

CLOZEPAXEL® 100

N° de Reg. Q-7833-299

CLOZEPAXEL® 400

N° de Reg. Q-7833-300

Anticonvulsivo y analgésico

INTRODUCCIÓN:

CLOZEPAXEL® 100 y 400 es un anticonvulsivo perteneciente al grupo de los gabapentinoides que ha sido reclasificado para su uso como analgésico, además de sus efectos antiepilépticos en perros y gatos.

FÓRMULA:

CLOZEPAXEL® 100:

Cada tableta contiene:

Gabapentina	100 mg
Excipiente cbp	1 Tableta

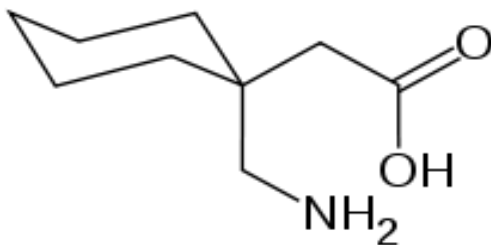
CLOZEPAXEL® 400:

Cada tableta contiene:

Gabapentina	400 mg
Excipiente cbp	1 Tableta

FÓRMULA ESTRUCTURAL GABAPENTINA:

Ácido 2-[1-(aminometil)ciclohexil]etanoico



FARMACODINAMIA:

La gabapentina es un análogo estructural del ácido gamma-amino-butírico (GABA), pero no interactúa con los receptores GABA, no inhibe la captación de GABA ni se metaboliza en GABA o en un agonista de GABA.

Se desconoce con exactitud el mecanismo de acción tanto para su efecto anticonvulsivo como analgésico, sin embargo los datos sugieren que gabapentina se une a la subunidad alfa-2-delta accesoria de los complejos de canales de calcio controlados por voltaje en la membrana celular neuronal e inhibe la afluencia de calcio intracelular, con una subsiguiente reducción en la liberación de neurotransmisores excitatorios (tales como glutamato, norepinefrina o sustancia P) en la hendidura sináptica. Además se sabe que gabapentina modula los receptores GABA localizados en el cuerno dorsal de la médula espinal.

Los efectos analgésicos de gabapentina también están relacionados a la activación de la vía inhibitoria descendente, al inducir la liberación de norepinefrina, que posteriormente induce analgesia debido a la estimulación del adrenoceptor α_2 .

Gabapentina puede prevenir el desarrollo y aparición de alodinia (sensación de dolor resultante de un estímulo normalmente no nocivo) o hiperalgesia (respuesta dolorosa exagerada).

FARMACOCINÉTICA:

En perros, la biodisponibilidad oral es de aproximadamente 80% a una dosis de 50 mg/kg. Los niveles plasmáticos máximos ocurren aproximadamente 2 horas después de la administración. La eliminación se realiza principalmente vía renal, pero gabapentina se metaboliza parcialmente a N-metil-gabapentina. La vida media de eliminación es aproximadamente 2-4 horas en perros. En gatos, la gabapentina se absorbe bien después de la administración oral con un promedio de biodisponibilidad del 90%, pero hay variación significativa entre pacientes (50% a 120%).



Los niveles máximos ocurrieron aproximadamente 100 minutos después de la administración. El volumen de distribución es relativamente bajo ($V_{d_{ss}}$ aparente de 0.65 L/kg). La depuración es de aproximadamente 3 mL/min/kg y la vida media de eliminación es de 2.8 horas, similar a la de los perros.

INDICACIONES:

CLOZEPAXEL® 100 y 400 puede ser útil como terapia adyuvante para convulsiones parciales refractarias o complejas. Así como para el tratamiento adyuvante de epilepsia idiopática con el uso de fenobarbital y/o bromuro de potasio.

Además se indica como analgésico mostrando mayor eficacia en el tratamiento del dolor crónico, en particular en el dolor de tipo neuropático tanto en perros como en gatos. Se indica en el manejo polimodal o multimodal del dolor sobre todo en dolor articular crónico como enfermedad articular degenerativa (EAD). Gabapentina no parece ser de uso significativo para el tratamiento del dolor agudo, pero puede ser beneficio cuando se administran preventivamente para dolor agudo (por ejemplo, antes de procesos quirúrgicos).

En oncología juega un papel muy importante para el manejo polimodal del dolor junto con la combinación de opioides en diversos tipos de neoplasias en perros y gatos.

