hevonen (elintarviketuotannosta poissuljettu).

3.2 Käyttöaiheet kohde-eläinlajeittain

Aivolisäkkeen toimintahäiriöön (Pituitary Pars Intermedia Dysfunction, PPID) liittyvien kliinisten oireiden oireenmukainen hoito (hevosen Cushingin tauti).

3.3 Vasta-aiheet

Ei saa käyttää tapauksissa, joissa esiintyy yliherkkyyttä vaikuttavalle aineelle tai muille torajyväjohdannaisille tai apuaineille.

Ei saa käyttää alle 2-vuotiaille hevosille.

3.4 Erityisvaroitukset

PPID-diagnoosin varmistamiseksi tulisi suorittaa asiaan kuuluvat endokrinologiset laboratoriotestit sekä kliinisten oireiden arviointi.

3.5 Käyttöön liittyvät erityiset varotoimet

Erityiset varotoimet, jotka liittyvät turvalliseen käyttöön kohde-eläinlajeilla:

Koska hevosen PPID diagnosoidaan tavallisesti -vanhoilla hevosilla, esiintyy näillä potilailla useasti myös muita sairaudellisia tiloja. Hoidon seurantaan ja testauksen toistamiseen liittyen katso kohta 3.9.

Erityiset varotoimenpiteet, joita eläinlääkettä eläimille antavan henkilön on noudatettava:

Pergolidi, kuten muutkin torajyväjohdannaiset, voi aiheuttaa oksentelua, huimausta, uneliaisuutta tai matalaa verenpainetta.

Vakavia haittatapahtumia, kuten pyörtäminen (kollapsi), on havaittu.

Nieleminen voi olla haitallista ja siihen voi liittyä vakavia haittatapahtumia, erityisesti lapsilla tai ihmisillä, joilla on sydänsairaus. Älä nielaise eläinlääkettä.

Välttääksesi vahingossa tapahtuvan nielemisen riskiä:

- Säilytä ja käsittele tätä eläinlääkettä erillään ihmislääkkeistä ja käsittele tätä erityisellä varovaisuudella.
- Annostelua varten esille otetut tabletit on annettava välittömästi eikä niitä saa jättää valvomatta.

Jos vahingossa nielet eläinlääkettä, käänny välittömästi lääkärin puoleen ja näytä hänelle pakkausseloste tai myyntipäälllys.

Jos vahingossa nielet eläinlääkettä, vältä autolla ajamista ja koneiden käyttämistä.

Lapset eivät saa päästä kosketuksiin tämän eläinlääkkeen kanssa.

Tämän eläinlääkkeen jakaminen voi aiheuttaa silmä-ärsytystä, ärsyttävää hajua tai päänsärkyä. Minimoi altistumisriski tabletteja jakaessa. Tabletteja ei saa murskata. Vältä silmäaltistusta ja inhalaatiota tabletteja käsitellessä.

Henkilöiden, jotka ovat yliherkkiä pergolidille tai muille torajyväjohdannaisille tulee välttää kosketusta eläinlääkkeen kanssa, eivätkä he saa annostella sitä.

Raskaana olevien tai imettävien naisten tulee käyttää suojakäsineitä eläinlääkettä annosteltaessa.

Ihokosketuksen tapahtuessa pese altistunut iho vedellä. Jos pergolidia joutuu silmään, huuhtele altistunut silmä välittömästi vedellä ja käänny lääkärin puoleen. Nenä-ärsytyksessä on siirryttävä raikkaaseen ilmaan ja käännyttävä lääkärin puoleen, jos hengitysvaikeuksia ilmenee.

Pese kädet käytön jälkeen.

Erityiset varotoimet, jotka liittyvät ympäristön suojeluun:

Ei oleellinen.

3.6 Haittatapahtumat

Hevonen (elintarviketuotannosta poissuljettu):

Harvinainen (1–10 eläintä 10 000 hoidetusta eläimestä):	Ruokahaluttomuus; syömättömyys ¹ ; väsymys ¹ Keskushermostohäiriöt (esim. keskushermoston lamaantuminen ja ataksia) ² Ripuli, koliikki
Hyvin harvinainen (< 1 eläin 10 000 hoidetusta eläimestä, yksittäiset ilmoitukset mukaan luettuina):	Hikoilu

¹ Ohimenevä² Lievä

Jos ongelmia annoksen siedettävyydessä ilmenee, hoito on keskeytettävä 2–3 päiväksi, ja sitten aloitettava uudelleen puolella aiemmasta annoksesta. Kokonaispäiväannos voidaan säätää takaisin ylös haluttuun kliiniseen vasteeseen lisäämällä annosta 0,5 mg 2–4 viikon välein.

