

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ТЕСТОСТЕРОНУ ПРОПІОНАТ
(TESTOSTERONE PROPIONATE)

Склад:

діюча речовина: testosterone propionate;

1 мл розчину містить тестостерону пропіонату у перерахуванні на 100 % речовину 50 мг;

допоміжна речовина: етилолеат.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: масляниста рідина світло-зеленого або світло-жовтого кольору зі специфічним запахом.

Фармакотерапевтична група.

Андрогени. Код АТХ G03B A03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Тестостерону пропіонат чинить специфічну андрогенну дію: стимулює розвиток і функцію зовнішніх статевих органів, передміхурової залози, сім'яних пухирців, а також вторинних статевих ознак у чоловіків (голос, волосяний покрив). Бере участь у формуванні конституції тіла і статевої поведінки у чоловіків, посилює лібідо і потенцію, стимулює сперматогенез. Зменшує продукування лютеотропного та фолікулостимулюючого гормонів. Тестостерон є антагоністом жіночих статевих гормонів – естрогенів, має протипухлинну дію при пухлинах молочної залози у жінок. Чинить анаболічну дію, що проявляється у стимуляції синтезу білка, зменшенні відкладання жиру, затримці в організмі необхідних для синтезу білка калію, фосфору, сірки, посиленні фіксації кальцію в кістках і збільшенні м'язової маси. При достатньому білковому харчуванні стимулює продукування еритропоетину.

Фармакокінетика.

Після внутрішньом'язового або підшкірного введення повільно абсорбується з місця ін'єкції. Тестостерон, що циркулює в крові, потрапляє в органи-мішені, де відновлюється до 5- α -дигідротестостерону, що взаємодіє з рецепторами клітинної мембрани і проникає в ядро клітини. До 98 % препарату в плазмі крові зв'язується з білками, в основному з глобулінами. Метаболізується у печінці до малоактивних і неактивних метаболітів, що виводяться з організму із сечею. Приблизно 6 % препарату виводиться кишечником у незміненому стані.

Клінічні характеристики.

Показання.

Для чоловіків

Замісна терапія при первинному і вторинному гіпогонадізмі, евнухоїдизмі; імпотенція ендокринного генезу, посткастраційний синдром, віковий дефіцит андрогенів у чоловіків; безпліддя внаслідок порушення сперматогенезу (за виключенням Сертолі – клітинного синдрому), олігоспермія; остеопороз, спричинений недостатністю андрогенів.

Для жінок

У складі комплексного лікування раку молочної залози у жінок після менопаузи.

Протипоказання.

Індивідуальна непереносимість лікарського засобу, рак передміхурової залози або рак молочної залози у чоловіків, пухлини печінки, у тому числі в анамнезі, тяжкі порушення функції печінки, гіперкальціємія, гіперкальціурія, нелікована застійна серцева недостатність, ішемічна хвороба серця.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При комбінованому застосуванні з речовинами, що є індукторами мікросомальних ферментів печінки (барбітуратами, рифампіцином, карбамазепіном, фенілбутазоном, фенітоїном), ефект тестостерону може ослаблятися. При різко вираженому гіпогонадізмі Тестостерону пропіонат можна комбінувати з препаратами, що стимулюють функцію щитовидної залози, естрогенами. Посилює дію анаболічних засобів, вітамінів, препаратів, що містять кальцій, фосфор, сповільнює елімінацію циклоспорину.

Андрогени можуть підвищувати толерантність до глюкози і знижувати потребу в інсуліні або у пероральних протидіабетичних препаратах в осіб, які страждають на цукровий діабет.

Андрогени можуть впливати на метаболізм інших лікарських засобів (спостерігається ріст сироваткових концентрацій оксифенбутазону). Крім того, повідомлялося, що тестостерон та його похідні підвищують активність пероральних антикоагулянтів, що може потребувати корегування дози. Незалежно від цього факту слід завжди дотримуватися обмежень, що стосуються внутрішньом'язових ін'єкцій, для пацієнтів з набутими або спадковими порушеннями згортання крові.

Одночасне застосування тестостерону та адренкортикотропного гормону або кортикостероїдів збільшує ризик появи набряків.

Барбітурати та алкоголь знижують активність тестостерону.

Вплив на результати лабораторних досліджень

Андрогени можуть знижувати рівень глобуліну, що зв'язує тироксин, і, таким чином, призводити до зниження загального рівня тироксину і посилення захоплення трийодтироніну та тироксину. Однак концентрація вільних фракцій тиреоїдних гормонів залишається без змін. Клінічні ознаки погіршення функції щитовидної залози відсутні.

Особливості застосування.

