

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

СУСТАНОН®-250
(SUSTANON®-250)

Склад:

діюча речовина: тестостерон (суміш ефірів)

1 мл розчину містить 250 мг суміш ефірів тестостерону (тестостерону пропіонату 30 мг, тестостерону фенілпропіонату 60 мг, тестостерону ізокапрононату 60 мг, тестостерону деканоату 100 мг).

допоміжні речовини: олія арахісова, спирт бензиловий.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група.

Андрогени. Код АТС G03B A03.

Клінічні характеристики.

Показання.

Тестостеронзамісна терапія у чоловіків при станах, пов'язаних із первинним і вторинним гіпогонадізмом, як вродженим, так і набутим.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до будь-якого з компонентів препарату, в тому числі до арахісової олії, арахісу та сої. Встановлений або підозрюваний рак передміхурової залози або грудної залози.

Спосіб застосування та дози.

Препарат Сустанон®-250 слід вводити глибоко внутрішньом'язово.

Режим дозування та тривалість лікування, як правило, залежать від індивідуальної реакції пацієнта на лікування.

Зазвичай доза становить 1 мл 1 раз на 3 тижні.

Безпека та ефективність застосування дітям недостатньо вивчені (див. розділ «Діти»).

Побічні реакції.

Нижезазначені побічні реакції були пов'язані з андрогенною терапією у цілому.

Система/орган/клас	Побічна реакція
Доброякісні, злаякісні та невизначені новоутворення (включаючи кісти та поліпи)	Рак передміхурової залози (або погіршення перебігу субклінічного раку передміхурової залози)
З боку системи крові	Поліцитемія
З боку обміну речовин	Затримка рідини (набряки)
З боку центральної нервової системи	Депресія, підвищена нервова збудженість, зміни настрою, підвищення або зниження лібідо
З боку опорно-рухового апарату	Міалгія
З боку серцево-судинної системи	Підвищення артеріального тиску
З боку травного тракту	Нудота

З боку гепатобіліарної системи	Порушення функцій печінки
З боку шкірних покривів	Свербіж, акне
З боку сечостатевої системи	Гінекомастія, олігозооспермія, зменшення об'єму еякуляту, пріапізм, функціональні розлади передміхурової залози (гіпертрофія)
Вплив на лабораторні показники	Порушення функцій печінки, зниження концентрації ліпопротеїнів високої щільності (ЛПВЩ) ліпопротеїнів низької щільності (ЛПНЩ) та тригліцеридів у сироватці крові, підвищення рівня простатичного специфічного антигену (ПСА)

або відчуття дискомфорту у животі. Також відзначали випадки холестатич жовтяниці та гепатиту;

обструкції сечовивідних шляхів; затримка натрію, хлору, калію і кальція та неорганічних фосфатів; порушення толерантності до глюкози; головний біль; набряки, шлунково-кишкові кровотечі. Можливий розвиток алергічних реакцій.

Після відміни препарату Сустанон®-250 побічні ефекти зберігаються ще певний час. Ін'єкції можуть спричиняти місцеву реакцію в місці введення (біль, свербіж, гіперемія).

При застосуванні андрогенів у дітей препубертатного віку можливе виникнення таких побічних реакцій як передчасне статеве дозрівання, збільшення частоти ерекції, передчасне закриття епіфізів, збільшення розмірів статевих органів.

Передозування.

Ймовірність розвитку гострої токсичності препарату Сустанон®-250 при внутрішньому язовому введенні дуже низька. Пріапізм та поліцитемія у чоловіків є симптомом хронічного передозування. У разі розвитку цих проявів лікування препаратом слід тимчасово припинити, а після зникнення вказаного симптому – відновити в нижчих дозах.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Немає достатніх даних про застосування препарату вагітним та жінкам, які годують груддю, тому препарат протипоказаний для застосування цим категоріям пацієнтів.

Діти.

Безпека та ефективність застосування дітям не встановлені, тому препарат не застосовують цій категорії пацієнтів (див.розділ «Особливості застосування»).

Особливості застосування.

