

Робексера® Robexera® розчин для ін'єкцій
(розчин для ін'єкцій)
листівка-вкладка

Опис

Прозорий, від безбарвного до ледь коричневато-жовтого кольору розчин.

Склад

1 мл препарату містить діючу речовину (мг):

робенакоксиб – 20.

Допоміжні речовини: натрію метабісульфіт (Е223), макрогол 400, етанол (96 %), полоксамер 188, лимонна кислота, натрію гідроксид, вода для ін'єкцій.

Фармакологічні властивості

АТС-vet класифікаційний код: QM01 – протизапальні та протиревматичні засоби, нестероїдні. QM01AH – коксиби. QM01AH91 – робенакоксиб.

Робенакоксиб – це нестероїдний протизапальний засіб (НПЗЗ) класу коксибів. Це потужний та селективний інгібітор ферменту циклооксигенази 2 (ЦОГ-2). Фермент циклооксигеназа (ЦОГ) існує у двох формах. ЦОГ-1 є основною формою ферменту і виконує захисні функції, наприклад, у травного каналу та нирках. ЦОГ-2 є індукованою формою ферменту та відповідає за синтез медіаторів, включаючи простагландини, які спричиняють біль, запалення або лихоманку.

У котів, під час аналізу цільної крові *in vitro*, робенакоксиб був приблизно у 500 разів селективнішим щодо ЦОГ-2 (IC_{50} 0,058 мкМ) порівняно з ЦОГ-1 (IC_{50} 28,9 мкМ). Робенакоксиб, розчин для ін'єкцій, помітно пригнічував активність ЦОГ-2 та не впливав на активність ЦОГ-1 *in vivo*. У рекомендованій дозі (2 мг/кг) знеболювальна, протизапальна та жарознижувальна дія спостерігалась на моделі запалення, а у клінічних дослідженнях робенакоксиб полегшував біль та запалення у котів після ортопедичної операції або операції на м'яких тканинах.

У собак робенакоксиб був приблизно у 140 разів селективнішим щодо ЦОГ-2 (IC_{50} 0,04 мкМ) порівняно з ЦОГ-1 (IC_{50} 7,9 мкМ) *in vitro*. Робенакоксиб, розчин для ін'єкцій, помітно пригнічував активність ЦОГ-2 та не впливав на активність ЦОГ-1 *in vivo*. У дозах від 0,25 до 4 мг/кг робенакоксиб демонстрував знеболювальну, протизапальну та жарознижувальну дію на моделі запалення зі швидким початком дії (1 год). У клінічних дослідженнях у рекомендованій дозі (2 мг/кг) робенакоксиб полегшував біль та запалення у собак після ортопедичної операції або операції на м'яких тканинах, а також зменшував потребу в невідкладному лікуванні у собак після операції на м'яких тканинах.

Коти

Всмоктування

Максимальна концентрація робенакоксибу у плазмі крові досягається швидко після підшкірного введення. Після введення робенакоксибу у дозі 2 мг/кг C_{max} становить 1,464 нг/мл і досягається через 1 год (T_{max}), а AUC – 3,128 нг·год/мл. Після підшкірного введення робенакоксибу у дозі 1 мг/кг, його системна біодоступність становить 69 %.

Розподіл

Робенакоксиб демонструє відносно невеликий об'єм розподілу (V_{ss} 190 мл/кг) та високий ступінь зв'язування з білками плазми крові (> 99 %).

Метаболізм

Робенакоксиб активно метаболізується печінкою. Крім одного лактамного метаболіту, ідентифікація інших метаболітів невідома.

Виділення

Після внутрішньовенного введення робенакоксиб швидко виводився з крові (CL 0,44 л/кг/год) з періодом напіввиведення - 1,1 год. Після підшкірного застосування його кінцевий період напіввиведення з крові становив 1,1 год.

Робенакоксиб зберігається протягом довшого періоду та у вищих концентраціях у місцях запалення, ніж у крові.

Робенакоксиб виводиться переважно з жовчю (~70 %), а решта – через нирки. Повторне підшкірне введення у дозах 2-20 мг/кг не змінювало ліпідний профіль, не демонструвало ні

С. 6. 0 5. 2026

біоаккумуляції робенакоксибу, ні індукції ферментів. Біоаккумуляція метаболітів не вивчалась. Фармакокінетика робенакоксибу після введення не відрізняється між самцями та самицями.

