

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Retabolil 50 mg/ml solution for injection

Ретаболил 50 mg/ml инжекционен разтвор

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към РУ №	11-7650/19.06.03
Одобрено:	39 22.06.09
	11-6170/12.11.09

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка ампула от 1 ml съдържа 50 mg нандролонов деканоат (*nandrolone decanoate*).

За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ**4.1. Терапевтични индикации**

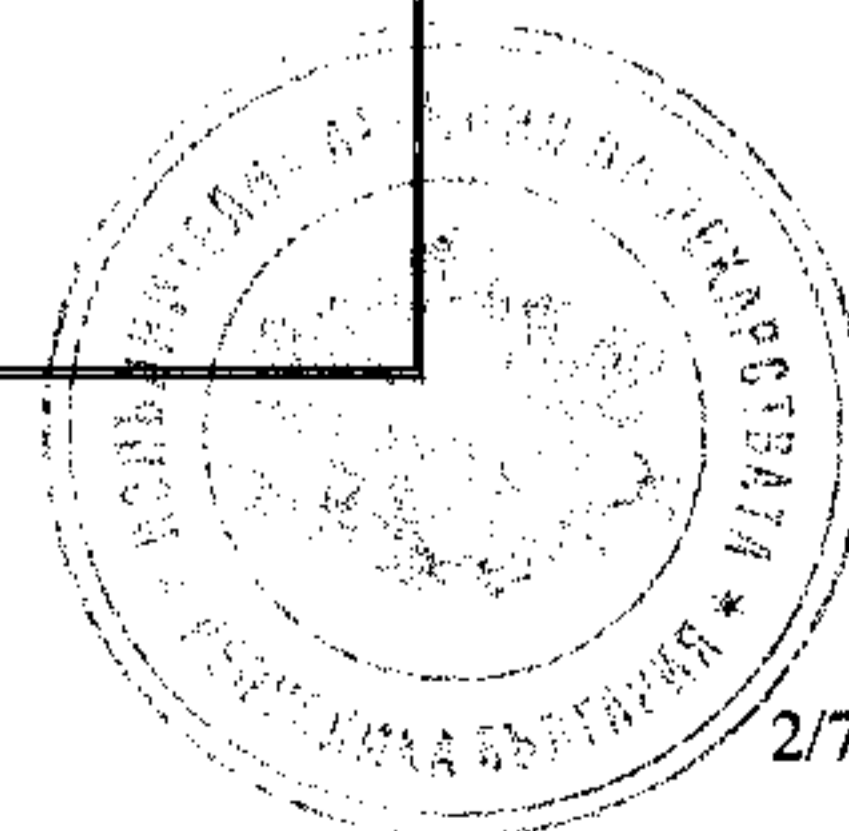
Остеопороза. Палиативно лечение на определени случаи на дисеминиран карцином на млечната жлеза. Допълнителна специфична терапия и при патологични състояния с отрицателен азотен баланс.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Ампулите Ретаболил се инжектират само интрамускулно.

Еднократната доза, както и дозовият интервал, трябва да се определят индивидуално при всеки отделен случай, съобразено с показанията, клиничните симптоми, изискванията и поносимостта. Следват схемите, които обикновено се прилагат при различни показания. В клиничната практика обикновено на възрастни се прилагат по 50 mg на всеки две или три седмици. В хирургията, урологията и офталмологията обичайната доза е 50 mg на всеки две или три седмици. В невропсихиатрията обикновено се прилагат по 50 mg на всеки две седмици за период от 3 месеца. В акушеро-гинекологичната практика обикновено схемата е по 50 mg през интервали от три седмици. В педиатрията дозата трябва да се определя съобразно телесното тегло, според следната таблица:

Телесно тегло kg	Доза за прилагане mg
1-10	5
10-20	7.5
20-30	10
30-40	15
40-50	20
над 50	25



