МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-001702-170320
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ТЕСТОСТЕРОНА ПРОПИОНАТ

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Тестостерона пропионат

Международное непатентованное наименование: тестостерон

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения [масляный]

Состав:

Действующее вещество:

тестостерона пропионат – 10 мг или 50 мг

Вспомогательное вещество: оливковое масло – до 1 мл.

Описание: прозрачная маслянистая жидкость светло-желтого цвета.

Примечание. В процессе хранения допускается выпадение кристаллов или кристаллизация всего содержимого ампулы. В случае выпадения кристаллов или кристаллизации всего содержимого ампулы, ампулу следует нагреть в кипящей водяной бане при встряхивании. Если кристаллы исчезнут и раствор станет прозрачным, а при охлаждении до 36 - 38 °С кристаллы не выпадут вновь, препарат годен к применению.

Фармакотерапевтическая группа: андроген

Код АТХ: G03BA03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Андрогенное средство, оказывает также анаболическое действие. В клетках-мишенях (кожа, предстательная железа, семенные пузырьки, эпидидимус) восстанавливается 5-альфа-редуктазой до 5-альфа-дигидротестостерона, который специфически взаимодействует с рецепторами на поверхности клеток и проникает в ядро. В некоторых тканях (в т.ч. в гипоталамусе) превращается в эстрадиол. У мужчин стимулирует развитие и деятельность гонад, предстательной железы, семенных пузырьков, формирование вторичных мужских признаков (рост, низкий голос, рост бороды и усов), повышает либидо и потенцию; опосредованно, через центральную нервную систему, влияет на половое поведение. Уменьшает отложение жира и выведение микроэлементов. Подавляет выработку и

высвобождение гипофизом лютеинизирующего гормона и фолликулостимулирующего гормона. Обладает анаболическими эффектами: участвует в росте скелета, увеличивает массу скелетной мускулатуры; вызывает задержку азота, фосфора, ионов калия, серы, необходимых для синтеза белка.

Фармакокинетика

Всасывание: максимальная концентрация после внутримышечного введения препарата наблюдается через 2,5-5 ч.

Распределение: в крови тестостерон связывается (около 98 %) со специфической фракцией глобулинов, связывающих тестостерон и эстрадиол.

Метаболизм: тестостерон метаболизируется, главным образом, в печени с образованием малоактивного андростерона и неактивного этиохоланолона.

Выведение: выводится в виде метаболитов, главным образом почками и через кишечник (около 6 %). Период полувыведения - 3-4 ч.

Показания к применению

У мужчин: заместительная терапия при первичном и вторичном гипогонадизме (задержка полового созревания, гипопитуитаризм, евнухоидизм, посткастрационный синдром, олигоспермия).

У женщин: прогрессирующий неоперабельный метастатический рак молочной железы.

Противопоказания

– повышенная чувствительность к тестостерону или любому другому компоненту препарата;

– рак предстательной железы;

– рак грудной железы;

– гинекомастия;

– нефротическая стадия хронического гломерулонефрита;

– гипертрофия предстательной железы с задержкой мочи;

– печеночная/почечная недостаточность;

– гиперкальциемия;

– хроническая сердечная недостаточность;

– сахарный диабет;

– инфаркт миокарда в анамнезе;

– распространенный атеросклероз.

С осторожностью

Астеническое телосложение, пожилой возраст у мужчин, у мужчин с артериальной гипертензией, у пациентов с эпилепсией, у пациентов с мигренью, у пациентов с ишемической

болезнью сердца, склонных к отекам, подростковый возраст у мальчиков (перед периодом полового созревания), доброкачественная гиперплазия предстательной железы.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Препарат вводят внутримышечно. Перед применением ампулу с препаратом необходимо нагреть до 30 - 40 °С.

Мужчинам при гипогонадизме: по 25 мг ежедневно или по 50 мг через 1-2 дня, или по 100-200 мг 1 раз в 15 дней. Срок лечения зависит от эффективности терапии и характера заболевания. После улучшения клинической картины применяют поддерживающие дозы – 5-10 мг ежедневно или через день, либо переходят на прием внутрь метилтестостерона.

Женщинам при прогрессирующем неоперабельном метастатическом раке молочной железы: по 100 мг ежедневно или через день в течение 1 месяца с последующим снижением дозы до 50 мг ежедневно в течение нескольких месяцев или по 50 мг ежедневно в течение нескольких месяцев. Далее, в зависимости от результатов лечения, дозу уменьшают и длительно назначают поддерживающие дозы (100-200 мг через 1-2 недели).