Собаки

Всмоктування

Максимальна концентрація робенакоксибу у плазмі крові досягається швидко після підшкірного введення. Після введення робенакоксибу у дозі 2 мг/кг $C_{\max}$ становить 615 нг/мл і досягається через 1 год ($T_{\max}$), AUC – 2,180 нг·год/мл. Після підшкірного введення робенакоксибу у дозі 1 мг/кг, його системна біодоступність становить 88 %.

Розподіл

Робенакоксиб демонструє відносно невеликий об'єм розподілу (240 мл/кг) та високий ступінь зв'язування з білками плазми крові (> 99 %).

Метаболізм

Робенакоксиб активно метаболізується печінкою. Крім одного лактамного метаболіту, ідентифікація інших метаболітів невідома.

Вивільнення

Після внутрішньовенного застосування робенакоксиб швидко виводився з крові (CL 0,81 л/кг/год) з періодом напіввиведення 0,8 год. Після підшкірного введення кінцевий період напіввиведення з крові становив 1,2 год.

Робенакоксиб зберігається протягом довшого періоду та у вищих концентраціях у місцях запалення, ніж у крові.

Робенакоксиб виводиться переважно з жовчю (~65 %), а решта – через нирки. Повторне підшкірне введення у дозах 2-20 мг/кг не змінювало ліпідний профіль, не демонструвало ні біоаккумуляції робенакоксибу, ні індукції ферментів. Біоаккумуляція метаболітів не вивчалась. Фармакокінетика робенакоксибу після введення не відрізняється між самцями та самицями та є лінійною у діапазоні 0,25-4 мг/кг.

Застосування

Лікування собак за болю та запалення, пов'язаного з ортопедичними операціями або операціями на м'яких тканинах.

Лікування котів за болю та запалення, пов'язаного з ортопедичними операціями або операціями на м'яких тканинах.

Дозування

Підшкірно.

Рекомендована доза становить 2 мг робенакоксибу на 1 кг маси тіла (що еквівалентно 1 мл ветеринарного лікарського засобу на 10 кг маси тіла).

Вводити ветеринарний лікарський засіб необхідно приблизно за 30 хвилин до хірургічного втручання, наприклад, приблизно під час індукції загальної анестезії.

Після хірургічного втручання в котів можна продовжувати лікування в тій самій дозі один раз на добу, в один і той же час щодня протягом 2 діб.

Після хірургічного втручання на м'яких тканинах у собак можна продовжувати лікування один раз на добу в тій самій дозі та в один і той же час щодня протягом 2 діб.

Взаємозамінне застосування ветеринарних лікарських засобів, що містять робенакоксиб, у формі таблеток та розчину для ін'єкцій було вивчено у дослідженнях безпечності для цільових тварин та була продемонстрована добра переносимість у котів та собак.

Ветеринарні лікарські засоби, що містять робенакоксиб, у формі розчину для ін'єкцій або таблеток можна застосовувати взаємозамінно відповідно до показань, затверджених для кожної лікарської форми. Лікування не повинно перевищувати рекомендованої дози (таблетка або ін'єкція) на добу. Необхідно звернути увагу, що рекомендовані дози для різних лікарських форм ветеринарного лікарського засобу можуть відрізнятися.

Пробку можна пробивати максимум 16 разів.

Протипоказання

Не застосовувати тваринам із виразкою травного каналу.

Не застосовувати одночасно з кортикостероїдами або іншими нестероїдними протизапальними засобами (НПЗЗ).

С 6. 0 5. 2026

Не застосовувати у випадках з підвищеною чутливістю до активної речовини або до будь-якого компонента з допоміжних речовин.

Не застосовувати тваринам у період вагітності та лактації.

Застереження

Коти

Часто (від 1 до 10 тварин / 100 обстежених тварин):	Біль в місці ін'єкції ¹ Розлади травлення ¹ , діарея ¹ , блювання ¹
Нечасто (від 1 до 10 тварин / 1000 обстежених тварин):	Кривава діарея, кров у блювотних масах

¹Більшість випадків були легкими та проходили без лікування.