Haittatapahtumista ilmoittaminen on tärkeää. Se mahdollistaa eläinlääkkeiden turvallisuuden jatkuvan seurannan. Ilmoitukset lähetetään mieluiten eläinlääkärin kautta joko myyntiluvan haltijalle tai sen paikalliselle edustajalle tai kansalliselle toimivaltaiselle viranomaiselle kansallisen ilmoitusjärjestelmän kautta. Katso pakkausselosteesta lisätietoja yhteystiedoista.

3.7 Käyttö tiineyden, laktation tai muninnan aikana

Tiineys:

Voidaan käyttää ainoastaan hoitavan eläinlääkärin hyöty-riskiarvion perusteella. Eläinlääkkeen turvallisuutta tammojen tiineyden aikana ei ole osoitettu. Laboratoriotutkimuksissa hiirillä ja kaneilla ei ole havaittu teratogeenisiä vaikutuksia. Annoksilla 5,6 mg/kg havaittiin hiirillä heikentynyttä hedelmällisyyttä.

Laktaatio:

Käyttöä ei suositella hevosilla laktation aikana, sillä eläinlääkkeen turvallisuutta ei ole sen osalta osoitettu. Hiirillä havaittiin jälkeläisten elopainon laskua ja alentuneita henkiinjäämismääriä prolaktiinin erityksen estymisen aiheuttaman maidontuotannon epäonnistumisen vuoksi.

3.8 Yhteisvaikutukset muiden lääkkeiden kanssa ja muunlaiset yhteisvaikutukset

Varovaisuutta on noudatettava, jos eläinlääkettä annetaan samanaikaisesti muiden proteiinien sitoutumiseen vaikuttavien lääkeaineiden kanssa.

Ei saa antaa samanaikaisesti dopamiiniantagonistien, kuten neuroleptien (fentiatsiinit, esimerkiksi asepromatsiini), domperidonin tai metoklopramidin kanssa, sillä nämä lääkeaineet voivat heikentää pergolidin vaikutusta.

3.9 Antoreitit ja annostus

Suun kautta.

Eläinlääke annetaan kerran päivässä. Annostelua voidaan helpottaa liuottamalla päivittäinen annos pieneen vesimäärään ja/tai sekoittamalla se melassiin tai muuhun makeuttavaan aineeseen, kunnes annos on liuennut. Liuotetut tabletit tulee annostella ruiskulla. Koko lääkemäärä on annosteltava välittömästi. Tabletteja ei saa murskata. Älä käytä eläinlääkettä, jos havaitset pakkauksessa näkyviä vaurioitumisen merkkejä tai läpipainopakkaus on rikkoontunut.

Aloituserä

Aloituserä on 2 mikrog pergolidia elopainokiloa kohden (annosalueella 1,3–2,4 mikrog/kg). Julkaistussa kirjallisuudessa olevissa tutkimuksissa yleisin keskimääräinen annos on 2 mikrog pergolidia/kg vaihteluvälillä 0,6–10 mikrog pergolidia/kg (päivittäinen kokonaisannos 0,25 – 5 mg/hevonen). Aloitusannos (2 mikrog pergolidia/kg) tulisi säätää seurannan osoittaman yksilöllisen vasteen mukaan (ks. alla). Suositellut aloitusannokset ovat:

Hevosien paino	Tablettien lukumäärä	Aloituserä	Annostusalue
200 – 400 kg	½	0,5 mg	1,3 – 2,5 mikrog/kg
401 – 600 kg	1	1,0 mg	1,7 – 2,5 mikrog/kg
601 – 850 kg	1 ½	1,5 mg	1,8 – 2,5 mikrog/kg
851 – 1 000 kg	2	2,0 mg	2,0 – 2,4 mikrog/kg

Ylläpitoannos

Tälle sairaudelle on oletettavissa elinikäinen hoito.

