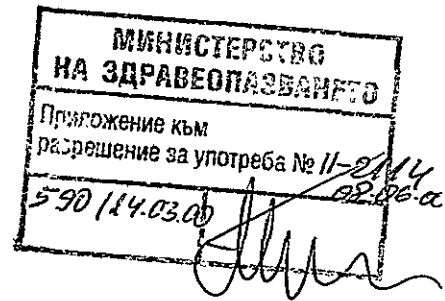


## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА



### 1. Име на лекарственото средство

Androsur 10  
Андрокур 10

### 2. Количествен и качествен състав

1 таблетка Androsur съдържа активна съставка cyproterone acetate-10 mg

### 3. Лекарствена форма Таблетки

### 4 Клинични данни. Показания

Тежки до умерени явления на андрогенизиране при жени, като:

- много тежък хирзутизъм
- тежка андрогенно-обусловена алопеция
- тежки форми на акне и/или себорея.

### 4.2 Дозировка и начин на приложение

Бременните жени не трябва да употребяват Androsur , за това преди започване на лечението , е необходимо да се изключи бременност.

Androsur трябва да се използва в комбинация с препарата Diane-35, за да се постигне необходимата контрацептивна защита и да се стабилизира цикъла. Лечението започва от първия ден на цикъла / в първия ден на кървене/. Обикновено се приема по една таблетка Androsur от първия до петнадесетия ден на лечението с Diane-35 След 21 дни ,когато свърши календарната опаковка Diane-35 ,следва 7 дневен период , по време на който не се приемат таблетки и се получава кървене. След седем дневен интервал започва следващият цикличен курс на комбинирано лечение с Androsur и Diane-35, независимо дали кървенето е спряло. Ако по изключение в този седемдневен интервал не настъпи кървене, лечението трябва да се прекрати ,до изключване на бременност.

Ако пациентката пропусне прием на таблетка Androsur и/или Diane-35, трябва да ги вземе до 12 часа. Ако са минали повече от 12 часа от обичайното време на приемане на таблетките, може да се намали контрацептивната защита. Независимо от това ,пациентката трябва да продължи с приема на таблетките за да се избегне преждевременно кървене. В същото време трябва да се използват



**нехормонални контрацептивни методи ( с изключение на ритъмния и температурния метод) Пропуснатата таблетка не трябва да се взима, тя остава в опаковката. Ако след цикъла на лечение не се появи кървене, трябва да се изключи бременност, преди да се възобнови лечението.**

**Необходимо е да се обърне внимание на специалните указания за контрацептивна сигурност в кратката характеристика на Diane-35.**

**Продължителността на лечение зависи от тежестта на андрогенизиране и отговора на терапията. Тя обикновено продължава няколко месеца, като първоначално се повлияват акне и себорея и по късно хирзутизма и алопецията.**

**След настъпване на клинично подобрене , трябва да се опита самостоятелно лечение с Diane-35.**

#### **4.3 Противопоказания**

**Бременност , кърмене , чернодробни заболявания , жълтеница , продължителен сърбеж и херпес при предишна бременност , синдром на Dubin-Johnson и синдром на Rotor , предшестващи или налични чернодробни тумори , изтощителни заболявания , тежка хронична депресия , тромбоемболични процеси или анамнеза за такива, тежък диабет със съдови промени , сърповидно-клетъчна анемия , свръхчувствителност към някоя от съставките на Androcur.**

**Да се обърне внимание и на противопоказанията в информацията за Diane-35 , който се използва заедно с Androcur.**

#### **4.4 Специални предупреждения и указания при употреба**

**Преди започване на терапията, трябва да се направи пълен общ и гинекологичен преглед /включително на млечните жлези , както и цервикална цитонамазка/. При жените в детородна възраст трябва да се изключи бременност.**

**По време на лечението редовно трябва да се проследява чернодробната функция.**

**Необходим е стриктен медицински контрол на пациентки страдащи от диабет.**

**Както и при употребата на други полови стероиди има съобщения за отделни случаи с доброкачествени и злокачествени чернодробни изменения. В много редки случаи , чернодробните тумори могат да причинят опасна за живота интраабдоминална хеморагия. Ако се появят оплаквания в горната абдоминална област , увеличение на черния дроб или признаци на интраабдоминална хеморагия , в диференциалната диагноза трябва да се включи и чернодробен тумор.**

**Ако по време на комбинираното лечение се появи маркиращо кървене през 3 те седмици, лечението не трябва да се прекъсва. В случаи , че персистиращо или повтарящо се в нередовни**



интервали кървене продължава , трябва да се направи гинекологичен преглед за да се изключи възможно органично заболяване.С оглед на необходимата допълнителна употреба на Diane-35 , трябва да се обърне внимание на всички данни , съдържащи се в информацията за този медикамент.

#### 4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Може да се промени нуждата от инсулин.и перорални антидиабетични средства

#### 4.6 Бременност и кърмене

Употребата на Androcur по време на бременност и кърмене е противопоказана.

Около 0,2% от дозата се екскретира в кърмата,което съответства на доза от 1 µg/kg

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини.  
Не се съобщават

#### 4.8 Нежелани лекарствени реакции

Възможно е да се появят чувство на напрегнатост в гърдите промени в телесното тегло и либидото, както и, депресивни настроения

Да се обърне внимание на информацията за нежелани лекарствени реакции и причини за прекратяване на лечението с Diane-35.

#### 4.9 Предозиране

Изследванията за остра токсичност след прилагане на единична доза ципротерон ацетат , активната съставка на Androcur показват , че той е практически нетоксичен.Не се очаква риск от остро отравяне след единичен инцидентен прием на доза , многократно превишаваща препоръчаната лечебна доза.

