

Trocoxil®

Zoetis Belgium

Tuggetablett 30 mg

R_x

Djurslag:

Hund

Aktiv substans:

Mavacoxib

ATC-kod:

QM01AH92

Texten nedan gäller för:

Trocoxil® tuggetablett 6 mg, 20 mg, 30 mg, 75 mg och 95 mg

FASS VET-text: *Denna text är avsedd för vårdpersonal.*

Texten är baserad på veterinär produktresumé: 2020-05-05.

Innehåll

Aktiv substans:

Mavacoxib 6 mg

Mavacoxib 20 mg

Mavacoxib 30 mg

Mavacoxib 75 mg

Mavacoxib 95 mg

Sackaros

Silicifierad mikrokristallin cellulosa

Konstgjord biffsmak, pulver

Kroskarmellosnatrium

Natriumlaurilsulfat

Magnesiumstearat

Egenskaper

Farmakodynamiska egenskaper

Mavacoxib är en icke-steroid antiinflammatorisk substans (NSAID) tillhörande gruppen coxiber. Mavacoxib är en 4-[5-(4-fluorofenyl)-3-(trifluorometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-benzensulfonamid, en diarylsubstituerad pyrazol. Mavacoxib verkar främst genom hämning av cyklooxygenas (COX).

COX är ett nyckelenzym i arakidonsyrametabolismen. Dess aktivitet kulminerar vid syntesen av lokala hormoner och inflammatoriska mediatorer (eikosanoider), där flera prostaglandiner ingår. Det finns två isoformer av COX: COX-1 och COX-2. COX-1 är ett grundläggande och vanligt förekommande enzym, främst involverat i upprätthållandet av normal organ- och vävnadsfunktion, medan COX-2 huvudsakligen förekommer på ställen med vävnadsskada men i vissa organ också är grundläggande för normalfunktionen. COX-2 har en viktig roll i syntesen av prostaglandiner, som är centrala som mediatorer för smärta, inflammation och feber. Mavacoxib verkar huvudsakligen genom inhibering av COX-2-medierad prostaglandinsyntes och uppvisar därför analgetiska och antiinflammatoriska egenskaper.

Produkterna i COX-2-metabolismen är också involverade i ovulation, implantation och slutning av *ductus arteriosus*. Både COX-1 och COX-2 finns normalt i njurarna och förmodas ha skyddande roller vid ogynnsamma fysiologiska omständigheter.

Resultat från helblodstester på hund har visat att plasmakoncentrationerna som ger 20 % COX-1- hämning och 80 % COX-2-hämning var 2,46 µg/ml respektive 1,28 µg/ml. Detta betyder att potensförhållandet IC₂₀COX-1:IC₈₀COX-2 är cirka 2:1, medan potensförhållandet IC₈₀COX-1:IC₈₀COX-2 är cirka 40:1. Dessa IC-koncentrationer kan jämföras med de genomsnittliga dalkoncentrationerna av mavacoxib i plasma, som i kliniska studier har visat sig vara 0,52 µg/ml efter första dosen och 1,11 µg/ml efter femte dosen. Kliniska doser förväntas därför ge svag hämning av COX-1 och stark hämning av COX-2.

Farmakokinetiska egenskaper

Mavacoxib absorberas väl efter peroral administrering. Biotillgängligheten var 87 % hos utfodrade hundar och 46 % vid fasta, och den rekommenderade dosen baseras på administrering tillsammans med foder. Terapeutiska koncentrationer hos utfodrade hundar uppnås snabbt och de högsta koncentrationerna erhålls inom mindre än 24 timmar efter dosering. Mavacoxib binds till cirka 98 % till plasmaproteiner. Det distribueras i stor utsträckning i kroppen och nästan alla mavacoxibrelaterade restmängder i plasma består av modersubstans. Kroppens clearance av mavacoxib är långsam och elimineringen sker främst genom utsöndring av modersubstans via gallan.

Farmakokinetikstudier av multipla doser har inte visat belägg för att mavacoxib ger upphov till autoinhibering eller autoinduktiva förändringar i clearance, och dess farmakokinetik är linjär efter perorala doser om 2-50 mg/kg. Laboriestudier på unga vuxna hundar visade en genomsnittlig elimineringshalveringstid om 13,8-19,3 dagar. Mavacoxib hade längre elimineringshalveringstid hos privatägda djur. Farmakokinetiska data från populationsstudier med främst äldre och tyngre hundar, jämfört med experimentella studier (snittålder 9 år) visade en genomsnittlig elimineringshalveringstid om 39 dagar, med en liten subpopulation (<5%) som hade en elimineringshalveringstid om mer än 80 dagar. På motsvarande sätt noterades en ökad exponering hos dessa individer. Orsaken till den längre halveringstiden är okänd. Steady state-farmakokinetik uppnåddes hos de flesta hundarna efter den fjärde behandlingen.

