МИНЗДРАВ РОССИИ
№ П N013419/01-231120
СОГЛАСОВАНО

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Сустанон®-250

Регистрационный номер: П N013419/01

Торговое наименование: Сустанон®-250

Группировочное наименование: тестостерон (смесь эфиров)

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения [масляный]

СОСТАВ

Действующие вещества: тестостерона деканоат 100,0 мг, тестостерона изокапронат 60,0 мг, тестостерона фенилпропионат 60,0 мг, тестостерона пропионат 30,0 мг.

Вспомогательные вещества: бензиловый спирт 104,6 мг, арахиса масло до 1,0 мл.

ОПИСАНИЕ

Прозрачный, светло-желтый масляный раствор.

Фармакотерапевтическая группа: андроген.

Код АТХ: G03BA03

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Препарат Сустанон®-250 представляет собой смесь эфиров тестостерона, аналогичного природному мужскому гормону тестостерону, в масляном растворе. Тестостерон вырабатывается в мужских половых железах и клетках Лейдига и является основным эндогенным гормоном, необходимым для

развития мужских половых органов (предстательной железы, семенных пузырьков, полового члена и мошонки) и вторичных половых признаков у мужчин (развитие и распределение волос по мужскому типу, расширение гортани; изменение тембра голоса, мускулатуры тела и распределения жира). У взрослых мужчин тестостерон необходим для функционирования яичек и придатка яичка, предстательной железы и семенных пузырьков, а также для поддержания либидо, хорошего самочувствия и эректильной функции. Терапия мужчин с гипогонадизмом препаратом Сустанон®-250 приводит к клинически значимому повышению концентраций тестостерона, дигидротестостерона, эстрадиола и андростендиона в плазме, а также к снижению концентрации глобулина, связывающего половые гормоны (ГСПГ); концентрации лютеинизирующего и фолликулостимулирующего гормона (ЛГ и ФСГ соответственно) восстанавливаются до нормального значения. Терапия препаратом Сустанон®-250 уменьшает клинические симптомы дефицита тестостерона. Кроме того, увеличивается минеральная плотность костей и мышечная масса, у пациентов с ожирением снижается масса тела. В процессе лечения нормализуются сексуальные функции, включая эректильную функцию и либидо. При применении препарата снижаются концентрации в плазме крови липопротеинов высокой плотности (ЛПВП), липопротеинов низкой плотности (ЛПНП); повышается содержание гемоглобина и гематокрит, при этом не происходит клинически значимого изменения активности «печеночных» ферментов и простатического специфического антигена (ПСА). Терапия препаратом может вызвать увеличение размеров предстательной железы, при этом нарушения ее функции не наблюдается. У мужчин с гипогонадизмом и сопутствующим сахарным диабетом применение андрогенов улучшает чувствительность к инсулину и/или снижает концентрацию глюкозы в плазме крови.

Применение андрогенов у женщин-транссексуалов способствует маскулинизации.

Фармакокинетика

Абсорбция

Препарат Сустанон®-250 содержит 4 разных эфира тестостерона, каждый из которых имеет разную продолжительность действия. Эти эфиры гидролизуются до тестостерона, как только попадают в общий кровоток.

Максимальная концентрация тестостерона в плазме крови (C_{max}) составляет 70 нмоль/л и достигается в течение 24 - 48 часов после инъекции однократной дозы.

Концентрация тестостерона возвращается к исходному показателю через 21 день после введения препарата.

Распределение

В плазме крови тестостерон приблизительно на 98% связывается со специфической фракцией глобулинов, связывающих тестостерон и эстрадиол.

Метаболизм

Тестостерон биотрансформируется в печени естественным путем до дигидротестостерона и эстриола.

Выведение

Выводится в основном почками (до 90 %) в виде конъюгатов этиохоланолона и андростерона. Около 6 % от введенной дозы выводится с желчью через кишечник в несвязанной форме.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Заместительная терапия тестостероном при первичном или вторичном гипогонадизме у мужчин при наличии клинических симптомов и подтверждения дефицита тестостерона лабораторными данными.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

• Гиперчувствительность к действующим веществам препарата (тестостерона деканоату, тестостерона изокапронату, тестостерона

фенилпропионату и тестостерона пропионату) и/или к любому вспомогательному веществу в составе препарата.