Useimmat hevoset vastaavat hoitoon ja niiden tila vakautuu keskimääräisellä annoksella 2 mikrog/kg. Kliinisen tilan paraneminen on odotettavissa 6–12 viikon sisällä. Hevoset voivat vastata hoitoon alemmalla tai vaihtelevalla annoksella. Annos suositellaan säädettäväksi hoitovasteen perusteella matalimpaan tehokkaaseen annokseen yksilöllisesti tehokkuuden tai siedettävyyden mukaan. Jotkin hevoset saattavat tarvita jopa 10 mikrog pergolidia painokiloa kohti päivässä. Näissä harvinaisissa tapauksissa suositellaan asianmukaista lisäseuranta.

Diagnoosin asettamisen jälkeen endokrinologiset testit on syytä toistaa annoksen säätämiseksi ja lääkityksen vaikutusten tarkkailemiseksi 4-6 viikon välein, kunnes hevosen tila on stabiloitunut tai sen kliiniset oireet ja/tai diagnostisten testien tulokset ovat parantuneet.

Kliinisiin oireisiin kuuluvat: hypertrikoosi, runsastunut virtsaaminen ja juominen, lihasköyhyys, epänormaali rasvan jakautuminen, krooniset tulehdukset, laminiitti, hikoilu jne.

Hoito toteutetaan titraamalla annos hoitovasteeseen perustuen (teho tai haittavaikutukset) yksilöllisesti alhaisimmalle tehoavalle annostasolle. Hoitovasteen saavuttamiseen kuluva aika voi vaihdella yksilöllisesti sairauden vakavuudesta riippuen.

Jos kliiniset oireet tai diagnostisten testien tulokset eivät ole kohentuneet ensimmäisten 4-6 viikon kuluessa, päivittäistä kokonaisannosta voidaan nostaa 0,5 mg. Jos kliiniset oireet ovat kohentuneet jossain määrin, mutta eivät ole vielä täysin normalisoituneet, annoksen nostaminen on eläinlääkärin päätettävissä ottaen huomioon yksilöllisen hoitovasteen/sietokyvyn kyseiseen annostasoon nähden.

Jos kliinisiä oireita ei saada riittävästi hallintaan (kliininen arvio ja/tai diagnostiset testit) on suositeltavaa nostaa päivittäistä kokonaisannosta 0,5 mg 4-6 viikon välein kunnes hevosen tila stabiloituu olettaen, että hevonen sietää kyseisen annoksen. Haittavaikutusoireiden esiintyessä hoito keskeytetään 2-3 päivän ajaksi ja aloitetaan sen jälkeen puolella aikaisemmasta annoksesta. Päivittäinen kokonaisannos voidaan sen jälkeen nostaa vähitellen toivotun kliinisen hoitovasteen tuottaneelle tasolle lisäämällä 2-4 viikon välein 0,5 mg. Jos jokin annos unohtuu antaa, seuraava annos annetaan eläinlääkärin annosteluohjeen mukaan.

Kun hevosen tila on stabiloitunut, säännöllinen kliininen arviointi ja diagnostinen testaus suoritetaan 6 kk välein hoidon ja annoksen tarkkailemiseksi. Jollei toivottua hoitovastetta saavuteta, on diagnoosi arvioitava uudelleen.

3.10 Yliannostuksen oireet (sekä tarvittaessa toimenpiteet hätätilanteessa ja vasta-aineet)

Merkittävän yliannoksen vaikutuksista ei ole tietoa.

3.11 Käyttöä koskevat erityiset rajoitukset ja erityiset käyttöehdot, mukaan lukien mikrobilääkkeiden ja eläimille tarkoitettujen loislääkkeiden käytön rajoitukset resistenssin kehittymisriskin rajoittamiseksi

Ei oleellinen.

3.12 Varoajat

Ei saa käyttää hevosille, jotka on tarkoitettu elintarvikkeeksi.

Hevonen tulee merkitä hevospassiin elintarvikkeeksi kelpaamattomaksi kansallisen lainsäädännön mukaisesti.

Ei saa käyttää tammoille, joiden maitoa käytetään elintarvikkeeksi.