DOSIFICACIÓN:

Caninos:

Para el tratamiento auxiliar de crisis convulsivas refractarias o epilepsia idiopática: dosis de 10 a 30 mg/kg, equivalente a una tableta de **CLOZEPAXEL® 100** por cada 3.3 a 10 kg o una tableta de **CLOZEPAXEL® 400** por cada 13.3 a 40 cada 6 a 12 horas. Se recomienda una dosis inicial y realizar ajustes (aumentar o disminuir la dosis) según lo requiera el paciente.

Para el tratamiento analgésico en dolor crónico como EAD y neuropático: dosis de 3 mg/kg, equivalente a una tableta de **CLOZEPAXEL® 100** para cada 33 kg o media tableta de **CLOZEPAXEL® 400** para cada 66.6 kg cada 24 horas, sin embargo la dosis puede ubicarse en un rango de 1.25 a 10 mg/kg, equivalente a una tableta de **CLOZEPAXEL® 100** por cada 10 a 80 kg o media tableta de **CLOZEPAXEL® 400** por cada 20 a 53 kg cada 24 horas.

Para el manejo analgésico de pacientes con cáncer: dosis de 5 a 10 mg/kg, equivalente a una tableta de **CLOZEPAXEL® 100** por cada 10 a 20 kg o una tableta de **CLOZEPAXEL® 400** por cada 40 a 80 kg cada 8 a 12 horas, esta dosis puede combinarse con otros tipos de analgésicos.

Felinos:

Para el tratamiento auxiliar de crisis convulsivas refractarias o epilepsia idiopática: dosis de 5 a 30 mg/kg, equivalente media tableta de **CLOZEPAXEL® 100** por cada 1.5 a 10 kg cada 8 a 12 horas. Se recomienda una dosis inicial y realizar ajustes (aumentar o disminuir la dosis) según lo requiera el paciente.

Para el tratamiento analgésico en dolor crónico como EAD y neuropático: dosis de 2.5 a 5 mg/kg, equivalente a un cuarto de tableta de **CLOZEPAXEL® 100** por cada 5 a 10 kg cada 12 horas, sin embargo la dosis puede ubicarse en un rango de 1.25 a 10 mg/kg, equivalente a un cuarto de tableta de **CLOZEPAXEL® 100** por cada 2.5 a 20 kg cada 24 horas.

Puede iniciarse con una dosis de 5 mg/kg y aumentarse hasta 10 mg/kg si no se observan efectos en dos horas.

Para el manejo analgésico de pacientes con cáncer: dosis de 3 mg/kg, equivalente a un cuarto de tableta de **CLOZEPAXEL® 100** por cada 8 kg cada 12 a 24 horas, esta dosis puede combinarse con otros tipos de analgésicos.



CONTRAINDICACIONES:

CLOZEPAXEL® 100 y 400 está contraindicado en pacientes hipersensibles a la fórmula. En perros la gabapentina se metaboliza por vía renal, entre un 30-40%, por lo que puede ser necesario el ajuste de la dosis en pacientes con disfunción renal grave.

INTERACCIÓN CON OTRAS DROGAS:

Se ha mencionado interacción con la administración simultánea con antiácidos orales ya que se puede disminuir el porcentaje de biodisponibilidad en un 20%, si se requiere la administración conjunta con antiácidos, se recomienda realizar la administración separada al menos con 2 horas de intervalo entre cada droga.

La administración conjunta con morfina puede aumentar los niveles séricos de gabapentina.

EFFECTOS SECUNDARIOS:

Los efectos adversos más notorios son la sedación o la ataxia. Por lo cual se recomienda iniciar con la dosis inferior del rango y aumentar con el tiempo.

Otros efectos adversos que pueden presentarse son mareos, somnolencia y edema periférico. La suspensión abrupta del tratamiento puede dar lugar a la aparición de convulsiones por extracción-precipitación, se recomienda realizar dosis de reducción antes de suspender el tratamiento cuando se utiliza en el tratamiento de la epilepsia.

VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Oral.

ADVERTENCIAS:

- Producto de uso exclusivo en medicina veterinaria, no se use en humanos.
- Consérvese a temperatura ambiente a no más de 30°C en un lugar seco.
- No se deje al alcance de los niños o animales domésticos.

- No discontinuar su administración de manera abrupta, realizar dosis de reducción.

PRESENTACION:

CLOZEPAXEL® 100: Caja con 10 y 90 tabletas.

CLOZEPAXEL® 400: Caja con 10 y 90 tabletas.

Consulte al Médico Veterinario Zootecnista (Información exclusiva para Médicos Veterinarios Zootecnistas).

Su venta requiere receta médica cuantificada

La presentación de cualquier reacción adversa deberá ser reportada a la Unidad de Farmacovigilancia de PiSA Agropecuaria.

Responsables del contenido:

Departamento Técnico, PiSA Agropecuaria S.A. de C.V.