Собаки

Часто (від 1 до 10 тварин / 100 обстежених тварин):	Біль у місці ін'єкції ¹ Розлади травлення ² , діарея ² , блювання ²
Нечасто (від 1 до 10 тварин / 1000 обстежених тварин):	Дьогтеподібні випорожнення. Зниження апетиту

¹Помірний або сильний біль у місці ін'єкції спостерігався нечасто.

²Більшість випадків були легкими та проходили без лікування.

Особливі застереження при використанні

Безпека ветеринарного лікарського засобу не була встановлена для котів у віці до 4 місяців та собак у віці до 2 місяців, а також для котів та собак з масою тіла до 2,5 кг.

Введення тваринам з серцевою, нирковою або печінковою недостатністю, а також тваринам зі зневодненням, гіповолемією або артеріальною гіпотензією може бути пов'язане з додатковими ризиками. Якщо уникнути застосування неможливо, такі тварини потребують ретельного спостереження та інфузійної терапії.

Застосовуйте цей ветеринарний лікарський засіб під ретельним спостереженням лікаря ветеринарної медицини у разі ризику виразки шлунка або якщо у тварини вже спостерігалась непереносимість інших НПЗЗ.

Використання під час вагітності, лактації, несучості

Безпечність ветеринарного лікарського засобу не була встановлена у період вагітності та лактації.

Безпечність ветеринарного лікарського засобу не була встановлена для котів та собак у період розведення.

Вагітність та лактація:

Не застосовувати в період вагітності або лактації.

Фертильність:

Не застосовувати у період розведення тварин.

Взаємодія з іншими засобами та інші форми взаємодії

Цей ветеринарний лікарський засіб протипоказано застосовувати у комбінації з іншими НПЗЗ або глюкокортикостероїдами. Попереднє лікування іншими протизапальними лікарськими засобами може призвести до додаткових або посилення небажаних явищ, тому перед початком застосування цього ветеринарного лікарського засобу необхідно дотримуватись періоду без лікування такими речовинами протягом принаймні 24 годин. Однак, період без лікування повинен враховувати фармакокінетичні властивості лікарських засобів, які застосовували раніше.

Супутнє лікування лікарськими засобами, що впливають на пирковий кровотік, наприклад, діуретиками або інгібіторами ангіотензинперетворювального ферменту (АПФ), слід проводити під клінічним контролем.

У здорових котів або собак, яким вводили або не вводили діуретик фуросемід, супутнє застосування цього ветеринарного лікарського засобу з інгібітором АПФ беназеприлом протягом 7 днів не було пов'язане з жодним негативним впливом на концентрацію альдостерону в плазмі крові

(коти) або сечі (собаки), активність реніну в плазмі крові або швидкість клубочкової фільтрації. Для комбінованого лікування робенакоксибом і бензеприлом немає даних щодо безпеки для цільових тварин та ефективності в цілому.

Оскільки анестетики можуть впливати на ниркову перфузію, необхідно розглянути парентеральну інфузійну терапію під час хірургічного втручання для полегшення можливих ускладнень з боку нирок при застосуванні НПЗЗ до хірургічного втручання.

Слід уникати одночасного застосування потенційно нефротоксичних лікарських засобів, оскільки може підвищитися ризик ниркової токсичності.

Одночасне застосування інших активних речовин, які мають високий ступінь зв'язування з білками, може конкурувати з робенакоксибом і, таким чином, спричиняти токсичні ефекти.

Передозування (симптоми, невідкладні заходи, антидоти)

У здорових молодих собак у віці 6 місяців підшкірне введення робенакоксибу у дозі 2 мг/кг (рекомендована терапевтична доза; РТД), 6 мг/кг (трикратна РТД) та 20 мг/кг (десятикратна РТД) один раз на добу (9 разів) протягом 5 тижнів (3 цикли по 3 послідовні введення один раз на добу) не спричинило жодних ознак токсичності, включаючи токсичність для травного каналу, нирок або печінки, та не вплинуло на тривалість кровотечі. Зворотне запалення у місці введення спостерігалось в усіх групах (включаючи контрольну) та було більш вираженим у групах з дозами 6 та 20 мг/кг.

У здорових молодих котів у віці 10 місяців підшкірне введення робенакоксибу у дозі 4 мг/кг (подвійна РТД) протягом 2 днів поспіль та у дозі 10 мг/кг (п'ятикратна РТД) один раз на добу протягом 3 днів поспіль не спричинило жодних ознак токсичності, включаючи ознаки токсичності для травного каналу, нирок або печінки, та не вплинуло на тривалість кровотечі. В обох групах спостерігались оборотні, мінімальні реакції в місці ін'єкції.