4. FARMAKOLOGISET TIEDOT

4.1 ATCvet-koodi: QN04BC02

4.2 Farmakodynamiikka

Pergolidi on synteettinen torajyväjohdannainen, joka on voimakas ja pitkävaikutteinen dopamiinireseptoriagonisti. Farmakologisissa tutkimuksissa on osoitettu sekä *in vitro* että *in vivo* pergolidin aktiivisuus selektiivisenä dopamiiniagonistina, jolla on hoitoannoksina vähän tai ei lainkaan vaikutusta noradrenaliinin, adrenaliinin tai serotoniinin metaboliareitteihin. Kuten muutkin dopamiiniagonistit, pergolidi estää prolaktiinin vapautumista. Aivolisäkkeen toimintahäiriötä (Pituitary Pars Intermedia Dysfunction, PPID) sairastavilla hevosilla pergolidin vaikutus perustuu dopamiinireseptoristimulaatioon. Pergolidin on lisäksi osoitettu laskevan PPID:tä sairastavilla hevosilla ACTH:n (kortikotropiini), MSH:n (melanosyyttejä stimuloiva hormoni) ja muiden pro-opiomelanokortiinien plasmapitoisuuksia.

4.3 Farmakokinetiikka

Hevosella farmakokinetiikkaa on tutkittu suun kautta annettuna annoksilla 2 mikrog pergolidia/kg ja 10 mikrog pergolidia/kg. Pergolidin on osoitettu imeytyvän nopeasti ja saavuttavan huippupitoisuutensa lyhyessä ajassa.

Huippupitoisuudet (C_{max}) 10 mikrog/kg annoksen jälkeen olivat alhaisia, keskiarvoltaan noin 4 ng/ml ja keskimääräinen puoliintumisaika ($T_{1/2}$) oli noin 6 tuntia. Huippupitoisuus (T_{max}) saavutettiin noin 0,4 tunnissa ja pitoisuuskäyrän alle jäävä alue (AUC) oli noin 14 ng*h/ml. Puoliintumisaika tässä tutkimuksessa oli huomattavasti lyhyempi kuin mitä ihmisillä on raportoitu. Tämä johtuu luultavasti kokeessa käytetyn analyysimenetelmän herkkyydestä, joka ei täysin mahdollistanut pitoisuus-aikakuvaajan selvittämistä. Siksi tämän tutkimuksen nopea eliminaationopeus ei ehkä vastaa todellista eliminaatiovaihetta.

Käytettäessä edellistä herkempää analyttistä menetelmää plasmapitoisuudet annoksella 2 mikrog pergolidia/kg olivat hyvin alhaiset ja huippupitoisuudet vaihtelivat välillä 138–551 pg/ml. Huippupitoisuudet (T_{max}) saavutettiin $1,25 \pm 0,5$ tunnissa. Plasmapitoisuudet useimmilla hevosilla olivat määritettävissä vain 6 tunnin ajan annoksen jälkeen. Yhdellä hevosella oli kuitenkin määritettäviä pitoisuuksia 24 tunnin ajan. Puoliintumisaikoja ei laskettu, koska useimmilla hevosilla plasmapitoisuus-aikakuvaajaa ei pystytty täysin selvittämään.

Pergolidimesilaatti sitoutuu noin 90 % plasman proteiineihin ihmisillä ja laboratorioeläimillä.

5. FARMASEUTTISET TIEDOT

5.1 Merkittävät yhteensopimattomuudet

Ei oleellinen.

5.2 Kesto aika

Avaamattoman pakkauksen kesto aika: 3 vuotta.

5.3 Säilytystä koskevat erityiset varotoimet

Älä säilytä yli 25 °C.

Pidä läpipainopakkaukset ulkopakkauksessa.

5.4 Pakkaustyyppi ja sisäpakkauksen kuvaus

Kylmämuovattu läpipainopakkaus (nailon/alumiini/UPVC // kuumatiivistepinnoitetyllä alumiinilla) sisältäen 10 tai 7 tablettia:

Pahvikotelo sisältäen 60 (6 läpipainopakkausta, joissa kussakin 10) tablettia.
Pahvikotelo sisältäen 100 (10 läpipainopakkausta, joissa kussakin 10) tablettia.
Pahvikotelo sisältäen 160 (16 läpipainopakkausta, joissa kussakin 10) tablettia.
Pahvikotelo sisältäen 480 (3 x pakkauskoko 160) tablettia.
Pahvikotelo sisältäen 91 (13 läpipainopakkausta, joissa kussakin 7) tablettia.
Kaikkia pakkauskokoja ei välttämättä ole markkinoilla.