Применение препарата в особых клинических группах:

Пациенты с нарушениями функции почек: препарат может вызывать задержку жидкости в организме, поэтому пациенты с нарушениями функции почек должны находиться под наблюдением врача. Данный препарат противопоказан к применению пациентам с гипертрофией предстательной железы с задержкой мочи и почечной недостаточностью (см. раздел «Противопоказания»).

Пациенты с нарушениями функции печени: данный препарат противопоказан к применению пациентам с печеночной недостаточности (см. раздел «Противопоказания»).

Пациенты с сахарным диабетом: данный препарат противопоказан к применению пациентам с сахарным диабетом (см. раздел «Противопоказания»).

Подростки: применять с осторожностью перед периодом полового созревания у мальчиков (см. раздел «С осторожностью»).

Пациенты пожилого возраста: данный препарат применять с осторожностью в пожилом возрасте у мужчин (см. раздел «С осторожностью»).

Побочное действие

Нежелательные реакции (НР) распределены по системно-органным классам в соответствии со словарем MedDRA и классификацией частоты развития НР ВОЗ: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100 до <1/10), нечасто (≥1/1000 до <1/100), редко (≥1/10000 до <1/1000), очень

редко (<1/10000), частота неизвестна (частота не может быть определена на основе имеющихся данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:

часто – полицитемия;

нечасто – повышение гематокрита, повышение гемоглобина, увеличение количества эритроцитов.

Нарушения со стороны иммунной системы:

нечасто – гиперчувствительность, аллергические реакции.

Нарушения со стороны эндокринной системы:

нечасто - у женщин – нарушение менструального цикла, аменорея, торможение секреции гонадотропина, маскулинизация, гирсутизм; у мужчин – гинекомастия, приапизм, олигоспермия, нарушение сперматогенеза; у мальчиков – преждевременное половое созревание, преждевременное закрытие эпифизов костей, увеличение массы тела, боль в грудной железе и яичках.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания:

нечасто - задержка солей натрия и воды, повышение уровня холестерина и триглицеридов в плазме крови, гиперкальциемия, повышение аппетита, повышение содержания гликозилированного гемоглобина.

Нарушения психики:

нечасто – депрессия, нарушения в эмоциональной сфере, бессонница, беспокойство, агрессивность, раздражительность.

Нарушения со стороны нервной системы:

нечасто - головокружение, головная боль, мигрень, тремор.

Нарушения со стороны сосудов:

нечасто – повышение артериального давления.

Нарушения со стороны сердца:

нечасто – нарушение функции сердечно-сосудистой системы.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

нечасто – бронхит, синусит, кашель, одышка, храп, дисфония.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:

нечасто – тошнота, диарея.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

нечасто – холестатическая желтуха, отклонения в «печеночных» тестах, повышение активности аспартатаминотрансферазы.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

нечасто – угри, акне, себорея, сухость кожи, алопеция, эритема, сыпь, папулезная сыпь, зуд.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани:

нечасто – миалгия, артралгия, боль в конечностях, мышечные спазмы, мышечное напряжение, скелетно-мышечная ригидность, повышение активности креатинфосфокиназы в крови.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

нечасто – задержка мочи, никтурия, дизурия, уменьшение объема выделяемой мочи, нарушение функции мочевыводящих путей.

Нарушения со стороны половых органов и молочной железы:

часто – приливы, повышение уровня простат-специфического антигена, патологические результаты обследования предстательной железы, доброкачественная гиперплазия предстательной железы;

нечасто – усиление или снижение либидо, уплотнение в молочной железе, повышение концентрации эстрадиола, повышение концентрации свободного тестостерона в сыворотке крови, у мужчин – частая эрекция, снижение объема эякулята, простатит, интраэпителиальная неоплазия предстательной железы, уплотнение предстательной железы, нарушение функции предстательной железы.

Общие расстройства и нарушения вместе введения:

часто – различные виды реакций в месте введения (боль, дискомфорт, зуд, отек, гематома, раздражение в месте введения);

нечасто – повышенная утомляемость, астения, гипергидроз, ночная потливость.

Передозировка

Симптомы: приапизм.

Лечение: прекращение терапии до исчезновения симптомов, с последующим назначением меньших доз.

Взаимодействия с другими лекарственными средствами

При одновременном применении с индукторами ферментов микросомального окисления (барбитураты, рифампицин и др.) возможно снижение эффективности тестостерона.

Повышает эффект непрямых антикоагулянтов (варфарин, никумалон, фенилин), что может привести к необходимости корректировки дозы. Независимо от данного факта, в качестве общего правила следует всегда соблюдать ограничения, касающиеся внутримышечных инъекций пациентам с приобретенными или наследственными нарушениями свертываемости крови.

