

8442 - 2017



**Инструкция
(информация для специалиста)
по медицинскому применению лекарственного средства**

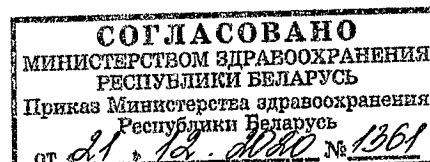
**СУСТЕН
(SUSTEN)
капсулы 100 мг и 200 мг**

МНН: Прогестерон (Progesterone)

Форма выпуска: капсулы

Описание

Мягкие желатиновые капсулы светло-бежевого цвета овальной формы, содержащие масляную суспензию бежевого цвета.



Состав

1 капсула содержит: прогестерон микронизированный 100 мг или 200 мг;
вспомогательные вещества: масло арахисовое, лецитин соевый, глицерин, желатин, титана диоксид, сорбитола раствор некристаллизующийся, вода очищенная.

Код АТХ:G03DA04

Фармакотерапевтическая группа: Половые гормоны и модуляторы половой системы. Прогестагены.

Фармакологические свойства

Сустен, в состав которого входит прогестерон в микронизированной форме, способен значительно повышать плазменные уровни прогестерона при пероральном и вагинальном применении, что позволяет восполнить недостаток эндогенного прогестерона.

Гестаген - гормон желтого тела. Связываясь с рецепторами на поверхности клеток органов-мишеней, проникает в ядро, где, активируя ДНК, стимулирует синтез РНК. Способствует переходу слизистой оболочки матки из фазы пролиферации, вызываемой фолликулярным гормоном, в секреторную фазу, а после оплодотворения - в состояние, необходимое для развития оплодотворенной яйцеклетки. Уменьшает возбудимость и сократимость мускулатуры матки и маточных труб, стимулирует развитие концевых элементов молочной железы.

Стимулируя протеинлипазу, увеличивает запасы жира, повышает утилизацию глюкозы, увеличивая концентрацию базального и стимулированного инсулина, способствует накоплению в печени гликогена; повышает выработку гонадотропных гормонов гипофиза; уменьшает азотемию, увеличивает выведение азота с мочой. Активирует рост секреторного отдела ацинусов молочных желез и индуцирует лактацию. Способствует развитию нормального эндометрия.

Фармакокинетика

При приеме внутрь

Всасывание

Микронизированный прогестерон хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте (ЖКТ). Концентрация прогестерона в плазме крови постепенно повышается в течение первого часа, максимальная концентрация в крови (C_{max}) отмечается через 1-3 ч после приема. После приема 200 мг концентрация прогестерона в плазме увеличивается с

8442 - 2017

0.13 нг/мл до 4.25 нг/мл через 1 ч и составляет 11.75 нг/мл через 2 ч, 8.37 нг/мл - через 3 ч, 2 нг/мл - через 6 ч, 1.64 нг/мл - через 8 ч.

Метаболизм

Метаболизируется в печени с участием изофермента CYP2C19. Основными метаболитами, которые определяются в плазме крови, являются 20-альфа-гидроксидельта-4-альфа-прегнанолон и 5-альфа-дигидропрогестерон.

Выведение

Выводится с мочой в виде метаболитов, 95% из них составляют глюкуронконъюгированные метаболиты, в основном 3-альфа, 5-бета-прегнандиол (прегнандион). Указанные метаболиты, которые определяются в плазме крови и в моче, аналогичны веществам, образующимся при физиологической секреции желтого тела.

При вагинальном введении

Всасывание

Абсорбция происходит быстро; прогестерон накапливается в матке; высокая концентрация прогестерона в плазме крови наблюдается через 1 ч после введения. Стах прогестерона в плазме крови достигается через 2-6 ч после введения. При введении лекарственного средства по 100 мг 2 раза/сут средняя концентрация 9.7 нг/мл сохраняется в течение 24 ч. При введении в дозах более 200 мг/сут, концентрация прогестерона соответствует I триместру беременности.

Метаболизм

Метаболизируется с образованием преимущественно 3-альфа, 5-бета-прегнандиола. Концентрация 5-бета-прегнандиола в плазме не увеличивается.

Выведение

Выводится с мочой в виде метаболитов, основную часть составляет 3-альфа, 5-бета-прегнандиол (прегнандион). Это подтверждается постоянным повышением его концентрации (Стах 142 нг/мл через 6 ч).

