

## **Склад**

*діюча речовина:* desogestrel;

1 таблетка містить 0,075 мг дезогестрелу;

*допоміжні речовини:* лактози моногідрат, кукурудзяний крохмаль, повідон,  $\alpha$ -токоферол, кремнію діоксид колоїдний безводний, кремнію діоксид колоїдний водний, кислота стеаринова;

*оболонка:* гіпромелоза, поліетиленгліколь, титану діоксид (E 171).

## **Лікарська форма**

Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

*Основні фізико-хімічні властивості:* круглі, гладкі, білі таблетки.

## **Фармакотерапевтична група**

Гормональні контрацептиви для системного застосування.

Код АТХ G03A C09.

## **Фармакодинаміка**

Механізм дії.

Препарат ДЕЗИРЕТТ є так званим препаратом «пілі», що містить тільки прогестаген (дезогестрел). Контрацептивний ефект препарату ДЕЗИРЕТТ досягається, в основному, за рахунок інгібування овуляції, а також збільшення в'язкості цервікального слизу.

## **Фармакокінетика**

Всмоктування. Після прийому внутрішньо препарату ДЕЗИРЕТТ дезогестрел (ДЗГ) швидко всмоктується і перетворюється на його біологічно активний метаболіт етоногестрел (ЕНГ). Досягнувши рівноважних станів, пікові рівні в сироватці досягаються через 1,8 години після прийому внутрішньо таблетки, а абсолютна біодоступність ЕНГ становить приблизно 70 %.

Розподіл. ЕНГ на 95,5-99 % пов'язаний з білками сироватки крові (переважно з альбуміном) і меншою мірою - з глобуліном, що зв'язує статеві гормони.

Метаболізм. ДЗГ метаболізується за допомогою гідроксилування і дегідрогенізації в активний метаболіт ЕНГ. ЕНГ метаболізується за допомогою утворення сульфатних і глюкуронідних кон'югатів.

Виведення. ЕНГ виводиться з періодом напіввиведення близько 30 годин як при одноразовому, так і при багаторазовому введенні. Рівні в плазмі при рівноважному стані досягаються через 4-5 днів. Кліренс сироватки при внутрішньовенному введенні ЕНГ становить приблизно 10 літрів на годину. Виведення ЕНГ і його метаболіту як у формі вільного стероїду, так і у формі кон'югатів відбувається з сечею і калом (у співвідношенні 1,5:1). У жінок, що годують, ЕНГ виділяється з грудним молоком при співвідношенні молоко/сироватка 0,37/0,55.

На підставі цих даних при споживанні 150 мл/кг/день молока 0,01-0,05 мкг ЕНГ може потрапити в організм дитини.

## **Показання**

Пероральна контрацепція.

## **Протипоказання**

- підвищена чутливість до активної речовини або до будь-якого іншого компонента препарату;
- активне тромбоемболічне захворювання вен;
- тяжкі захворювання печінки (у тому числі в анамнезі);
- відомі або підозрювані злоякісні гормонозалежні пухлини;
- вагінальна кровотеча нез'ясованої етіології;
- алергія на сою;
- встановлена або підозрювана вагітність.

## **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій**

Взаємодія між гормональними контрацептивами та іншими ліками може призвести до проривної кровотечі та/або до порушення контрацептивного захисту. В основному повідомлялося про взаємодії з комбінованими контрацептивами, але іноді також повідомлялося і про контрацептиви, що містять тільки прогестаген.

## Печінковий метаболізм.

Можуть виникати взаємодії з лікарськими препаратами, які індукують мікросомальні ферменти, що призводить до збільшення кліренсу статевих

гормонів [наприклад, гідантоїни (зокрема, фенітоїн), барбітурати (зокрема фенобарбітал), примідон, карбамазепін, рифампіцин; оксикарбазепін, рифабутин, топірамат, фельбамат, ритонавір, нелфінавір, гризеофульвін і препарати, що містять звиробій (*Hypericum perforatum*).].

Жінкам, які отримують лікування одним із цих препаратів, слід крім прийому препарату ДЕЗИРЕТТ тимчасово застосовувати бар'єрний метод або вибрати інший метод контрацепції. Бар'єрний метод доцільний під час застосування супутніх ліків і протягом 28 днів після припинення їх застосування.

Необхідно розглянути можливість застосування негормонального методу контрацепції жінкам, які перебувають на довготривалій терапії препаратами, що є індукторами мікросомальних ферментів печінки.