- Аллергические реакции на арахис или сою
- Рак предстательной железы (диагностированный или подозрение на него)
- Рак грудной железы (диагностированный или подозрение на него)

С осторожностью

У пациентов в возрасте старше 65 лет, с артериальной гипертензией, тромбофилическими состояниями, тяжелой степенью печеночной, хронической почечной и сердечной недостаточности; с ишемической болезнью сердца (со склонностью к отекам), с сахарным диабетом, доброкачественной гипертрофией предстательной железы, эпилепсией, мигренью; с синдромом апноэ в анамнезе, а также с такими факторами риска, как ожирение и хронические заболевания легких.

Дети

У мальчиков в препубертатном периоде необходимо применять препарат Сустанон®-250 с осторожностью, так как безопасность и эффективность у детей и подростков изучены недостаточно.

ПРИМЕНЕНИЕ ВО ВРЕМЯ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

Препарат Сустанон®-250 не показан для применения у женщин, в связи с чем его применение в период беременности и грудного вскармливания противопоказано. Применение тестостерона в период беременности может привести к вирилизации плода женского пола.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Препарат Сустанон®-250 следует вводить глубоко внутримышечно (в ягодичную мышцу).

Режим дозирования препарата зависит, как правило, от индивидуальной реакции пациента на терапию.

Обычно вводится по 1 мл препарата 1 раз в 3 недели (1 инъекция препарата через 21 день).

Применение препарата в особых клинических группах пациентов

У пожилых пациентов (старше 65 лет)

Имеющиеся ограниченные данные не указывают на необходимость коррекции дозы препарата Сустанон®-250 у пациентов пожилого возраста.

У детей и подростков до 18 лет

У мальчиков в препубертатном периоде необходимо применять препарат Сустанон®-250 с осторожностью, так как безопасность и эффективность у детей и подростков изучены недостаточно. (см. раздел «Особые указания»).

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Возможные нежелательные реакции при применении тестостерона распределены по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения согласно рекомендациям ВОЗ: часто (≥ 1/100, <1/10) и частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Доброкачественные, злокачественные и неуточненные новообразования (включая кисты и полипы)

Частота неизвестна: рак предстательной железы[1].

Нарушения со стороны половых органов и грудной железы

Частота неизвестна: нарушение эякуляции, гинекомастия (феминизация), олигоспермия, приапизм, доброкачественная гиперплазия предстательной железы[2].

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани

Частота неизвестна: миалгия.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Частота неизвестна: кожный зуд, акне.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания

Частота неизвестна: задержка жидкости.

Часто: увеличение массы тела.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Частота неизвестна: тошнота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Частота неизвестна: нарушение функции печени.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Частота неизвестна: полицитемия.

Нарушения со стороны сосудов

Частота неизвестна: артериальная гипертензия (повышение артериального давления).

Нарушения психики

Частота неизвестна: депрессия, нервозность, изменение настроения, изменение либидо.

Лабораторные и инструментальные данные

Частота неизвестна: снижение концентрации ЛПВП, ЛПНП и триглицеридов[3], увеличение ПСА.

Часто: увеличение содержания гемоглобина и гематокрита, количества эритроцитов.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Частота неизвестна: воспаление и боль в месте инъекции, зуд, гиперемия.

[1] Прогрессирование доклинических стадий рака предстательной железы

[2] Рост предстательной железы (до эугонадного состояния)

[3] Снижение концентраций ХС-ЛПНП, ХС-ЛПВП и триглицеридов в сыворотке крови

Дети

У мальчиков в препубертатном периоде, принимающих андрогены, отмечались следующие нежелательные эффекты (см. раздел «Особые указания»): преждевременное половое созревание, увеличение частоты эрекции, увеличение полового члена и преждевременное закрытие эпифизов.

После прекращения терапии препаратом Сустанон®-250 нежелательные реакции сохраняются еще определенное время.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Острая токсичность препарата Сустанон®-250 при внутримышечном введении очень низкая. Приапизм у мужчин является симптомом хронической передозировки. В случае развития приапизма терапию препаратом Сустанон®-250 следует временно прекратить и после исчезновения указанного симптома возобновить в более низких дозах.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Лекарственные средства, индуцирующие или ингибирующие ферменты, могут соответственно снижать или повышать концентрацию тестостерона. Следовательно, может потребоваться коррекция дозы препарата Сустанон®-250.