5.5 Erityiset varotoimet käyttämättömien eläinlääkkeiden tai niistä peräisin olevien jättemateriaalien hävittämiselle

Lääkkeitä ei saa kaataa viemäriin eikä hävittää talousjätteiden mukana.
Eläinlääkkeiden tai niiden käytöstä syntyvien jättemateriaalien hävittämisessä käytetään lääkkeiden paikallisia palauttamisjärjestelyjä sekä kyseessä olevaan eläinlääkkeeseen sovellettavia kansallisia keräysjärjestelmiä.

6. MYYNTILUVAN HALTIJAN NIMI

Boehringer Ingelheim Vetmedica GmbH

7. MYYNTILUVAN NUMERO(T)

30135

8. ENSIMMÄISEN MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ

Ensimmäisen myyntiluvan myöntämispäivämäärä: 31.07.2012

9. VALMISTEYHTEENVEDON VIIMEISIMMÄN TARKISTUKSEN PÄIVÄMÄÄRÄ

13.12.2024

10. ELÄINLÄÄKKEIDEN LUOKITTELU

Eläinlääkemääräys.

Tätä eläinlääkettä koskevaa yksityiskohtaista tietoa on saatavilla unionin valmistetietokannassa (<https://medicines.health.europa.eu/veterinary>).

1. DET VETERINÄRMEDICINSKA LÄKEMEDLETS NAMN

Prascend 1 mg tabletter för häst

2. KVALITATIV OCH KVANTITATIV SAMMANSÄTTNING

Varje tablett innehåller:

Aktiv substans:

1,0 mg pergolid (i form av pergolidmesilat 1,31 mg).

Hjälpämnen:

Kvalitativ sammansättning av hjälpämnen och andra beståndsdelar
Kroskarmellosnatrium
Röd järnoxid (E172)
Laktosmonohydrat
Magnesiumstearat
Povidon K30

Rosa, rektangulär tablett med brytskåra, präglat på ena sidan med Boehringer Ingelheim-logotypen och bokstäverna "PRD". Tabletterna kan delas i två lika stora halvvar.

3. KLINISKA UPPGIFTER

3.1 Djurslag

Häst (ej avsedd för livsmedelsproduktion).

3.2 Indikationer för varje djurslag

För symptomatisk behandling av kliniska tecken på hypofysär pars intermedia dysfunktion (PPID) (Cushings syndrom hos häst).

3.3 Kontraindikationer

Använd inte vid överkänslighet mot den aktiva substansen eller andra ergotderivat eller mot något av hjälpämnena.

Använd inte till hästar under 2 års ålder.

3.4 Särskilda varningar

Relevanta endokrinologiska laborietester skall utföras, liksom utvärdering av kliniska symptom, för att ställa diagnosen PPID.

3.5 Särskilda försiktighetsåtgärder vid användning

Särskilda försiktighetsåtgärder för säker användning till avsedda djurslag:

Eftersom majoriteten av PPID-fallen diagnostiseras hos äldre hästar förekommer det ofta andra patologiska processer. För monitorering och testintervall se sektion 3.9.

Särskilda försiktighetsåtgärder för personer som administrerar läkemedlet till djur:

Pergolid kan, liksom andra ergotderivater, orsaka emesis, yrsel, letargi eller lågt blodtryck.

Allvarliga biverkningar såsom kollaps har observerats. Intag kan vara skadligt och förknippat med allvarliga biverkningar, särskilt hos barn eller personer med tidigare hjärtsjukdomar. Intag inte det veterinärmedicinska läkemedlet.

För att minska risken för oavsiktligt intag:

- Förvara detta veterinärmedicinska läkemedel åtskilt från humanläkemedel och hantera det med försiktighet.
- Tabletter förberedda för administrering ska administreras omedelbart och får inte lämnas utan uppsikt.

Vid oavsiktligt intag, uppsök genast läkare och visa bipacksedeln eller etiketten. Undvik att köra bil eller använda maskiner efter intag av detta veterinärmedicinska läkemedel.

Barn bör undvika kontakt med det veterinärmedicinska läkemedlet.