Взаємозамінне застосування ветеринарних лікарських засобів, що містять робенакоксиб, у формі таблеток та розчину для ін'єкцій у котів у віці 4 місяців за передозування в 3 рази максимальної рекомендованої дози (2,4 мг, 4,8 мг, 7,2 мг робенакоксибу/кг п/о та 2,0 мг, 4,0 мг та 6,0 мг робенакоксибу/кг підшкірно) спричинило дозозалежне посилення спорадичного набряку в місці ін'єкції та мінімального або легкого підгострого/хронічного запалення підшкірної клітковини. У лабораторних дослідженнях спостерігалось дозозалежне збільшення інтервалу QT, зменшення частоти серцевих скорочень та відповідне збільшення частоти дихання. Не спостерігалось суттєвого впливу на масу тіла, тривалість кровотечі або ознак токсичності для травного каналу, нирок або печінки.

У дослідженнях передозування на котах спостерігалось дозозалежне збільшення інтервалу QT. Біологічна значущість збільшення інтервалу QT поза межами варіанту норми, що спостерігаються після передозування робенакоксибу, невідома. Після разового внутрішньовенного введення робенакоксибу в дозі 2 або 4 мг/кг здоровим котам під наркозом не спостерігалось зміни інтервалу QT.

Взаємозамінне застосування ветеринарних лікарських засобів, що містять робенакоксиб, у формі таблеток та розчину для ін'єкцій у безпородних собак при передозуванні до 3 разів від максимальної рекомендованої дози (2,0, 4,0 та 6,0 плюс 4,0, 8,0 та 12,0 мг робенакоксибу/кг п/о та 2,0 мг, 4,0 мг та 6,0 мг робенакоксибу/кг підшкірно) спричинило дозозалежний набряк, еритему, потовщення шкіри та виразки на шкірі в місці ін'єкції, а також запалення, закладеності або кровотечі у дванадцятипалій, порожній та сліпій кишці.

Не було виявлено жодного значущого впливу на масу тіла, час кровотечі або ознак токсичності для нирок або печінки.

Після разового введення здоровим собакам робенакоксибу у дозі 2 мг/кг підшкірно або 2 або 4 мг/кг внутрішньовенно не спостерігалось змін артеріального тиску або електрокардіограми. Блювання виникала через 6 або 8 годин після введення у 2 з 8 собак, яким внутрішньовенно вводили розчин для ін'єкцій у дозі 4 мг/кг.

Як і у випадку з будь-яким НПЗЗ, передозування може спричинити токсичність для травного каналу, нирок або печінки у чутливих або ослаблених тварин. Спеціального антидота не існує. Рекомендується симптоматична підтримуюча терапія, що включає введення захисних засобів для травного каналу та інфузію ізотонічного фізіологічного розчину.

С. 6. 0 5. 2926

Форма випуску

Картонна коробка, що містить один флакон з бурштинового скла типу І об'ємом 20 мл, закритий бромбутиловою гумовою пробкою типу І та алюмінієвою пломбою з пластиковою відривною пломбою.

Зберігання

Зберігати в захищеному від дітей місці, в оригінальній упаковці виробника для захисту від дії вологи, у холодильнику за температури від 2 до 8 °С.

Після першого відбору із флакона зберігати за температури не вище 25 °С.

Термін придатності

2 роки.

Термін придатності після відкриття первинної упаковки: 28 діб.

Для застосування у ветеринарній медицині!

Власник реєстраційного посвідчення

КРКА, д.д., Ново место

Шмар'єшка цеста 6, 8501 Ново место, Словенія

KRKA, d.d., Novo mesto

Šmarješka cesta 6, 8501 Novo mesto, Slovenia

Виробники готового продукту

КРКА, д.д., Ново место

Шмар'єшка цеста 6, 8501 Ново место, Словенія

KRKA, d.d., Novo mesto

Šmarješka cesta 6, 8501 Novo mesto, Slovenia

ТАД Фарма ГмбХ,

Хайнц-Лохманн-Штрассе 5, 27472 Куксхафен,
Німеччина

TAD Pharma GmbH,

Heinz-Lohmann-Straße 5, 27472 Cuxhaven,
Germany