Повышает эффект гипогликемических средств. Может появиться необходимость снизить

дозу гипогликемического препарата.

Ингибирует выведение циклоспорина, увеличивает концентрацию оксифенбутазона в плазме крови.

При одновременном применении тестостерона с АКТГ (адренокортикотропный гормон) или глюкокортикостероидами увеличивается риск развития отеков.

Особые указания

Следует контролировать концентрацию тестостерона в начале лечения и регулярно во время лечения. Доза препарата должна быть подобрана индивидуально, чтобы обеспечить регулирование эугонадального уровня тестостерона.

Пациентам с артериальной гипертензией, мигренью, эпилепсией необходим во время лечения регулярный врачебный контроль. У указанных групп пациентов препарат необходимо применять с осторожностью.

У пациентов, страдающих тяжелой сердечной, печеночной или почечной недостаточностью или ишемической болезнью сердца лечение препаратами тестостерона может вызвать осложнения, характеризующиеся отеками с хронической сердечной недостаточностью или без нее. В этом случае лечение должно быть немедленно прекращено (см. разделы «Противопоказания», «С осторожностью»).

Существующий синдром апноэ во сне может усилиться, особенно при наличии факторов риска, таких как ожирение и хронические респираторные заболевания.

Данные по эффективности и безопасности применения пациентами в возрасте старше 65 лет препаратов тестостерона ограничены. В настоящее время нет согласованных данных по возрастным ограничениям при применении тестостерона, однако необходимо принять во внимание, что с увеличением возраста физиологическая концентрация тестостерона в сыворотке понижается.

Использование тестостерона для лечения детей наряду с маскулинизацией может вызывать ускорение роста и созревание костной ткани, а так же преждевременное замыкание зоны роста эпифиза, что в результате приведет к снижению конечного роста. Поэтому препарат необходимо применять с осторожностью у мальчиков подросткового возраста перед периодом полового созревания. Возможно появление обыкновенных угрей.

Как и все масляные растворы, тестостерон следует вводить только внутримышечно и очень медленно, чтобы избежать микроэмболии легочной артерии масляным раствором препарата, которая может проявляться такими симптомами, как кашель, одышка, недомогание, гипергидроз, боль за грудиной, головокружение, парестезии или обморок. Эти реакции могут развиваться во время инъекции или непосредственно после нее и носят обратимый характер. Лечение, как правило, поддерживающее, например, введение дополни-

тельного кислорода.

У пациентов женского пола при получении высоких доз возможно развитие вирилизма.

При применении препарата Тестостерона пропионат у спортсменов необходимо принимать во внимание тот факт, что этот препарат содержит действующее вещество (тестостерон), который может давать положительную реакцию в антидопинговых тестах.

Перед началом лечения у мужчин необходимо исключить диагноз рак предстательной железы, т.к. при применении андрогены повышают риск развития гиперплазии предстательной железы; применение андрогенов может способствовать росту уже имеющейся злокачественной опухоли.

В период лечения необходимо проводить регулярное исследование предстательной железы у мужчин.

На фоне лечения половыми стероидами отмечались редкие случаи доброкачественных и злокачественных опухолей печени с развитием внутрибрюшного кровотечения.

При возникновении в период лечения выраженных абдоминальных болей, увеличения печени, признаков внутрибрюшного кровотечения, следует учитывать вероятность опухоли печени при дифференциальном диагнозе.

У пациентов, принимающих андрогены в течение длительного периода, помимо лабораторных измерений концентрации тестостерона, периодически необходимо проверять следующие лабораторные показатели: гемоглобин, гематокрит (для выявления полицитемии), функциональные пробы печени и липидный профиль.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как препарат может вызывать побочные эффекты, которые могут влиять на указанные способности.

Форма выпуска

Раствор для внутримышечного введения [масляный] 10 мг/мл и 50 мг/мл.

По 1 мл в ампулы нейтрального стекла или бесцветного стекла первого гидролитического класса с точками надлома или кольцами.

По 10 ампул вместе с инструкцией по применению помещают в коробку из картона.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

По 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование, адрес производителя и адрес места производства лекарственного препарата / организация, принимающая претензии

ОАО «ДАЛЬХИМФАРМ», 680001, Российская Федерация, Хабаровский край, г. Хабаровск, ул. Ташкентская, 22, тел/факс (4212) 53-91-86.

Генеральный директор
ОАО «ДАЛЬХИМФАРМ»

Ю.П. Швец