Indikationer

För behandling av smärta och inflammation i samband med degenerativ ledsjukdom hos hund, där kontinuerlig behandling utöver en månad är indicerat.

Kontraindikationer

Använd inte om till hundar som är yngre än 12 månader och/eller som väger mindre än 5 kg.

Använd inte om till hundar med gastrointestinala störningar, inklusive sår och blödningar.

Använd inte om vid tecken på blödningsrubbningar.

Använd inte om vid nedsatt njur- eller leverfunktion.

Använd inte om vid hjärtinsufficiens.

Använd inte om till avelsdjur, dräktiga eller lakterande tikar.
Använd inte vid överkänslighet mot den aktiva substansen eller mot något av hjälpämnen.

Använd inte om vid känd överkänslighet mot sulfonamider.

Använd inte om samtidigt med glukokortikoider eller andra icke-steroida antiinflammatoriska läkemedel (NSAID),

Undvik behandling av dehydrerade, hypovolemiska eller hypotensiva djur då en potentiellt ökad risk för njurtoxicitet föreligger.

Försiktighet

Mavacoxib uppvisar förlängd plasmahalveringstid på grund av dess låga elimineringshastighet. Detta motsvarar en effektduration om 1-2 månader efter administrering av den andra dosen (och efterföljande doser). Noggrannhet ska iakttas för att undvika behandling av djur som eventuellt inte tolererar långvarig behandling med NSAID. Kontinuerlig behandling rekommenderas under maximalt 6,5 månader, för att kunna hantera plasmakoncentrationerna av mavacoxib hos djur med reducerad eliminering.

Djuren ska genomgå fullständig klinisk undersökning innan behandling med Trocoxil påbörjas. Dessutom rekommenderas att laboratorieprover tas för att följa hematologiska och kliniskt kemiska parametrar. Djur som visar tecken på nedsatt njur- eller leverfunktion, eller som visar tecken på enteropati med protein- eller blodförlust är inte lämpliga för behandling med Trocoxil. Det rekommenderas att den kliniska undersökningen upprepas en

månad efter att behandlingen med Trocoxil påbörjats och innan en tredje dos ges. Vidare rekommenderas ytterligare uppföljning av den kliniska patologin under behandlingen efter behov.

Mavacoxib utsöndras via gallan och hos hundar med störningar i leverfunktionen kan reducerad eliminering och därmed svår ackumulering inträffa. Därför ska hundar med störningar i leverfunktionen inte behandlas.

Undvik behandling av dehydrerade, hypovolemiska eller hypotensiva djur, då en potentiell risk för ökad njurtoxicitet föreligger. Samtidig behandling med potentiellt njurtoxiska läkemedel bör undvikas.

Lämplig vätsketillförsel och hemodynamisk status ska säkerställas när djur som behandlas med Trocoxil ska genomgå anestesi och/eller operation, eller om de utvecklar tillstånd som kan leda till dehydrering eller nedsatt hemodynamisk status. Interventionens huvudsyfte är att upprätthålla renal perfusion. Patienter med underliggande njursjukdom kan uppleva förvärring eller dekomensation av njursjukdomen under pågående NSAID behandling .

Särskilda försiktighetsåtgärder för personer som administrerar läkemedlet till djur

Vid oavsiktligt intag, uppsök genast läkare och visa denna information eller etiketten.

Intag av Trocoxil kan vara skadligt för barn, och långvariga farmakologiska effekter som leder till t.ex. gastrointestinala besvär

kan förekomma. För att undvika oavsiktligt intag, ge tabletten till hunden genast efter det att den tagits ur blisterförpackningen. Personer som är överkänsliga för NSAID ska undvika kontakt med läkemedlet.

Ät, drick eller rök inte vid hantering av produkten. Tvätta händerna efter hantering av produkten.

Dräktighet och laktation

Ska inte användas till avelsdjur, dräktiga eller lakterande tikar. Säkerheten hos Trocoxil har inte fastställts under dräktighet och laktation. Laboratoriestudier på djur som fått andra NSAID har emellertid visat ökad pre- och postimplantationsförlust, embryo-foetal dödlighet samt missbildningar.

Biverkningar

Biverkningar från digestionskanalen såsom kräkningar och diarré är vanliga, medan nedsatt aptit, blodig diarré och melena är mindre vanliga. Gastrointestinala sår har rapporterats i sällsynta fall. Apati och förändringar i biokemiska parametrar för njurfunktionen samt nedsatt njurfunktion är mindre vanliga. Dessa biverkningar kan i sällsynta fall vara fatala.

Om en biverkning inträffar efter administrering av Trocoxil ska inga fler tabletter ges och allmänt stödjande behandling ska insättas, såsom vid klinisk överdosering med NSAID. Särskild uppmärksamhet ska iakttas för att upprätthålla hemodynamisk status.