При застосуванні активованого вугілля всмоктування стероїду, що міститься в таблетці, може знизитися, а отже, може знизитися контрацептивна ефективність препарату. У такому разі слід чинити відповідно до рекомендацій пропуску прийому таблеток (див. „Як слід чинити у разі пропуску прийому таблеток”).

Гормональні контрацептиви можуть впливати на метаболізм інших ліків. Отже, концентрація в плазмі і в тканинах може збільшуватися (наприклад, циклоспорину) або зменшуватися.

Для виявлення можливих взаємодій слід ознайомитися з інструкцією для застосування лікарського засобу, який застосовують одночасно з препаратом ДЕЗИРЕТТ.

#### Лабораторні дослідження.

Прийом контрацептивів може впливати на результати окремих лабораторних тестів, включаючи біохімічні показники функції печінки, щитовидної залози, надниркових залоз і нирок, а також рівні транспортних білків плазми, таких як кортикостероїдзв'язуючий глобулін і фракції ліпідів/ліпопротеїнів, показники вуглеводного обміну, коагуляції і фібринолізу. Зміни зазвичай відбуваються в тканинах у межах лабораторних норм.

### **Особливості застосування**

#### Медичні обстеження/консультації.

Перед призначенням препарату слід ретельно ознайомитися з медичною історією жінки. Рекомендується провести ретельне гінекологічне обстеження для виключення вагітності. Перед призначенням препарату слід встановити причину порушень менструального циклу, наприклад олігоменореї і аменореї.

Інтервал між контрольними медичними оглядами у кожному окремому випадку залежить від поточних обставин. Якщо препарат може вплинути на наявне у жінки захворювання (див. „Особливості застосування”), то слід скласти відповідний графік контрольних медичних оглядів. Незважаючи на регулярний прийом препарату ДЕЗИРЕТТ, іноді можуть виникати нерегулярні кров'яні виділення. Якщо кровотечі дуже часті і нерегулярні, то слід передбачити застосування іншого методу контрацепції.

Якщо вказані вище симптоми є стійкими, то в цьому випадку необхідно виключити органічну патологію. Лікування аменореї під час застосування препарату залежить від того, чи приймався він відповідно до інструкції. У ряді випадків у дослідження слід включати проведення тестів на вагітність. У разі вагітності прийом препарату слід припинити.

Жінки повинні бути поінформовані про те, що препарат ДЕЗИРЕТТ не захищає від ВІЛ-інфекції (СНІДу) і від інших захворювань, що передаються статевим шляхом.

#### Попередження.

У разі виникнення будь-яких з перерахованих нижче станів/чинників ризику слід зіставити користь від застосування прогестагену і ризику для кожної окремої жінки і обговорити це з нею ще до того, як вона прийме рішення почати прийом препарату ДЕЗИРЕТТ. У разі погіршення, загострення перебігу захворювання або виникнення будь-якого з цих станів вперше жінці слід звернутися до лікаря. Лікар вирішить, чи потрібно припинити застосування препарату ДЕЗИРЕТТ.

Ризик раку молочної залози взагалі збільшується з віком. Під час застосування комбінованих пероральних контрацептивів (КПК) ризик раку молочної залози дещо збільшується. Цей підвищений ризик поступово зникає протягом 10 років після припинення застосування пероральних контрацептивів (ПК), він не пов'язаний з тривалістю застосування, а залежить від віку жінки, коли вона застосовувала КПК. Для відповідних вікових груп розрахована очікувана кількість діагностованих випадків раку молочної залози серед 10 000 жінок, які застосовували комбіновані ПК (протягом до 10 років після припинення їх застосування), порівняно з жінками, які ніколи їх не приймали (протягом того ж періоду часу). Кількість цих випадків вказана нижче в таблиці.

| <i>Вікова група</i> | <i>Очікувана кількість випадків серед жінок, які застосовували ПК</i> | <i>Очікувана кількість випадків серед жінок, які не застосовували ПК</i> |
|---------------------|---|--|
| 16-19 років         | 4,5   | 4  |

|             |      |     |
|-------------|------|-----|
| 20-24 роки  | 17,5 | 16  |
| 25-29 років | 48,7 | 44  |
| 30-34 роки  | 110  | 100 |
| 35-39 років | 180  | 160 |
| 40-44 роки  | 260  | 230 |