### 5. Фармакологични данни

#### 5.1 Фармакодинамични свойства

Androcur е антиандрогенен хормонален препарат.Той подтиска действието на андрогените , които се произвеждат в по-малка степен и в женския организъм , притежават прогестагенно и антигонадотропно действие.

Андроген зависимия, патологичен космен растеж при хирзутизма, андрогенно обусловената алоpecia и засилената функция на мастните жлези при акне и себорея, се влияят добре от



конкурентното изместване на андрогените от прицелните органи. Намаляването на андрогенната концентрация, което е резултат от антигонадотропната природа на *cypoterone acetate*, има допълнителен благоприятен ефект. По време на лечението е подтисната функцията на яйчниците.

## 5.2 Фармакокинетични свойства

След перорално приложение, *ципротерон ацетат* напълно се абсорбира в широк порядък на дози. След прием на 10 mg *ципротерон ацетат* се получава максимална серумна концентрация 75ng/ml за около 1,5 часа. След това серумните концентрации се понижават в две диспозиционни фази, характеризирани с  $t_{1/2}$  полуживот 0,8 часа и 2,3 дни. Тоталният клирънс на *ципротерон ацетат* от серума 3.6ml/min/kg. *Ципротерон ацетат* се метаболизира по различни начини, включително хидроксилиране и конюгиране. Основният метаболит в човешката плазма е 15  $\beta$ -хидроксидно съединение.

Част от приетата доза се екскретира непроменена в жлъчния сок. По-голямата част се екскретира под форма на метаболити в урината и жлъчката, като съотношението е 3:7.  $t_{1/2}$  полуживотът на бъбречното и жлъчно екскретиране е 1.9 дни. Метаболитите от плазмата се елиминират с подобна скорост / $t_{1/2}$  полуживот 1.7 дни/.

*Ципротерон ацетат* е почти изцяло свързан с плазмения албумин. Около 3.5-4% от тоталната му концентрация не са свързани. Свързването с протеините е неспецифично, затова промените в концентрацията на SHBG /глобулин, свързващ половите хормони/ не влияят върху фармакокинетиката на *ципротерон ацетат*.

Поради дългият полуживот на терминалната диспозиционна фаза в плазмата /серума/ и ежедневният прием, може да се очаква акумулиране на *ципротерон ацетат* и приблизително трикратно увеличение на концентрацията му в серума след повторен ежедневен прием. Абсолютната бионаличност на *ципротерон ацетат* е почти пълна (88% от дозата).

## 5.3 Предклинични данни за безопасност

При опити с животни, след многократен перорален прием не са установени признаци на системна непоносимост, които биха могли да наложат забрана за употреба при хора, в лечебни дози. Не са извършвани опити с животни за да се установи възможния сенсibiliзиращ ефект на етинилестрадиол и *ципротерон ацетат*. Изследванията за ембриотоксичност или тератогенност на комбинацията на двете активни съставки не установяват ефекти показателни за общ тератогенен ефект след третиране по време на органогенезата, преди развитието на вънните полови



органи. Прилагането на ципротерон ацетат в по-високи дози на фазата на диференциране на половите органи чувствителна към хормони /след около 45 дена от бременността/ може да предизвика поява на признаци на феминизация у мъжките фетуси. Наблюденията на мъжки новородени деца изложени на действието на ципротерон ацетат *in utero* не показват никакви признаци на феминизация. Все пак употребата на Diane-35 е противопоказана по време на бременност.

Признатите първи тестове за генотоксичност проведени с ципротерон ацетат, са отрицателни, но по-нататъшните тестове показват, че той може да предизвика отклонения в ДНК /и увеличение на реставрационната активност на ДНК/ в чернодробните клетки от плъхове и маймуни, както и в прясно изолирани човешки хепатоцити. Образуването на отклонения в ДНК се получава при концентрации, които могат да се получат при прием на препоръчаната доза ципротерон ацетат. Последствие от третирането с ципротерон ацетат „in vivo“ е увеличената честота на фокални, възможни пренеопластични чернодробни лезии, с промяна на клетъчните ензими у женски плъхове.

Клиничното значение на тези находки засега не е сигурно. Клиничните изпитвания досега не потвърждават увеличената честота на поява на чернодробни тумори при хора, както и изследванията за туморогенност на ципротерон ацетат, проведени с гризачи, не показват признаци на специфичен туморогенен потенциал. Все пак, трябва да се има предвид, че половите стероидни хормони могат да предизвикат растеж на някои хормон-заместващи тъкани и тумори.

В заключение, досегашните находки не предизвикват възражение срещу употребата на Diane-35 при хора, при съответното показание, в препоръчаната доза.

## 6. Фармацевтични данни

### 6.1 Списък на помощните вещества

Lactose monohydrate  
Maize starch  
Polyvidone 25000  
Colloidal silicon dioxide  
Magnesium stearate

### 6.2 Физико-химични несъвместимости

Не са известни.



**6.3 Срок на годност**

**5 години.**

**6.4 Специални условия за съхранение**  
**Не са необходими.**

**6.5 Данни за опаковката**  
**календарна опаковка с 15 таблетки , по 10 mg всяка,поставени в**  
**блистер от поливинилхлорид и алуминиево фолио или стъклено шише**  
**стъкло тип III, със запушалка от пластмаса**

**6.6 Препоръки при употреба**

**Лекаството да се съхранява според указанията,на недостъпно за деца място.**

**7.Производител и носител на регистрацията**

**Schering AG**  
**Muelerstrasse 178**  
**D-13349 Berlin Germany**  
**Tel: +4930 4681 Fax: : +4930 4681**

**Дата на /последна/ редакция на текста**  
**15.12.99.**