Фармакокинетика капсул «Сустен» при вагинальном введении не изучалась.

Приведенные данные о фармакокинетике прогестерона при вагинальном введении являются литературными.

Показания к применению

Прогестерон-дефицитные состояния у женщин.

Пероральный путь введения

Гинекология

- предменструальный синдром;
- нарушения менструального цикла, вызванные ановуляцией или дизовуляцией;
- доброкачественная мастопатия;
- пременопауза;
- менопаузальная заместительная гормонотерапия (в дополнение к эстрогенотерапии);
- бесплодие вследствие лютеиновой недостаточности.

Акушерство

- угрожающий самопроизвольный аборт и профилактика привычного выкидыша вследствие установленной недостаточности лютеиновой фазы;
- угроза преждевременных родов.

Вагинальный путь введения:

Гинекология

Снижение фертильности при первичном и вторичном бесплодии вследствие частичной или полной недостаточности лютеиновой фазы (дизовуляция, поддержка лютеиновой

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

8442 - 2017

фазы во время подготовки циклов экстракорпорального оплодотворения, донорство яйцеклеток)

Акушерство

- угрожающий самопроизвольный аборт и профилактика привычного выкидыша вследствие установленной недостаточности лютеиновой фазы;
- предупреждение (профилактика) преждевременных родов у женщин из группы риска (с укорочением шейки матки и/или наличием анамнестических данных преждевременных родов и/или преждевременного разрыва плодных оболочек).

Способ применения и дозы

Продолжительность лечения определяется характером и особенностями заболевания.

Пероральный путь введения.

Суспензии принимают внутрь после еды, запивая водой.

В большинстве случаев при недостаточности прогестерона суточная доза лекарственного средства Суспензия составляет 200-300 мг, разделенных на 2 приема (утром и вечером).

При недостаточности лютеиновой фазы (предменструальный синдром, нарушения менструального цикла, пременопауза, мастопатия) лечение проводится в течение 10 дней менструального цикла, как правило, с 17-го по 26-й день включительно.

Менопаузальная заместительная гормональная терапия: у женщин с интактной маткой монотерапия эстрогенами не рекомендуется, прогестерон добавляется в последние 2 недели каждого месячного курса лечения с последующим недельным перерывом, в течение которого возможно кровотечение.

При угрозе преждевременных родов: 400 мг прогестерона каждые 6-8 часов до купирования клинических симптомов с последующим переходом на поддерживающие дозы (например, 200 мг 3 раза в день) в срок беременности с 22-ой по 28-ую недели включительно.

Суточная доза лекарственного средства Суспензия составляет 200-300 мг разделенных на 2 приема (100 мг утром плюс 200 мг перед сном).

Вагинальный путь введения

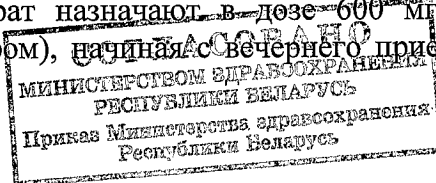
Средняя доза прогестерона составляет 200 мг в сутки (по одной капсуле 200 мг или две капсулы по 100 мг, разделенные на 2 приема – утром и вечером). Капсулы вводятся глубоко во влагалище. Доза может быть увеличена в зависимости от клинической ситуации и реакции пациента на лечение.

При недостаточности лютеиновой фазы (дисовуляция, нарушения менструального цикла) лечение проводится в течение 10 дней одного цикла, как правило, с 17-го по 26-й день включительно, дозировка составляет 200 мг прогестерона в сутки.

Предупреждение (профилактика) преждевременных родов у женщин из группы риска (с укорочением шейки матки и/или наличием анамнестических данных преждевременных родов и/или преждевременного разрыва плодных оболочек): обычная доза составляет 200 мг перед сном, с 20-ой по 34-ую недели беременности.

При полном отсутствии прогестерона у женщин с нефункционирующими или отсутствующими яичниками (донорство яйцеклеток): препарат назначается в дозе 100 мг в сутки на 13 и 14 день цикла, затем по 100 мг 2 раза в сутки утром и вечером с 15 по 25 день. С 26 дня и в случае наступления беременности доза увеличивается на 100 мг/сутки каждую неделю с целью достижения максимальной дозы 600 мг прогестерона в сутки, разделенных на 3 приема. Такая дозировка применяется до 60 дней.