Ризик у тих, хто застосовує ПК, що містять тільки прогестаген, відповідає величині ризику у разі застосування комбінованих ПК. Проте дані стосовно ПК, що містять тільки прогестаген, не є остаточними. Ризик виникнення раку молочної залози, пов'язаний з прийомом КПК, порівняно з ризиком виникнення раку молочної залози впродовж всього життя, незначний. Рак молочної залози, що діагностується у жінок, які застосовували КПК, може розвиватись не так стрімко, як рак, що діагностується у жінок, які ніколи не застосовували КПК. Підвищена частота діагностування раку у жінок, які застосовують КПК, можливо, обумовлена більш ранньою діагностикою, біологічними ефектами препарату та комбінацією цих двох чинників.

Оскільки не можна виключити біологічний вплив прогестагенів на рак печінки, необхідно враховувати індивідуальні співвідношення ризику та користі для жінок з раком печінки.

У разі виникнення гострих або хронічних порушень функції печінки жінка повинна звернутися до фахівця для проведення обстеження та за консультацією.

Якщо при прийомі препарату ДЕЗИРЕТТ розвинеться стійка артеріальна гіпертензія або якщо значне підвищення артеріального тиску адекватно не відповідатиме на антигіпертензивну терапію, то необхідно припинити прийом препарату ДЕЗИРЕТТ.

У епідеміологічних дослідженнях встановлений зв'язок між застосуванням комбінованих ПК і підвищеною частотою виникнення венозних тромбоемболій (ВТЕ, тромбоз глибоких вен і емболія легеневої артерії). Хоча клінічне значення цих даних для дезогестрелу який не містить естрогенного компонента, невідомо, застосування препарату ДЕЗИРЕТТ, слід відмінити у разі розвитку тромбозу. Слід передбачити відміну застосування препарату ДЕЗИРЕТТ також і у разі тривалої іммобілізації, пов'язаної з операцією або із захворюванням. Жінки з тромбоемболічними порушеннями в анамнезі повинні знати про можливість рецидиву.

Хоча прогестагени можуть впливати на резистентність периферичних тканин до інсуліну і на толерантність до глюкози, немає підтвердження того, що необхідно

змінювати терапевтичну схему для хворих на цукровий діабет, які застосовують «пілі», що містять тільки прогестаген. Проте жінки, хворі на цукровий діабет, повинні знаходитися під ретельним спостереженням протягом першого місяця застосування.

Застосування препарату ДЕЗИРЕТТ веде до зниження рівня естрадіолу в сироватці крові до рівня, відповідного ранній фолікулярній фазі. До теперішнього часу невідомо, чи виявляє це зниження який-небудь клінічно значущий ефект на мінеральну щільність кісткової тканини.

Попередження ектопічної вагітності традиційними «пілі», такими, що містять тільки прогестаген, не так ефективно, як застосування комбінованих пероральних контрацептивів, оскільки при застосуванні традиційних «пілі», що містять тільки прогестаген, часто відбувається овуляція. Незважаючи на те, що препарат ДЕЗИРЕТТ ефективно інгібує овуляцію, у разі аменореї та болю в животі слід виключити позаматкову вагітність при проведенні диференційної діагностики.

Іноді може виникати хлоазма, особливо у жінок з хлоазмою в анамнезі. Жінкам зі схильністю до хлоазми слід уникати дії сонячних променів або ультрафіолетового випромінювання під час застосування препарату ДЕЗИРЕТТ.

Як під час вагітності, так і під час застосування стероїдних гормонів спостерігалось виникнення таких станів: жовтяниця та/або свербіж, пов'язані з холелітазом; утворення жовчних каменів; порфірія; системний червоний вовчак; гемолітичний уремичний синдром; хорея Сиденгама; герпес вагітних; втрата слуху, пов'язана з отосклерозом; ангіоневротичний набряк (спадковий). Але їх зв'язок із застосуванням прогестагенів не встановлений.

ДЕЗИРЕТТ містить менше 65 мг лактози і тому дуже мало ймовірно, що препарат буде впливати на стан здоров'я у жінок із рідкісними спадковими порушеннями, пов'язаними з непереносимістю галактози, недостатністю лактази Лаппа або порушенням всмоктуванням глюкози-галактози.

### **Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами**

Виходячи з фармакодинамічного профілю препарату, вважається, що ДЕЗИРЕТТ не впливає або спричиняє дуже незначний вплив на здатність керувати автомобілем і працювати з механізмами.