Detta veterinärmedicinska läkemedel kan vid delning orsaka ögonirritation, en irriterande lukt eller huvudvärk. Minimera risken för exponering när tablettorna delas. Tablettorna skall inte krossas. Undvik kontakt med ögonen och inhalation vid hantering av tablettorna.

Personer med känd överkänslighet mot pergolid eller andra ergotderivat bör undvika kontakt med det veterinärmedicinska läkemedlet och skall inte administrera det.

Gravida eller ammande kvinnor skall bära handskar när de administrerar det veterinärmedicinska läkemedlet.

Vid hudkontakt, skölj den exponerade huden med vatten. Vid ögonkontakt, skölj omedelbart det utsatta ögat med vatten och kontakta läkare. Vid nasal irritation, gå ut i friska luften och kontakta läkare om andningssvårigheter uppstår.

Tvätta händerna efter användning.

Särskilda försiktighetsåtgärder för skydd av miljön:

Ej relevant.

3.6 Biverkningar

Häst (ej avsedd för livsmedelsproduktion):

Sällsynta (1 till 10 av 10 000 behandlade djur):	Aptitlöshet; anorexi ¹ ; letargi ¹ Störningar i centrala nervsystemet (t.ex. depression och ataxi i centrala nervsystemet) ² Diarré, kolik
Mycket sällsynta (färre än 1 av 10 000 behandlade djur, enstaka rapporterade händelser inkluderade):	Svettningar

¹ Övergående

² Lätt

Om det uppstår tecken på dosintolerans skall behandlingen stoppas i 2 till 3 dagar och återupptas med halva den tidigare dosen. Den totala dagliga dosen kan sedan titreras tillbaka upp till önskad klinisk effekt genom en ökning med 0,5 mg varannan till var fjärde vecka.

Det är viktigt att rapportera biverkningar. Det möjliggör fortlöpande säkerhetsövervakning av ett läkemedel. Rapporter ska, företrädesvis via en veterinär, skickas till antingen innehavaren av godkännande för försäljning eller dennes lokala företrädare eller till den nationella behöriga myndigheten via det nationella rapporteringssystemet. Se även bipacksedeln för respektive kontaktuppgifter.

3.7 Användning under dräktighet, laktation eller äggläggning

Dräktighet:

Används endast i enlighet med ansvarig veterinärs nytta/riskbedömning. Säkerheten för detta veterinärmedicinska läkemedel har inte fastställts hos dräktiga ston. Laboratoriestudier på mus och kanin har inte gett några belägg för teratogena effekter. Nedsatt fertilitet observerades på möss vid en dos på 5,6 mg/kg kroppsvikt per dag.

Laktation:

Användning rekommenderas inte till digivande hästar, eftersom detta veterinärmedicinska läkemedels säkerhet inte fastställts hos dessa. Det är observerat brister i mjölkproduktion hos mus. Detta är orsakat av den farmakologiska hämningen av prolaktin sekretionen, vilket medförde lägre kroppsvikt och överlevnad hos avkomma.

3.8 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner

Använd det veterinärmedicinska läkemedlet med försiktighet om det ges samtidigt med andra läkemedel som man vet påverkar proteinbindningen.

Administrera inte läkemedlet samtidigt med dopaminantagonister som neuroleptika (fenotiaziner, ex. acepromazin), domperidon eller metoklopramid eftersom dessa medel kan reducera effekten av pergolid.

3.9 Administreringsvägar och dosering

Oral användning.

Det veterinärmedicinska läkemedlet skall administreras en gång dagligen. För att underlätta administrering skall den erforderliga dagliga dosen lösas upp i en liten mängd vatten och omröras till den är upplöst, och/eller blandas med melass eller annat välsmakande foder. Tabletter som löses upp i vatten skall administreras med en spruta. Administrera hela mängden direkt. Tabletterna skall ej krossas. Använd inte det veterinärmedicinska läkemedlet om du lägger märke till synliga tecken på försämring eller om blisterkartan är skadad.

Startdos

Startdosen är 2 mikrogram pergolid/kg (doseringsintervall: 1,3 till 2,4 mikrogram/kg) kroppsvikt. Enligt studier från publicerad litteratur är den vanligaste, genomsnittliga dosen 2 mikrogram pergolid/kg med ett intervall från 0,6 till 10 mikrogram pergolid/kg (0,25 till 5 mg total daglig dos per häst). Startdosen (2 mikrogram pergolid/kg) skall sedan titreras utifrån det individuella svaret som fastställts genom övervakning (se nedan).