С целью поддержки лютеиновой фазы во время проведения циклов экстракорпорального оплодотворения препарат назначают в дозе 600 мг в сутки, разделенной на 3 приема (утром, днем и вечером), начиная с вечернего приема в день переноса.



8442 - 2017

В случае угрожающего аборта или в целях профилактики привычного выкидыша вследствие недостаточности лютеиновой фазы средняя доза прогестерона составляет 200-400 мг в сутки, разделенная на два приема, вплоть до 12-й недели беременности. Дальнейшее применение лекарственного средства возможно по назначению лечащего врача на основании оценки клинических данных, функции плаценты и уровня прогестерона в крови беременной женщины.

Противопоказания

Гиперчувствительность к компонентам препарата, склонность к тромбозам, острые формы флебита или тромбоэмболических заболеваний; кровотечения из половых путей неясного генеза; аборт неполный, порфирия.

Установленные или подозреваемые злокачественные новообразования молочных желез и половых органов.

Пероральный прием – выраженные нарушения функции печени.

С осторожностью

Заболевания сердечно-сосудистой системы, артериальная гипертензия, хроническая почечная недостаточность, сахарный диабет, бронхиальная астма, эпилепсия, мигрень, депрессия, гиперлипотеинемия, период лактации.

Побочное действие

При оральном применении могут наблюдаться следующие явления:

Класс системы органов	Часто $\geq 1/100$; $< 1/10$	Нечасто $\geq 1/1000$; $\leq 1/100$	Редко $\geq 1/10000$; $\leq 1/100$ 0	Очень редко $\leq 1/10000$
Нарушения со стороны репродуктивной системы	Изменения менструального цикла Аменорея Межменструальные кровотечения	Мастодиния		
Нарушения со стороны нервной системы	Головная боль	Сонливость Преходящее головокружение		Депрессия
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта		Рвота Диарея Запор	Тошнота	
Нарушения со стороны гепатобилиарной системы		Холестатическая желтуха		
Нарушения со стороны иммунной системы		СОГЛАСОВАНО МИНИСТЕРСТВОм ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ Приказ Министерства здравоохранения Республики Беларусь		Крапивница
Нарушения со стороны кожи и подкожных		Зуд Акне		Хлоазма

8442 - 2017

тканей				
--------	--	--	--	--

Сонливость и/или скоропроходящее головокружение наблюдается, в частности, в случае сопутствующей гипозестрогении. Уменьшение дозы препарата или восстановление более высокой эстрогенизации немедленно устраняет эти явления, не снижая терапевтического эффекта прогестерона.

Если курс лечения начинается слишком рано (в первой половине менструального цикла, особенно до 15-го дня), возможно укорочение менструального цикла или ациклические кровотечения.

Регистрируемые изменения менструального цикла, аменорея или межменструальные кровотечения характерны для применения прогестагенов в целом.

При вагинальном пути введения

Возможно появление местного раздражения (в частности, на лецитин сои), однако в различных клинических исследованиях не было зафиксировано ни одного случая серьезной местной непереносимости (жжение, зуд или сухость).

Передозировка

Описанные выше побочные эффекты, как правило, являются признаком передозировки и спонтанно исчезают при снижении дозы.

У некоторых пациенток средняя терапевтическая доза может оказаться чрезмерной из-за имеющейся или возникшей нестабильной эндогенной секреции прогестерона, особой чувствительности к препарату или слишком низкой концентрации эстрадиола. В таких случаях необходимо:

- в случае сонливости или проходящего головокружения уменьшить суточную дозу прогестерона и применять препарат в вечернее время **перед сном** на протяжении 10 дней менструального цикла.
- в случае укорочения менструального цикла или мажущих кровянистых выделений рекомендуется перенести начало лечения на более поздний день цикла (например на 19-й вместо 17-го).
- в перименопаузе и при заместительной гормональной терапии в постменопаузе необходимо убедиться в том, что концентрация эстрадиола является оптимальной.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Усиливает действие диуретиков, гипотензивных лекарственных средств, иммунодепрессантов, антикоагулянтов. Уменьшает лактогенный эффект окситоцина.

Совместный прием Сустана с барбитуратами, фенитоином, рифампицином, фенилбутазоном, спиронолактоном, гризеофульвином, ампициллином, тетрациклином может привести к изменению действия лекарственного средства.