### **Застосування у період вагітності або годування груддю**

## Вагітність.

ДЕЗИРЕТТ не призначається під час вагітності. Якщо вагітність настає під час прийому ДЕЗИРЕТТ, прийом слід припинити.

Екстенсивні епідеміологічні дослідження показали, що не існує підвищеного ризику ні вроджених дефектів у дітей, які народилися у жінок, які застосовували пероральні контрацептиви (ПК) до вагітності, ні тератогенного ефекту, коли ПК ненавмисно приймали в ранній період вагітності. Дані фармагляду, зібрані щодо різних комбінованих ПК, що містять дезогестрел, також не свідчать про підвищений ризик.

## Лактація.

Як і інші контрацептиви, що містять тільки прогестаген, препарат ДЕЗИРЕТТ не впливає на кількість або якість (концентрації білків, лактози або жирів) грудного молока, але відомо, що невелика кількість етоногестрелу проникає у грудне молоко. 0,01-0,05 мкг ЕНГ на кг маси тіла в день може потрапити в організм дитини. Є деякі дані щодо тривалого тривалого спостереження за дітьми, чії матері розпочинали приймати препарат Дезиретт протягом 4-8-го тижня після пологів. Їх годували груддю упродовж 7 місяців, і вони знаходилися під спостереженням до 1,5 року (n=32) чи до 2,5 року (n=14). Оцінка росту, фізичного та психомоторного розвитку не виявила якихось відмінностей порівняно з малюками, чії матері користувалися внутрішньоматковою системою (ВМС). Проте необхідно ретельно спостерігати за ростом і розвитком дитини. За наявними даними, препарат ДЕЗИРЕТТ можна застосовувати під час годування груддю.

## **Спосіб застосування та дози**

Таблетки слід застосовувати в тому порядку, який зазначено на упаковці, щодня, приблизно в один і той самий час, за необхідності запиваючи невеликою кількістю рідини. Кожен день необхідно застосовувати по одній таблетці протягом 28 днів. Наступну упаковку починають відразу після використання попередньої упаковки.

## Як починати прийом препарату ДЕЗИРЕТТ.

*За відсутності попереднього застосування гормональних контрацептивів (протягом останнього місяця).*

Застосування таблеток слід починати в 1-й день менструального циклу (у 1-й день менструальної кровотечі). Допускається починати прийом на 2-5-й день, але тоді під час першого циклу протягом перших 7 днів прийому таблеток

рекомендується застосовувати бар'єрний метод контрацепції.

*Після абортів протягом I триместру.*

Після абортів протягом I триместру застосування препарату рекомендується розпочати одразу; додатковий метод контрацепції не потрібний.

*Після пологів або абортів протягом II триместру.*

Жінці необхідно рекомендувати починати застосування препарату на 21-28-й день після пологів або абортів протягом II триместру. Якщо прийом препарату починається в пізніші терміни, жінці слід додатково застосовувати бар'єрний метод протягом перших 7 днів прийому таблеток. Проте, якщо жінка після пологів або абортів до початку прийому препарату ДЕЗИРЕТТ вже жила статевим життям, то перед початком прийому препарату спочатку слід виключити вагітність або жінка повинна дочекатися першої менструації.

Як починати прийом препарату ДЕЗИРЕТТ при переході з інших методів контрацепції.

*Перехід з комбінованого гормонального контрацептиву (комбінованого перорального контрацептиву (КПК), вагінального кільця або трансдермального пластиру).*

Бажаючи, щоб жінка почала застосування препарату ДЕЗИРЕТТ наступного дня після останнього прийому активної таблетки (останньої таблетки, що містить активні речовини) або в день видалення вагінального кільця чи пластиру. У цих випадках немає необхідності в застосуванні додаткової контрацепції.

Якщо застосування препарату починається через день після останнього прийому активної таблетки КПК (останньої таблетки, що містить активні речовини) або дня видалення вагінального кільця чи пластиру, жінка повинна використовувати додатковий бар'єрний метод протягом перших 7 днів прийому таблеток.

*Перехід із застосування інших препаратів, що містять тільки прогестаген («міні-пілі», ін'єкції або внутрішньоматкова система, що вивільняє прогестаген [ВМС]).*

Жінка в будь-який день після припинення застосування „міні-пілі” може перейти на застосування препарату ДЕЗИРЕТТ(у випадку імплантату – у день його видалення, у випадку ін'єкції – замість наступної ін'єкції), немає необхідності в додатковому методі контрацепції.