Як і у випадку з усіма масляними розчинами, розчин Тестостерону пропіонату для ін'єкцій слід вводити тільки внутрішньом'язово та дуже повільно (протягом 2 хвилин). Легенева мікроемболія масляними розчинами може в рідкісних випадках спричинити такі симптоми, як кашель, задишка, нездужання, гіпергідроз, біль у грудях, запаморочення, парестезія або синкопе. Ці реакції можуть виникати під час або одразу після ін'єкції і є оборотними. Тому за пацієнтом слід спостерігати під час та після кожної ін'єкції, щоб забезпечити раннє розпізнавання можливих симптомів легеневої олійної мікроемболії. Терапія, як правило, підтримуюча, наприклад оксигенотерапія.

Пацієнти літнього віку.

Дані з безпеки та ефективності застосування препарату пацієнтам віком від 65 років обмежені. Наразі немає єдиної точки зору щодо вікових норм рівня тестостерону. Проте слід враховувати, що з віком фізіологічний рівень тестостерону у сироватці крові знижується.

З обережністю призначати хворим із серцевою недостатністю, артеріальною гіпертензією, епілепсією, мігренню, порушенням функції нирок.

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

У пацієнтів, які отримують андрогени та у яких досягнуто нормальні рівні тестостерону у плазмі крові після замісної терапії тестостероном, може спостерігатися підвищення чутливості до інсуліну.

Певні клінічні симптоми, такі як дратівливість, нервозність, збільшення маси тіла, стійкі або часті ерекції можуть вказувати на передозування андрогену і вимагають корекції дози.

Пухлини.

Андрогени можуть прискорювати розвиток субклінічного раку простати та доброякісної гіперплазії передміхурової залози.

Слід з обережністю застосовувати препарат хворим з онкологічними захворюваннями, які мають ризик розвитку гіперкальціємії (та пов'язаної з цим гіперкальціурії), зумовленої метастазами у кісткову тканину. Рекомендовано регулярно контролювати сироватковий рівень кальцію у таких пацієнтів.

Повідомлялося про випадки утворення доброякісних та злоякісних пухлин печінки в осіб, які приймають гормональні речовини, зокрема андрогенні сполуки. Якщо у чоловіка, який отримує лікування, виникають виражені болі у верхній частині живота, збільшення печінки або присутні ознаки внутрішньочеревної кровотечі, при диференціальній діагностиці необхідно виключити імовірну пухлину печінки.

Печінкова або ниркова недостатність. Дослідження з вивчення ефективності та безпеки застосування лікарського засобу з участю пацієнтів із порушенням функції нирок або печінки не проводилися. Тому замісну терапію тестостероном таким пацієнтам слід проводити з обережністю.

Серцева недостатність. Необхідно дотримуватися обережності щодо пацієнтів, у яких є схильність до набряків, наприклад у випадку тяжкої серцевої, печінкової або ниркової недостатності або ішемічної хвороби серця, оскільки лікування препаратами групи андрогенів може призводити до збільшення затримки натрію та води. У випадку тяжких ускладнень, що характеризуються набряком із застійною серцевою недостатністю або без такої, лікування слід припинити негайно (див. розділ «Побічні реакції»).

Тестостерон може викликати підвищення артеріального тиску, і препарат Тестостерону пропіонат слід застосовувати з обережністю чоловікам з артеріальною гіпертензією.

Порушення згортання крові.

Необхідно дотримуватися умов проведення внутрішньом'язових ін'єкцій пацієнтам із набутими чи вродженими порушеннями згортання крові.

Повідомлялося, що тестостерон і його похідні підвищують активність пероральних антикоагулянтів – похідних кумаринів (див. також розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Слід з обережністю застосовувати тестостерон пацієнтам з тромбофілією, оскільки у даної групи пацієнтів під час терапії тестостероном у післяреєстраційний період спостерігалися тромботичні явища.

У зв'язку з можливою схильністю до тромбоутворення з обережністю слід призначати препарат чоловікам після нещодавно перенесеної операції або травми.

З обережністю застосовувати препарат пацієнтам з порфірією.

Під час лікування препаратом слід контролювати показники функцій печінки та нирок, щитовидної залози та рівень цукру в крові.

Перед початком лікування у чоловіків необхідно виключити діагноз раку передміхурової залози, оскільки при застосуванні препарату андрогени підвищують ризик розвитку гіперплазії передміхурової залози.

У пацієнтів, які отримують лікування тестостероном, необхідно регулярно і ретельно перевіряти стан простати та грудних залоз із застосуванням загальноприйнятих методів дослідження принаймні 1 раз на рік або 2 рази на рік – у пацієнтів літнього віку та особливих категорій хворих (з клінічними або спадковими факторами ризику).

У пацієнтів, які приймають андрогени протягом тривалого періоду, крім концентрації тестостерону, необхідно перевіряти такі лабораторні показники: гемоглобін, гематокрит (на початку – кожні 3 місяці, потім – 1 раз на рік) та функціональні проби печінки.

З обережністю слід призначати препарат чоловікам з апное уві сні. Повідомлялося, що тестостерон може спричинити або посилити апное уві сні. Слід прийняти зважене клінічне рішення та проявляти обережність відносно пацієнтів з такими факторами ризику, як ожиріння і хронічні захворювання легенів.