Пероральные антикоагулянты

При совместном применении с непрямыми пероральными антикоагулянтами (производными кумарина) тестостерон может усиливать их действие, в связи с чем необходим частый мониторинг протромбинового времени и, при необходимости, снижение дозы антикоагулянтов.

Инсулин и другие гипогликемические препараты

Андрогены могут повышать толерантность к глюкозе и снижать потребность пациента в инсулине или других гипогликемических препаратах, поэтому пациенты с сахарным диабетом должны периодически проводить контроль гликемии на фоне терапии тестостероном, особенно в начале и в конце терапии.

Адренокортикотропный гормон (АКТГ), глюкокортикостероиды (ГКС)

Сопутствующее введение АКТГ или ГКС может вызвать усиление периферических отеков, особенно у пациентов с заболеваниями печени, сердца или склонностью к образованию отеков.

Лекарственные средства, индуцирующие ферменты печени

Индукторы микросомальных ферментов печени при одновременном

применении могут снижать концентрацию тестостерона в плазме крови, что может потребовать коррекции дозы тестостерона.

Лекарственные средства, ингибирующие ферменты печени

Ингибиторы микросомальных ферментов печени при одновременном применении могут повышать концентрацию тестостерона в плазме крови, что также может потребовать коррекции дозы тестостерона.

Влияние на результаты лабораторных исследований

Андрогены могут снижать концентрацию тироксинсвязывающего глобулина, что, в свою очередь, приводит к снижению концентрации трийодтиронина (Т4). Концентрация свободного тироксина (Т3) не изменяется. Клинических проявлений дисфункции щитовидной железы не выявлено.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Препарат Сустанон®-250 предназначен исключительно для внутримышечных инъекций.

Внимание: в случае болезненной эрекции введение лекарственного препарата следует прекратить.

Медицинское обследование

Концентрация тестостерона должна контролироваться в начале введения и регулярно во время лечения. Врач должен корректировать дозировку индивидуально, чтобы обеспечить концентрацию тестостерона при нормальной функции гонад. Определение концентрации тестостерона должно быть проведено до начала терапии препаратом, а также 1 раз в 3 месяца в течение первого года терапии, далее - 1 раз в год необходимо проводить пальцевое ректальное исследование предстательной железы и определение концентрации ПСА с целью исключения доброкачественной гиперплазии предстательной железы и субклинического рака предстательной железы.

У пациентов, получающих длительную терапию андрогенами, необходимо регулярно контролировать следующие лабораторные параметры: гемоглобин

и гематокрит, показатели функции печени и липидный профиль.

Новообразования

У пациентов с раком грудной железы и метастазами в кости развивается гиперкальциемия или спонтанно (на фоне злокачественного новообразования), или на фоне терапии андрогенами/анаболическими стероидами. У таких пациентов рекомендуется регулярный контроль концентрации кальция в плазме крови. В случае выявления гиперкальциемии введение тестостерона следует прекратить и провести соответствующее лечение. Терапия тестостероном может быть продолжена только после восстановления нормальной концентрации кальция в плазме крови.

Тяжелая степень печеночной, хронической почечной и сердечной недостаточности, ишемическая болезнь сердца.

Лечение тестостероном может вызывать задержку натрия и воды в организме. В случае развития у таких пациентов серьезных осложнений, характеризующихся периферическими отеками при наличии или отсутствии хронической сердечной недостаточности, требуется прекращение терапии тестостероном.

Артериальная гипертензия

Тестостерон может вызвать повышение артериального давления, поэтому препарат Сустанон®-250 следует применять с осторожностью у пациентов с артериальной гипертензией.

Нарушение свертываемости крови

Следует проявлять осторожность при применении тестостерона у пациентов с тромбофилией или факторами риска венозного тромбоэмболизма (ВТЭ), поскольку анализ пострегистрационных исследований показал наличие тромбоэмболические осложнений (например, тромбоз глубоких вен, эмболия легочной артерии, тромбоз центральной вены сетчатки глаза (ЦВС)) у этих пациентов на фоне лечения тестостероном. Необходимо тщательно оценить продолжение применения тестостерона даже после первого тромботического события. В случае продолжения терапии следует принять дополнительные

меры для минимизации индивидуального риска ВТЭ.