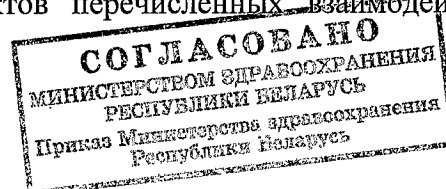
При заместительной гормональной терапии эстрогенами в период менопаузы настоятельно рекомендуется применение прогестерона не менее чем на 12 дней в течение цикла.

Сочетание со следующими лекарственными средствами может сопровождаться ускорением метаболизма прогестерона и изменением терапевтического эффекта:

-одновременное применение с мощными ферментативными индукторами, такими как барбитураты, противоэпилептические препараты (фенитон), рифампицин, фенилбутазон, спиронолактон, гризеофульвин, сопровождается ускоренным метаболизмом прогестерона печени.

-антибиотики (ампициллины, тетрациклины) вызывают нарушения в кишечной микрофлоре, что сопровождается изменениями энтерогапатического стероидного цикла.

Степень выраженности указанных взаимодействий может сильно варьировать у разных пациентов, поэтому прогноз клинических эффектов перечисленных взаимодействий затруднен.



8442 - 2017

Прогестагены могут вызвать снижение переносимости глюкозы, и из-за этого увеличить потребность в инсулине или других противодиабетических препаратах у больного диабетом. Биодоступность прогестерона может быть снижена у курящих пациенток при чрезмерном употреблении алкоголя.

Меры предосторожности

Сустен нельзя применять с целью контрацепции.

Сустен нельзя принимать вместе с пищей, так как прием пищи увеличивает биодоступность прогестерона.

Следует с осторожностью применять перорально при беременности у пациентов с нарушениями функции печени;

Если курс лечения начинается слишком рано в начале месячного цикла, особенно до 15-го дня цикла, могут иметь место укорачивания цикла и/или кровотечение. В случае маточных кровотечений не назначать препарат до уточнения их причины, включая исследования эндометрия.

Из-за тромбоэмболических и метаболических рисков, которых нельзя полностью исключить, следует прекратить применение препарата Сустен в случае возникновения: зрительных нарушений, таких как потеря зрения, двоение в глазах, сосудистые поражения сетчатки; венозной тромбоэмболии или тромботических осложнений, независимо от их локализации; сильных головных болей. При наличии тромбофлебитов в анамнезе, пациентка должна находиться под тщательным наблюдением.

В случае появления аминореи в процессе лечения, убедиться, что речь не идет о беременности.

Более 50% ранних самопроизвольных абортов вызваны генетическими осложнениями. Кроме этого, инфекционных процессы и механические повреждения могут быть причиной абортов на ранних сроках беременности. Применение прогестерона в этих случаях может привести лишь к задержке отторжения и эвакуации нежизнеспособного плодного яйца. Следовательно, назначение прогестерона по рекомендации врача должно быть предназначено для случаев, когда секреция желтого тела недостаточна.

Сустен содержит соевый лецитин и может вызвать реакции гиперчувствительности (крапивница и анафилактический шок).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Применение Сустена не противопоказано во время беременности, в том числе в первые недели.

Кормление грудью

Поступление прогестерона в грудное молоко не было изучено с точностью. Следовательно, его назначения следует избегать во время кормления грудью.

Применение у детей

Не показано.

Применение у пожилых (старше 65 лет)

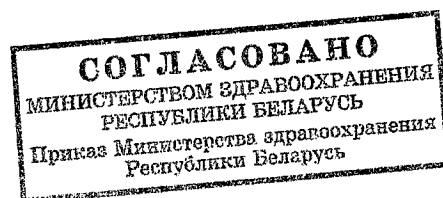
Клинические данные отсутствуют

Применение у пациентов с нарушенной функцией печени

Клинические данные отсутствуют

Применение у пациентов с нарушенной функцией почек

Клинические данные отсутствуют



8442 - 2017

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При пероральном приеме необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25° С.

Беречь от детей.

Срок хранения

2 года.

Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска

По рецепту врача.

**Упаковка**

Суспен, капсулы 100 мг

3 блистера по 10 капсул в картонной пачке с инструкцией по применению.

Суспен, капсулы 200 мг

1 блистер по 10 капсул в картонной пачке с инструкцией по применению.

Завод-производитель, страна

«Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд», Индия.



SUN
PHARMA

Sun House, Plot No.201 B/1, Western Express Highway,
Goregaon (E), Mumbai – 400 063, Maharashtra, INDIA