Потрібно здійснювати лікарське спостереження за пацієнтами, які отримують Сустанон®-250, до початку лікування і щоквартально протягом перших 12 місяців, а згодом – 1 раз на рік. Необхідно проводити такі дослідження:

- пальцеве ректальне обстеження для виключення доброякісної гіперплазії передміхурової залози визначення простатичного специфічного антигену (ПСА) для виключення субклінічних форм раку передміхурової залози;
- вимірювання рівня гематокриту і гемоглобіну для виключення поліцитемії.

Лікарське спостереження під час прийому препарату потрібне пацієнтам, особливо літнього віку, з такими станами:

- **рак молочної залози, гіпернефрома, бронхіальний рак та скелетні метастази. У цих пацієнтів гіперкальціємія або гіперкальціурія може розвинути спонтанно і під час терапії андрогенами. Гіперкальціємія або гіперкальціурія може свідчити про позитивну реакцію пухлини на гормональне лікування. Однак, слід призначити відповідне лікування гіперкальціємії або гіперкальціурії. Після досягнення нормального рівня кальцію гормональну терапію можна відновити.**

Пацієнти з таким хворобами в анамнезі, як інфаркт міокарда, серцева, печінкова, ниркова недостатність, артеріальна гіпертензія, епілепсія, мігрень, повинні перебувати під наглядом лікаря у зв'язку з ризиком погіршення стану або рецидивом захворювання. У таких випадках лікування слід негайно припинити.

У пацієнтів з патологією серця в анамнезі, нирок або печінки, артеріальною гіпертензією лікування андрогенами може спричинити ускладнення, що характеризуються набряками з гострою серцевою недостатністю (або без неї). У такому випадку слід негайно припинити лікування.

Пацієнти з епілепсією або мігреню (навіть в анамнезі) повинні знаходитися під наглядом лікаря, оскільки андрогени можуть іноді спричиняти затримку рідини та натрію в організмі.

Як правило, андрогени, в тому числі Сустанон®-250, можуть покращити переносимість глюкози та дію антикоагулянтів.

З обережністю слід призначати препарат чоловікам з апное уві сні. Повідомлялось, що тестостерон може спричинити або посилити апное уві сні. Проте існує недостатньо даних для рекомендації стосовно безпеки лікування ефірами тестостерону для чоловіків з апное уві сні. Слід прийняти обґрунтоване клінічне рішення та проявляти обережність відносно пацієнтів з такими факторами ризику як ожиріння і хронічні захворювання легенів.

Препарат Сустанон®-250 містить 100 мг бензилового спирту на 1 мл розчину.

У дітей у препубертатному періоді слід контролювати ріст та статевий розвиток, оскільки андрогени взагалі та препарат Сустанон®-250 у високих дозах зокрема можуть прискорити закриття епіфізів і статеве дозрівання.

У разі виникнення небажаних реакцій, пов'язаних із застосуванням андрогенів, лікування препаратом Сустанон®-250 слід тимчасово припинити і після зникнення симптомів відновити в нижчій дозі.

Застосування андрогенів не за призначенням, а для посилення витривалості у спортсменів спричиняє серйозний ризик для здоров'я.

Застосування андрогенів, зокрема Сустанону®-250, у пацієнтів літнього віку підвищує вірогідність розвитку гіпертрофії або раку передміхурової залози.

Оскільки до складу препарату входить олія арахісова, не слід призначати Сустанон®-250 пацієнтам, з алергією на арахіс. Через можливу перехресну алергію до арахісу і алергію до сої хворим із підвищеною чутливістю до сої також не слід застосовувати Сустанон®-250.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

На даний момент повідомлень немає. Проте при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами рекомендується дотримуватися особливої обережності, враховуючи можливість розвитку небажаних реакцій з боку нервової системи.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Лікарські засоби, що спричиняють індукцію або інгібування ферментів, можуть відповідно знижувати або підвищувати концентрацію тестостерону. Тому може бути потрібна корекція дози та/або інтервалів між ін'єкціями.

Андрогени можуть підвищувати толерантність до глюкози і знижувати потребу в інсуліні або інших гіпоглікемічних препаратах у пацієнтів із цукровим діабетом. Пацієнти з цукровим діабетом повинні бути під наглядом, особливо на початку, вкінці та періодично протягом лікування препаратом.