Startdoser rekommenderas enligt följande:

Hästens kroppsvikt	Antal tabletter	Startdos	Dosintervall
200 – 400 kg	½	0,5 mg	1,3 – 2,5 mikrog/kg
401 – 600 kg	1	1,0 mg	1,7 – 2,5 mikrog/kg
601 – 850 kg	1 ½	1,5 mg	1,8 – 2,5 mikrog/kg
851 – 1 000 kg	2	2,0 mg	2,0 – 2,4 mikrog/kg

Underhållsdos

Livslång behandling är att förvänta för denna sjukdom.

De flesta hästar svarar på behandling och stabiliseras vid en genomsnittlig dos på 2 mikrogram pergolid/kg kroppsvikt. Klinisk förbättring med pergolid förväntas inom 6 till 12 veckor. Hästar kan svara kliniskt vid lägre eller varierande doser och därför bör man titrera till lägsta effektiva dos per individ utifrån behandlingssvaret, oavsett om detta är effekt eller tecken på intolerans. Vissa hästar kan behöva doser upp till 10 mikrogram pergolid/kg kroppsvikt per dag. I dessa ovanliga situationer rekommenderas ytterligare övervakning.

Efter den initiala diagnosen, upprepa endokrinologiska tester för dositering och övervakning av behandlingen med 4 till 6 veckors intervall, fram till att de kliniska tecknen och/eller resultaten av de diagnostiska testen stabiliseras eller förbättras.

Kliniska symptom är: hypertrikos, polyuri, polydipsi, muskelatrofi, onormal fettfördelning, kroniska infektioner, fång, svettningar etc.

Behandlingsstrategin är dositering till lägsta effektiva dos per individ utifrån behandlingssvaret, oavsett om detta är effekt eller tecken på intolerans. Beroende på sjukdomens allvarlighetsgrad kan tiden fram till behandlingssvar variera mellan individerna.

Om kliniska symptom eller diagnostiska tester ännu inte förbättrats efter det första intervallet på 4 till 6 veckor, kan den totala dagliga dosen ökas med 0,5 mg. Om de kliniska symptomen förbättrats men ännu inte är normaliserade, kan veterinären besluta att titrera eller inte titrera dosen med hänsyn till individens svar på/tolerans för dosen.

Om de kliniska symptomen inte är tillräckligt kontrollerade (klinisk utvärdering och/eller diagnostiska tester) bör den totala dagliga dosen ökas stegvis med 0,5 mg med 4 till 6 veckors mellanrum tills stabilisering uppnås och om läkemedlet tolereras vid den dosen. Om det uppstår tecken på dosintolerans skall behandlingen stoppas i 2 till 3 dagar och återupptas med halva den tidigare dosen. Den totala dagliga dosen kan sedan titreras tillbaka upp till önskad klinisk effekt genom en ökning med 0,5 mg varannan till var fjärde vecka. Om en dos glöms bort ska nästa planerade dos ges enligt ordination.

Efter stabilisering skall regelbunden klinisk undersökning och diagnostiska tester genomföras var sjätte månad för att övervaka behandling och dos. Om inte någon uppenbar behandlingsrespons kan ses, skall diagnosen reevalueras.

3.10 Symtom på överdosering (och i tillämpliga fall akuta åtgärder och motgift)

Det finns ingen klinisk erfarenhet av massiv överdos.

3.11 Särskilda begränsningar för användning och särskilda villkor för användning, inklusive begränsningar av användningen av antimikrobiella och antiparasitära läkemedel för att begränsa risken för utveckling av resistens

Ej relevant.

3.12 Karenstider

Ej godkänd för användning till hästar avsedda för humankonsumtion.

Det måste intygas att hästen inte är avsedd för humankonsumtion i enlighet med nationell lagstiftning om hästpass.

Ej godkänd för användning till ston som producerar mjölk för humankonsumtion.