Gastroprotektiva läkemedel och parenteral vätsketerapi kan behövas för djur med gastrointestinala biverkningar eller

njurbiverkningar. Veterinärer bör vara medvetna om att kliniska symtom på biverkningar kan fortsätta efter att den stödjande behandlingen (med t.ex. gastroprotektiva läkemedel) avslutats. Frekvensen av biverkningar anges enligt följande konvention:

- Mycket vanliga (fler än 1 av 10 behandlade djur som uppvisar biverkningar)
- Vanliga (fler än 1 men färre än 10 djur av 100 behandlade djur)
- Mindre vanliga (fler än 1 men färre än 10 djur av 1 000 behandlade djur)
- Sällsynta (fler än 1 men färre än 10 djur av 10 000 behandlade djur)
- Mycket sällsynta (färre än 1 djur av 10 000 behandlade djur, enstaka rapporterade händelser inkluderade)

Dosering

Oral användning.

DETTA ÄR INTE ETT NSAID SOM SKA GES DAGLIGEN. Dosen är 2 mg mavacoxib per kg kroppsvikt, givet omedelbart före eller tillsammans med hundens huvudmåltid. Det är viktigt att se till att tabletten verkligen intas. Behandlingen ska upprepas 14 dagar senare, och därefter är doseringsintervallet EN MÅNAD. En behandlingscykel ska inte överstiga 7 på varandra följande doser (6,5 månader).

Kroppsvikt (kg)	Antal tabletter och styrka som ska ges				
	6 mg	20 mg	30 mg	75 mg	95 mg
5-6	2				

Kroppsvikt (kg)	Antal tabletter och styrka som ska ges				
7-10		1			
11-15			1		
16-20		2			
21-23		1	1		
24-30			2		
31-37				1	
38-47					1
48-52			1	1	
53-62			1		1
63-75				2	

Karenstider

Ej relevant.

Interaktioner

Inga läkemedelsinteraktionsstudier har genomförts. I likhet med andra NSAID ska Trocoxil inte ges samtidigt med andra NSAID eller glukokortikosteroider. Risk för interaktioner måste beaktas under hela effektperioden, dvs. 1-2 månader efter administrering av Trocoxil. Hunden bör övervakas noggrant om Trocoxil ges tillsammans med en antikoagulant.

NSAID har en hög plasmaproteinbindning och kan konkurrera med andra substanser med hög proteinbindning, vilket kan medföra toxiska effekter vid samtidig administrering.

Förbehandling med andra antiinflammatoriska substanser kan resultera i ytterligare eller ökat antal biverkningar. För att undvika

sådana effekter när ett annat NSAID ska bytas ut mot Trocoxil ska en lämplig behandlingsfri period om minst 24 timmar säkerställas innan den första dosen Trocoxil ges. Vid bestämning av den behandlingsfria periodens längd bör emellertid hänsyn tas till det tidigare använda läkemedlets farmakologi. Om ett annat NSAID ska ges efter behandlingen med Trocoxil ska en behandlingsfri period om minst EN MÅNAD säkerställas för att undvika biverkningar.

Samtidig behandling med potentiellt njurtoxiska **veterinärmedicinska** läkemedel bör undvikas.

Överdoser

I överdoseringsstudier förekommer, i likhet med andra NSAID, farmakodynamiska biverkningar med påverkan på gastrointestinalsystemet. Även biverkningar som förekommer vid normal dosering hos djur involverade främst gastrointestinalsystemet.

I överdoseringsstudier med upprepade doser om 5 mg/kg och 10 mg/kg sågs inga kliniska biverkningar, avvikelser i klinisk-kemiska parametrar eller signifikanta histologiska avvikelser. Vid 15 mg/kg sågs symtom på kräkningar och mjuk/slemmig avföring samt en ökning av klinisk-kemiska parametrar avseende njurfunktionen. Vid 25 mg/kg fanns symtom på gastrointestinalt sår.

Ingen specifik antidot mot överdos av mavacoxib finns, men allmänt understödande behandling, som vid överdosering av NSAID, bör ges.

Observera

Särskilda varningar för respektive djurslag

Ge inte andra NSAID eller glukokortikoider samtidigt eller inom 1 månad efter sista behandlingen med Trocoxil.

Hållbarhet

Hållbarhet i oöppnad förpackning: 3 år

Förvaring

Inga särskilda förvaringsanvisningar.

Förpackningsinformation

Tuggtablett 6 mg

Tuggtablett 20 mg Trekantig, brunmelerad tablett präglad med tablettstyrkan på ena sidan och omärkta på den andra

2 tablett(er) blister, receptbelagd, *tillhandahålls ej*

Tuggtablett 30 mg

2 tablett(er) blister, receptbelagd

Tuggtablett 75 mg

2 tablett(er) blister, receptbelagd

Tuggtablett 95 mg

2 tablett(er) blister, receptbelagd