Зловживання препаратом або звикання. Андрогени не можна застосовувати для посилення розвитку м'язів у здорових людей та для підвищення фізичних можливостей.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Немає достатніх даних про застосування препарату у період вагітності або годування груддю. Враховуючи характерний вірилізуючий вплив препарату на плід, застосування його протипоказано у період вагітності або годування груддю. Застосування препарату слід припинити при діагностуванні вагітності. *Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.*

Під час прийому препарату слід утримуватися від керування автотранспортом та роботи з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Чоловікам при євнухїдизмі, вродженому недорозвиненні статевих залоз, видаленні їх хірургічним шляхом або в результаті травми, а також при акромегалії препарат призначати внутрішньом'язово або підшкірно по 25–50 мг через день або через 2 дні. Тривалість курсу лікування залежить від ефективності терапії і характеру захворювання. Після поліпшення клінічної картини Тестостерону пропіонат вводити у підтримуючих дозах по 5–10 мг щодня або через день. При імпотенції ендокринного генезу, а також при чоловічому клімаксі, що супроводжується судинними і нервовими розладами, Тестостерону пропіонат призначати по 10 мг щодня або по 25 мг 2–3 рази на тиждень протягом 1–2 місяців. Для лікування чоловічого безпліддя препарат застосовувати у дозах по 10 мг 2 рази на тиждень протягом 4–6 місяців або по 50 мг через день протягом 10 днів. При патологічному чоловічому клімаксі

препарат призначати по 25 мг 2 рази на тиждень протягом 2 місяців з місячною перервою протягом 1–2 місяців.

Для жінок у складі комплексного лікування раку молочної залози застосовувати 100 мг 2–3 рази на тиждень.

Діти.

Безпека та ефективність застосування у дітей не вивчалися, тому препарат не рекомендовано застосовувати у педіатричній практиці. Застосування тестостерону дітям може стати причиною маскулізації, прискороного росту та дозрівання кісткової тканини, а також передчасного закриття зони росту епіфіза, що у результаті призведе до зниження остаточного росту.

Передозування.

При застосуванні препарату у підвищених дозах або протягом тривалого часу можуть розвиватися побічні ефекти, описані у відповідному розділі. У цьому випадку застосування лікарського засобу слід відмінити, а після зникнення андрогензалежних побічних ефектів продовжити у зменшених дозах. У разі необхідності проводити симптоматичне лікування.

Побічні реакції.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз: пріапізм, підвищене статеве збудження, посилення лібідо та часта ерекція, гінекомастія, біль у молочних залозах. При застосуванні високих доз у чоловіків можливе пригнічення сперматогенезу, атрофія яєчок. Андрогени у чоловіків можуть спричинити гіперплазію простати, ріст злоякісних пухлин простати. У жінок можуть спостерігатися явища маскулізації (вірилізму): огрубіння голосу, надмірний ріст волосся на обличчі та тілі, пастозність обличчя, пригнічення функції яєчників, розлади менструації, атрофія молочних залоз і тканин ендометрія, жирність шкіри, гіпертрофія клітора. Вірилізація може бути необоротною навіть після припинення застосування тестостерону.

З боку дихальної системи: респіраторні порушення, апное уві сні.

З боку кістково-м'язової системи: біль у ногах, артралгія, судоми м'язів.

Шлунково-кишкові порушення: діарея, нудота, шлунково-кишкова кровотеча.

Гепатобіліарні порушення: підвищення рівня амінотрансфераз, порушення функції печінки, жовтяниця, холестатичний гепатит, при застосуванні високих доз протягом тривалого періоду повідомлялось про випадки пухлин печінки.

З боку системи крові та лімфатичної системи: поодинокі випадки поліцитемії, схильність до тромбозів, підвищення гематокриту, пригнічення факторів згортання крові.

З боку шкіри та її похідних: різні шкірні реакції, включаючи акне, себорею, облісіння, свербіж.

Метаболічні та аліментарні порушення: збільшення маси тіла, гіперкальціємія, порушення обміну глюкози, підвищення рівня ліпопротеїдів низької щільності, зниження рівня ліпопротеїдів високої щільності.

Неврологічні порушення: запаморочення, підвищене потовиділення, головний біль, нервозність, депресія.

Загальні порушення та стан місця ін'єкції: біль у місці ін'єкції, підшкірна гематома в місці ін'єкції; тривале лікування Тестостерону пропіонатом або його застосування у високих дозах іноді може призводити до підвищення частоти випадків затримки рідини та набряків; реакції гіперчутливості, в т. ч. у вигляді підвищення температури, ознобу та відчуття жару в усьому тілі.

Термін придатності. 2 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 1 мл в ампулі. По 5 або 10 ампул у пачці. По 5 ампул у блістері.

По 1 або 2 блістери у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. АТ «Фармак».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 04080, м. Київ, вул. Кирилівська, 74.