4. FARMAKOLOGISKA UPPGIFTER

4.1 ATCvet-kod: QN04BC02

4.2 Farmakodynamik

Pergolid är ett syntetiskt ergotderivat samt en kraftfull, långtidsverkande dopaminreceptoragonist. Både *in vitro* och *in vivo* farmakologiska studier har visat att pergolid verkar som en selektiv dopaminagonist med liten eller ingen effekt på norepinefrin-, epinefrin- eller serotoninbanorna vid terapeutiska doser. Liksom andra dopaminagonister hämmar pergolid utsöndringen av prolaktin. Hos hästar med PPID (hypofysär pars intermedia dysfunktion) verkar pergolid genom att stimulera dopaminreceptorer. Hos hästar med PPID har pergolid även visat sig minska plasmanivåerna av ACTH, MSH och andra pro-opiomelanokortinpeptider.

4.3 Farmakokinetik

Farmakokinetisk information för häst finns för orala doser på 2 µmikrogram pergolid/kg kroppsvikt och 10 mikrogram pergolid/kg kroppsvikt. Det har påvisats att pergolid absorberas snabbt med kort tid till maximal koncentration.

De maximala koncentrationerna (C_{max}) efter en dos på 10 mikrogram/kg var låga och varierande med ett genomsnitt på ~ 4 ng/ml och en genomsnittlig terminal halveringstid ($T_{1/2}$) på ~ 6 timmar. Genomsnittlig tid till maximal koncentration (T_{max}) var ~0,4 timmar och arean under kurvan (AUC) var ~ 14 ng*tim/ml. Den terminala halveringstiden i denna studie var mycket kortare än den som rapporterats för människor. Detta beror sannolikt på analysens känslighet i denna studie, vilken inte var tillräcklig för att helt klargöra koncentration-tid-profilen. Därför är kanske den snabba beräknade elimineringshastigheten i denna studie inte en korrekt återgivning av elimineringsfasen.

I en analys med större känslighet var plasmakoncentrationerna efter dosen på 2 mikrogram pergolid/kg mycket låga och varierande med maximala koncentrationer mellan 138 och 551 pg/ml. Maximala koncentrationer uppnåddes vid 1,25 +/- 0,5 timmar (T_{max}). Plasmakoncentrationerna hos de flesta hästar var endast kvantifierbara i sex timmar efter given dos. En häst hade dock kvantifierbara koncentrationer i 24 timmar. Terminala halveringstider beräknades inte på grund av ofullständigt klarläggande av plasmakoncentration-tid-kurvan för de flesta hästarna.

Pergolidmesilat är till ca 90% bundet till plasmaproteiner hos människa och laboratoriedjur.

5. FARMACEUTISKA UPPGIFTER

5.1 Viktiga inkompatibiliteter

Ej relevant.

5.2 Hållbarhet

Hållbarhet i oöppnad förpackning: 3 år.

5.3 Särskilda förvaringsanvisningar

Förvaras vid högst 25 °C.

Förvara blisterkartan i ytterkartongen.

5.4 Inre förpackning (förpackningstyp och material)

Kallpressade blister (nylon/ aluminium/ UPVC // värmeförseglingsbeläggning av vinyl / aluminium) innehållande 10 eller 7 tabletter:

Pappkartong innehållande 60 (6 blister med 10) tabletter.

Pappkartong innehållande 100 (10 blister med 10) tabletter.

Pappkartong innehållande 160 (16 blister med 10) tabletter.

Pappkartong innehållande 480 (3 x förpackningsstorleken med 160) tabletter.
Pappkartong innehållande 91 (13 blister med 7) tabletter.

Eventuellt kommer inte alla förpackningsstorlekar att marknadsföras.

5.5 Särskilda försiktighetsåtgärder för destruktions av ej använt läkemedel eller avfall efter användningen

Läkemedel ska inte kastas i avloppet eller bland hushållsavfall.

Använd retursystem för kassering av ej använt läkemedel eller avfall från läkemedelsanvändningen i enlighet med lokala bestämmelser.

6. INNEHAVARE AV GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

Boehringer Ingelheim Vetmedica GmbH

7. NUMMER PÅ GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

30135

8. DATUM FÖR FÖRSTA GODKÄNNANDE

Datum för första godkännandet: 31/07/2012

9. DATUM FÖR SENASTE ÖVERSYN AV PRODUKTRESUMÉN

13.12.2024

10. KLASSIFICERING AV DET VETERINÄRMEDICINSKA LÄKEMEDLET

Receptbelagt läkemedel.

Utförlig information om detta läkemedel finns i unionens produktdatabas (<https://medicines.health.europa.eu/veterinary>).