Съответната доза може да бъде приложена повторно на всеки три или четири седмици. На недоносени може да се прилага доза от 1 до 2 mg Ретаболил на kg телесно тегло през интервали от 3 седмици за лечение на хипотрофията и атрофията. При наследствени дегенеративни заболявания на нервната система при деца в ранна възраст с телесно тегло от 3 до 10 kg може да се прилага доза от 12.5 mg веднъж седмично. При заболявания на нервната система на деца може да се прилага в доза 25 mg веднъж седмично в продължение на един до три месеца, последвано от пауза от няколко (две или четири) седмици. При необходимост лечението може да продължи с поддържащи дози от 12.5 до 25 mg, определени на базата на наддаване на теглото и симптоматично подобрене, които се прилагат на всеки три седмици.

Продължителността на лечението трябва да се установява индивидуално при всички индикации, в съответствие с клиничното подобрене. По правило курсът на лечение трае три месеца; след интервал от един до три месеца лечението може да бъде повторено при необходимост.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към активното вещество или към някои от помощните вещества.

При карцином на простатата и карцином на млечната жлеза при мъже не се препоръчва приложението на Ретаболил. При нефрозен синдром показанието за продължителна терапия с анаболни средства се обсъжда. Употребата на Ретаболил по време на бременност е противопоказана, поради риск от маскулинизация на плода. Освен това, лекарственият продукт е противопоказан по време на кърмене, при чернодробни заболявания и в случаите на дисфункция на черния дроб или метастази при пациенти с туморни заболявания.

Ретаболил ампули могат да се прилагат само по лекарско предписание.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Повишено внимание се изисква при прилагане на пациенти със сърдечно-съдови, чернодробни и бъбречни заболявания. Специално внимание е необходимо при болни с епилепсия, мигрена и глаукома (поради възможността за задръжка на натриеви йони и вода). При мъже е необходимо да се провежда ректално изследване на простатната жлеза преди и по време на лечението.

Всяка видима преципитация на инжекционния разтвор се разтваря, ако ампулата се постави в топла вода за няколко минути. Само кристално бистри разтвори могат да се инжектират.

4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

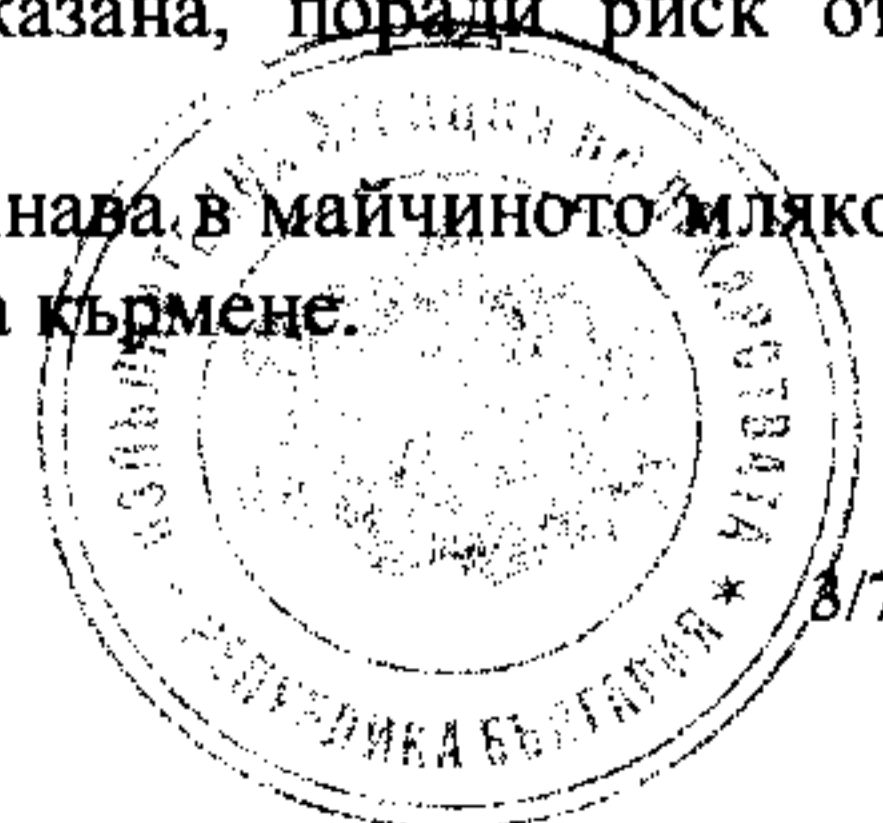
Да се избягва едновременното приложение със следните лекарства:

- антикоагуланти (антикоагулантното действие на кумариновите антикоагуланти може да се усили).
- антидиабетни средства (възможно е нуждата от инсулин да намалее).

4.6. Бременност и кърмене

По време на бременност употребата на Ретаболил е противопоказана, поради риск от маскулинизация на плода.

Не е известно дали активното вещество нандролонов деканоат преминава в майчиното мляко при човек. Инжектирането на Ретаболил не се препоръчва по време на кърмене.



4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Ретаболил не повлиява отрицателно способността за шофиране и работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

При парентерално приложение на Ретаболил в дози със стриктно следване на описаните схеми, обикновено не се проявяват нежелани реакции. В случай на продължително приложение се наблюдават следните нежелани лекарствени реакции, изброени според органични системи по-долу. Данни за честотата на нежеланите реакции не са налични.

Ендокринни нарушения

Потискане секрецията на гонадотропин, понижаване тембъра на гласа, потискане на овариалната функция и менструацията при жени

Нарушения на нервната система

Промяна в либидото

Гастроинтестинални нарушения

Гадене, повръщане

Хепатобилиарни нарушения

Холестаза, жълтеница

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Акне, леко изразен хирзутизъм

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан

Нарушения в растежа на костите, при деца е възможно да се наблюдава евентуално преждевременно затваряне на епифизата.

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

Задръжка на натрий и вода,

Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение

Отоци

Изследвания

Повишаване серумното ниво на уреята, положителен азотен баланс

Други нежелани реакции

Възможно е позитивиране на резултатите от чернодробните проби. При болни от захарен диабет нуждата от инсулин може да намалее по време на лечебния курс с Ретаболил, поради което се препоръчва редовен контрол на глюкозния толеранс. Терапията с Ретаболил не влияе върху функцията на жизненоважните органи (черен дроб, бъбреци).

Ретаболил ампулите могат да се използват при всяко показание, както в болничната, така и в амбулаторната практика.

4.9. Предозиране

Няма съобщения за случаи на предозиране.

Злоупотребата с нандролон съдържащи продукти (приемани във високи дози като анаболно средство) се свързва с тежки ендокринни, метаболитни и психиатрични нежелани реакции.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Анаболни стероиди АТС код: A14A B01

На базата на данни от проведени опити върху експериментални животни, при подкожно приложение на ниски дози (1 mg) нандролонов деканоат е наблюдавано 2.5-кратно увеличение на теглото на *musculus levator ani* при кастрирани плъхове за четири седмици. Това действие е директно свързано с дозата. Ефектът е бил очевиден в продължение на четири седмици, от третия ден нататък. В сравнение с подобни дози тестостерон пропионат, анаболното действие на нандролонов деканоат се е оказало 10.6 пъти по-силно изразено в края на втората седмица. На базата на по-нататъшни фармакологични изследвания е установено, че продължителността на ефекта на естерите на нандролон, свързани с различни органични киселини, е в зависимост от дължината на въглеродната верига на киселината. Дозата, необходима за осъществяване на анаболно действие, обикновено не води до поява на андрогенен ефект. Сред анаболните стероиди активната съставка на Ретаболил проявява удължено действие. При бозайници, както и при човешкия организъм, това води до задръжка на азот чрез намеса в белтъчния метаболизъм, следователно чрез стимулиране синтеза на протеини. Продуктът потиска декалцификацията на костната тъкан, стимулира еритропоезата и повлиява благоприятно въглехидратния и мастния метаболизъм. Изследванията са показали също намаляване на холестероловите депа в черния дроб и съдовите стени, вследствие на антихолестеролемичното действие на нандролонов деканоат. Посредством подобряване тонуса на напречно набраздената мускулатура се увеличава мускулната сила. Увеличаването на телесното тегло следователно е резултат от белтъчно-анаболното действие на лекарствения продукт. Ретаболил не е токсичен и не оказва увреждащо действие върху чернодробната и бъбречната функция, както и върху активността на трансаминазите или алкалната фосфатаза, нито причинява локално увреждане на тъканите.