Як слід чинити у разі пропуску прийому таблеток.



Контрацептивний захист може знизитися, якщо інтервал між прийомом двох таблеток становить більше 36 годин. Якщо запізнення з прийомом таблетки становить менше 12 годин, то пропущену таблетку слід прийняти відразу, як тільки жінка згадає про це, а наступну таблетку прийняти у звичайний час. Якщо запізнення з прийомом таблетки становить більше 12 годин, то жінка повинна застосовувати додатковий метод контрацепції протягом наступних 7 днів. Якщо прийом препарату було пропущено протягом першого тижня його застосування і мав місце статевий акт протягом тижня, що передував пропуску прийому таблеток, то в цьому випадку слід передбачити можливість вагітності.

#### Рекомендації у разі порушень з боку травного тракту.

У разі виникнення тяжких шлунково-кишкових розладів всмоктування може бути неповним, тому треба вживати додаткових заходів контрацепції. Якщо після прийому таблетки протягом 3-4 годин виникло блювання, то всмоктування може бути неповним. У цьому випадку слід додержуватись рекомендацій щодо пропущених таблеток, наведених у відповідному розділі (див. «Як слід чинити у разі пропуску прийому таблеток»).

#### **Діти**

ДЕЗИРЕТТ не призначають дітям.

#### **Передозування**

Не повідомлялося про серйозні шкідливі ефекти в результаті передозування. Симптоми, які можуть виникнути: нудота, блювання, у молодих дівчат – незначна вагінальна кровотеча. Антидот відсутній, подальше лікування повинно бути симптоматичним.

#### **Побічні реакції**

В клінічних випробуваннях препарату ДЕЗИРЕТТ найчастіше були зареєстровані такі побічні ефекти (>2,5 %): порушення менструації, акне, зміни настрою, біль у молочних залозах, нудота і збільшення маси тіла. Згідно з класифікацією MedDRA, показані побічні дії і їх частота (нечасто, рідко, дуже рідко), які пов'язані з застосуванням препарату.

| Клас системи/органів (MedDRA)                   | Частота побічних реакцій                                   |                                       |   |
|---|--|---------------------------------------|---|
|   | Поширені ( $\geq 1/100$ )                                  | Непоширені ( $< 1/100, \geq 1/1000$ ) | Рідко поширені ( $< 1/1000$ )               |
| Інфекції та інвазії                             |  | Вагінальна інфекція                   |   |
| З боку психіки                                  | Погіршення настрою, зниження лібідо                        |                                       |   |
| З боку нервової системи                         | Головний біль  |                                       |   |
| З боку органів зору                             |  | Непереносимість контактних лінз       |   |
| З боку травного тракту                          | Нудота   | Блювання                              |   |
| З боку шкіри та підшкірних тканин               | Акне   | Алопеція                              | Шкірний висип, уртикарія, вузликова еритема |
| З боку репродуктивної системи та молочних залоз | Біль у молочних залозах, нерегулярні менструації, аменорея | Дисменорея, кіста яєчників            |   |
| Загальні порушення                              |  | Втомлюваність                         |   |
| Лабораторні аналізи                             | Збільшення маси тіла                                       |                                       |   |

MedDRA\*-Система класифікації побічних реакцій на лікарські засоби, версія 9.0.

Можуть виникнути такі побічні реакції, як виділення з молочних залоз та дуже рідко-позаматкова вагітність.

У жінок, що застосовували пероральні контрацептиви (комбіновані), спостерігався ряд серйозних побічних реакцій. Вони включають венозні тромбоемболічні порушення, артеріальні тромбоемболічні порушення, гормонозалежні пухлини (наприклад, рак молочної залози, рак печінки) і хлоазму, деякі з них описані детальніше в розділі «Особливості застосування. Попередження».

**Термін придатності**

3 роки.

**Умови зберігання**

Спеціальних умов зберігання не вимагає.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

**Упаковка**

По 28 таблеток у блістері, по 1 блістеру в картонній коробці.

**Категорія відпуску**

За рецептом.

**Виробник**

Лабораторіос Леон Фарма, С.А.

**Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності**

С/Ла Валліна с/н, Полігоно Індустріал Наватеджера, Віллакілаамбре, 24008 Леон, Іспанія.

**Джерело інструкції**

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).