Високі дози андрогенів можуть підсилювати дію антикоагулянтів кумаринового ряду, що дає змогу скоротити дози цих препаратів. Тому необхідно ретельно контролювати протромбіновий індекс та за необхідності змінити дозу антикоагулянту.

Однотимчасне застосування з адренкортикотропними або кортикостероїдними лікарськими засобами може призвести до посилення утворення набряку. Таким чином, слід з обережністю призначати ці лікарські засоби, особливо пацієнтам із хворобами серця, печінки або схильним до набряків.

Андрогени можуть знижувати рівень тироксинзв'язуючого глобуліну в результаті зниження загального T4 в сироватці крові і підвищувати поглинання T3 та T4. При цьому рівень вільних гормонів щитовидної залози залишається незмінним, а клінічні ознаки дисфункції щитовидної залози відсутні.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Лікування гіпогонадальних чоловіків препаратом Сустанон®-250 призводить до клінічно значущого

підвищення концентрацій тестостерону, дигідротестостерону, естрадіолу і андростендіону в плазмі, а також до зниження рівня глобуліну, що зв'язує статеві гормони (ГЗСГ); рівні лютеїнізуючого гормону (ЛГ) і фолікулостимулюючого гормону (ФСГ) відновлюються до нормального значення. Лікування препаратом Сустанон®-250 призводить до зменшення симптомів дефіциту тестостерону. Крім того, збільшується мінеральна щільність кісток та м'язова маса, зменшується кількість жирової тканини. В процесі лікування покращується сексуальна функція, включаючи еректильну функцію і лібідо. При застосуванні препарату знижуються концентрації в сироватці крові ліпопротеїнів високої щільності, ліпопротеїнів низької щільності та тригліцеридів, підвищуються концентрації гемоглобіну і гематокриту, при цьому не відбувається клінічно значущої зміни рівня печінкових ферментів і простатичного специфічного антигену. Препарат може спричинити збільшення розмірів передміхурової залози *при цьому функціональних змін не відмічається* У чоловіків зі зниженою статевою функцією, які страждають на цукровий діабет, застосування андрогенів покращує чутливість до інсуліну та/або знижує концентрацію глюкози в плазмі крові.

У хлопчиків із затримкою росту і статевого дозрівання застосування андрогенів прискорює зростання, стимулює розвиток вторинних статевих ознак.

Лікування жінок-транссексуалів андрогенами, як і препаратом Сустанон®-250, сприяє маскулінізації.

Фармакокінетика.

Препарат Сустанон®-250 містить ряд ефірів тестостерону з різною тривалістю дії. Ці ефіри, потрапивши в циркулюючу кров, відразу ж гідролізуються в природний гормон тестостерон.

Всмоктування.

Одноразова доза препарату Сустанон®-250 призводить до підвищення рівня загального тестостерону в плазмі, максимальна концентрація (C_{max}) якого досягає приблизно 70 нмоль/л і спостерігається приблизно через 24-48 годин (t_{max}) після введення. У чоловіків рівень тестостерону повертається до нижньої межі норми приблизно через 21 день.

Розподіл.

Тести *in vitro* показали високий ступінь неспецифічного зв'язування тестостерону з білками плазми (більше 97 %) та з ГЗСГ.

Метаболізм.

Тестостерон метаболізується до дигідротестостерону й естріолу природним чином.

Виведення.

Виводиться головним чином з сечею у вигляді кон'югатів етіохоланолону й андростерону.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: олійний розчин жовтого кольору.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 30°C в недоступному для дітей місці. Не охолоджувати. Не заморожувати. Стерильно.

Упаковка.

По 1 мл розчину в ампулі вмістом 1 мл з безкольорового скла типу 1; по 1 ампулі у картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Н.В.Органон, Нідерланди N.V. Organon, the Netherlands

Місцезнаходження.

5349 АВ Осс, Клоостерштраат 6, Нідерланди/Kloosterstraat6, 5349 АВ Осс, the Netherlands
Моленштраат 110, 5342 СС Осс, Нідерланди/Molenstraat110, 5342 СС Осс, the Netherlands