При плъхове е доказано, че LD₅₀ при подкожно приложение е 1850 mg/kg. При изследвания на хроничната токсичност е установено, че дози от 25 mg/kg телесно тегло седмично не предизвикват никакви токсични симптоми при бозайници. Резултатите, получени при фармакологични изследвания на Ретаболил, са потвърдени посредством клиничко-фармакологични проучвания на клинични серии, които освен това са показали задоволително широкия спектър на нандролонов деканоат.

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция и дистрибуция

Тъй като нандролонов деканоат има депо действие, неговата абсорбция и дистрибуция се включват в един параграф.

Нандролонов деканоат се освобождава бавно от мястото на инжектиране в кръвта с време на полуживот 6 дни. В кръвната циркулация естерът се хидролизира бързо до нандролон с полуживот от 1 час или по-малко. Полуживотът на съвместния процес, състоящ се от хидролиза на нандролонов деканоат и елиминирането на свободния нандролон, е 4.3 часа.

Нандролонов деканоат преминава през плацентата и кръвно-мозъчната бариера и навлиза също така в майчиното мляко.

Метаболизъм

Както анаболните стероиди изобщо, нандролонов деканоат претърпява преработка в черния дроб посредством редукция, хидроксилация и образуване на конюгати. Тези реакции се катализират от същите ензими, както при ендогенните стероиди.



Екскреция

Нандролонов деканоат се екскретира чрез урината и фекалиите, почти напълно под формата на метаболити. Цялостната екскреция обхваща няколко дни поради неговата ентерохепатална рециркуляция.

5.3. Предклинични данни за безопасност

- На базата на проведени изследвания върху опитни животни, при подкожно приложение на ниски дози нандролонов деканоат (1 mg) теглото на *musculus levator ani* на кастрирани плъхове е нарастнало до 2.5 пъти за четири седмици. Този ефект е пряко свързан с дозата. Ефектът се проявява от третия ден, в продължение на четири седмици. В сравнение с аналогични дози тестостерон пропионат, анаболното действие на нандролонов деканоат се оказва 10.6 пъти по-силно изразено в края на втората седмица.

- При проведени изследвания на хроничната токсичност е установено, че прилагането на дози от 25 mg/kg седмично не води до поява на токсични симптоми при бозайници.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Бензилов алкохол

Изопропилов алкохол

Слънчогледово масло за инжекции

6.2. Несъвместимости

Не е приложимо.

6.3. Срок на годност

5 години

6.4. Специални условия за съхранение

Да се съхранява под 25°C в оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина.

6.5. Данни за опаковката

Ампула 1 ml от безцветно стъкло.

Големина на опаковката: 1 ампула в сгъваема картонена кутия.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне

Всяка видима преципитация на инжекционния разтвор се разтваря, ако ампулата се постави в топла вода за няколко минути. Само кристално бистри разтвори могат да се инжектират.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Gedeon Richter Plc.

1103 Budapest X., Gyömrői út 19-21., Унгария



8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

9700343

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

2003

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

10/2007