Антикоагулянтная терапия

Андрогены в целом и Сустанон®-250 в частности могут усилить антикоагулянтное действие препаратов кумаринового ряда (см. также раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

Эпилепсия и мигрень (или наличие этих состояний в анамнезе)

Применение препарата у пациентов с эпилепсией и мигренью должно проводиться под тщательным медицинским наблюдением, так как возможно ухудшение течения заболеваний на фоне терапии (задержка жидкости и натрия в организме).

Синдром апноэ во сне

Необходимо соблюдать осторожность при лечении мужчин с синдромом апноэ во сне. Есть данные, что тестостерон может усугублять проявления апноэ во сне. В любом случае доказательства безопасности тестостерона у мужчин с данным состоянием отсутствуют. Необходимо провести надлежащую клиническую оценку и соблюдать осторожность при лечении пациентов с такими факторами риска, как ожирение или хронические заболевания легких.

Дети

У мальчиков в препубертатном периоде необходимо контролировать рост и половое развитие, поскольку андрогены в целом и Сустанон®-250 в частности в высоких дозах могут ускорять закрытие эпифизов и половое созревание.

Пожилые пациенты

У пожилых пациентов наблюдается повышенный риск развития гиперплазии или рака предстательной железы. Перед и во время лечения следует проверить состояние предстательной железы и контролировать концентрацию ПСА.

Существует ограниченный опыт в области безопасности и эффективности применения препарата Сустанон®-250 у пациентов старше 65 лет. В

настоящее время нет консенсуса относительно соответствующих возрасту рекомендованных показателей концентрации тестостерона. Однако следует учитывать, что физиологическая концентрация тестостерона в плазме крови уменьшается с возрастом.

Применение препарата у пациентов с наличием аллергии на арахис или сою противопоказано.

В случае развития нежелательных реакций, связанных с тестостероном, терапию препаратом Сустанон®-250 прекращают и возобновляют ее с более низкой дозы препарата.

Влияние тестостерона на результаты допинг-проб у спортсменов

Пациенты, участвующие в соревнованиях, контролируемых Всемирным антидопинговым агентством (ВАДА), должны изучить положения Всемирного антидопингового кодекса до начала лечения препаратом Сустанон®-250, поскольку он может повлиять на результаты допинг-проб. Применение андрогенов, в том числе и тестостерона, с целью повышения спортивной выносливости сопряжено с серьезными рисками для здоровья и неприемлемо.

ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ ТРАНСПОРТНЫМИ СРЕДСТВАМИ И МЕХАНИЗМАМИ

Применение препарата Сустанон®-250 не оказывает влияния на способность к управлению транспортными средствами и механизмами.

ФОРМА ВЫПУСКА

Раствор для внутримышечного введения [масляный], 250 мг/мл.

По 1 мл в ампулу из бесцветного стекла гидролитического класса I. На верхней части ампулы - кольца красного и желтого цвета и точка синего цвета. Одна ампула, зафиксированная при помощи двух фиксаторов, в картонной пачке с инструкцией по применению.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

При температуре 8 - 30 °С, в защищенном от света месте.

Хранить в недоступном для детей месте.

СРОК ГОДНОСТИ

5 лет.

Не применять по истечении срока годности.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА

Отпускают по рецепту.

ВЛАДЕЛЕЦ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Аспен Фарма Трейдинг Лимитед, Ирландия

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

ЭВЕР Фарма Йена ГмбХ, Германия

Отто-Шотт-Штр. 15, 07745 Йена, Германия

ОРГАНИЗАЦИЯ, ПРИНИМАЮЩАЯ ПРЕТЕНЗИИ ОТ ПОТРЕБИТЕЛЕЙ

ООО «Аспен Хэлс»

123112, г. Москва, Пресненская наб., д. 6, стр. 2.

Тел.: +7 (495) 969-20-51;

факс: +7 (495) 969-20-53

Общество с ограниченной ответственностью «Аспен Хэлс» Limited Liability Company Aspen Health ИНН 7703812312 ОГРН 1 КПП 770301001 МОСКВА

Младший специалист по регистрации Боброва Н.С.

ООО «Аспен Хэлс»