

Состав

действующее вещество: левоноргестрел;

1 таблетка содержит левоноргестрела 1,5 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, тальк, крахмал кукурузный, лактоза.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: плоские таблетки белого или почти белого цвета, с фаской, с гравировкой «G00» с одной стороны. Диаметр таблеток около 8 мм.

Фармакотерапевтическая группа

Половые гормоны и модуляторы половой системы. Экстренные контрацептивы. Код АТХ G03A D01.

Фармакодинамика

Точный механизм действия препарата Эскапел неизвестен. В рекомендуемых дозах левоноргестрел влияет на овуляцию и оплодотворение, если половой акт имеет место в предовуляторную фазу менструального цикла, то есть в момент наибольшей вероятности оплодотворения. При имплантации начавшейся препарат не эффективен.

Эффективность: согласно результатам ранее проведенного клинического исследования, 750 мкг левоноргестрела (в виде двух доз 750 мкг, принятых с интервалом в 12 часов) предотвращает беременность в 85% случаев. Видимо, чем больше времени прошло между половым актом и приемом препарата, тем ниже его эффективность (95% в течение первых 24 часов, 85% - в период с 24 до 48 часов, и 58% - в период от 48 до 72 часов).

Согласно результатам ранее проведенного клинического исследования, 2 таблетки левоноргестрела 750 мкг, принятые одновременно (в течение 72 часов после незащищенного полового акта), предотвращают беременности в 84% случаев. Различий в частоте беременности у женщин, принимавших препарат на третий или четвертый день после незащищенного полового акта, нет ($p > 0,2$).

Есть ограниченные данные, требующие дальнейшего подтверждения, о влиянии избыточной массы тела/высокого индекса массы тела (ИМТ) на контрацептивную эффективность. В трех исследованиях Всемирной Организации Здравоохранения (ВОЗ) наблюдалось отсутствие тенденции к снижению эффективности с увеличением массы тела/ИМТ (см. таблицу 1), в то время как в двух других исследованиях наблюдалось снижение эффективности с увеличением массы тела/ИМТ (см. таблицу 2). Оба мета-анализа проведены с исключением случаев приема препарата позднее 72 часов после незащищенного полового акта (применение не по назначению) и женщин, которые имели незащищенные половые акты после приема препарата.

Таблица 1.

ИМТ (кг/м ²)	Женщины с низкой массой тела 0-18,5	Женщины с нормальной массой тела 18,5-25	Женщины с избыточной массой тела 25-30	Женщины с ожирением ≥ 30
Общее количество	600	3952	1051	256
Количество беременностей	11	3952	6	3
Частота беременностей	1,83 %	0,99 %	0,57 %	1,17 %
Интервал колебаний	0,92-3,26	0,70-1,35	0,21-1,24	0,24-3,39

Таблица 2.

ИМТ (кг/м ²)	Женщины с низкой массой тела 0-18,5	Женщины с нормальной массой тела 18,5-25	Женщины с избыточной массой тела 25-30	Женщины с ожирением ≥ 30
Общее количество	64	933	339	212
Количество беременностей	1	9	8	11
Частота беременностей	1,56 %	0,96 %	2,36 %	5,19 %
Интервал колебаний	0,04-8,40	0,44-1,82	1,02-4,60	2,62-9,09

Рекомендуемые дозы левоноргестрела существенно не влияют на факторы свертывания крови, обмен жиров и углеводов.

Педиатрическая популяция

Перспективным надзорным исследованием было показано, что из 305 случаев применения таблеток левоноргестрела как экстренной контрацепции у семи женщин наступила беременность. Таким образом, общий показатель наступления беременностей составлял 2,3%. Показатель наступления беременностей у женщин в возрасте до 18 лет (2,6% или в 4 из 153) был сопоставим с таковым у женщин в возрасте от 18 лет (2,0% или в 3 из 152).

Фармакокинетика

При пероральном приеме левоноргестрел быстро и практически полностью всасывается.

По данным исследования 16 пациенток, через 2 часа после однократного приема левоноргестрела 1,5 мг $C_{max} = 18,5$ нг/мл.

После достижения максимальной концентрации уровень левоноргестрела в крови снижается, средний период полувыведения примерно – 26 часов.

Выводится в виде метаболитов с мочой и калом в равных соотношениях. Метаболизм левоноргестрела осуществляется метаболическим путем, характерным для стероидов. В печени левоноргестрел гидроксилируется и в виде конъюгатов с глюкуроновой кислотой выводится из организма.

Фармакологически активные метаболиты левоноргестрела неизвестны.

Левоноргестрел вступает в связь с альбумином и глобулином, связывающим половые гормоны (ГСПГ). 1,5% общего количества в плазме крови находится в форме свободного стероида, 65% специфически связаны с ГСПГ.

Биодоступность составляет 100% от принятой дозы.

0,1% принятой дозы попадает в организм младенца вместе с грудным молоком.

Показания

Для срочной пероральной контрацепции в первые 72 часа после полового акта, во время которого никаких методов контрацепции не применялось, или примененный метод не был достаточно надежным.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к компонентам препарата, тяжелая степень печеночной недостаточности; беременность.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Метаболизм левоноргестрела усиливается при одновременном применении индукторов ферментов печени, в основном индукторов ферментной системы CYP3A4. При одновременном применении с эфавиренцем уровень левоноргестрела в плазме крови (AUC) снижался примерно на 50%.

Лекарственные средства, содержащие нижеприведенные действующие вещества, могут снижать концентрацию левоноргестрела в плазме крови: барбитураты (в т.ч. примидон) фенитоин; карбамазепин; препараты растительного происхождения, содержащие *Hypericum perforatum* (зверобой продырявленный) рифампицин; ритонавир; рифабутин; гризеофульвин.

Женщины, которые принимали в течение последних 4 недель препараты - индукторы ферментов печени и нуждающихся в экстренной контрацепции, должны рассмотреть использование негормональных экстренных контрацептивов (например внутриматочной системы, которая содержит медь). Прием двойной дозы левоноргестрела (3000 мкг левоноргестрела в течение 72 часов после незащищенного полового акта) является альтернативным вариантом для тех женщин, которые не имеют возможности или не желают использовать внутриматочную систему, содержащую медь, хотя это специфическое сочетание (двойная доза левоноргестрела при применении индукторов микросомальных ферментов печени) ни была исследована.

Препараты, содержащие левоноргестрел, могут повышать токсичность циклоспорина за счет угнетения его метаболизма.

Особенности применения

«Срочная» контрацепция предназначена для экстренных случаев. Она ни в коем случае не заменяет регулярную контрацепцию. Следует избегать повторного применения таблеток Эскапел во время одного и того же менструального цикла во избежание нарушений цикла.

Препараты срочной контрацепции не во всех случаях предотвращают беременности. Вероятность оплодотворения велика в случаях, когда во время полового акта точно неизвестен и когда с момента незащищенного полового акта прошло более 72 часов в период одного менструального цикла. В таких случаях прием таблетки Эскапел после второго полового акта не принесет желаемого

результата. При задержке менструации дольше чем на 5 дней, а также в случае, когда менструация наступила вовремя, но протекает необычно или имеет место подозрение на беременность по каким-либо другим причинам, следует провести гинекологическое обследование для исключения наличия беременности, в том числе эктопической беременности. Абсолютный риск внематочной беременности, скорее всего, будет низким, поскольку левоноргестрел предотвращает овуляцию и оплодотворение. Внематочная беременность может продолжаться, несмотря на возникновение маточных кровотечений. Если беременность возникает после применения таблеток Эскапел, возможность внематочной беременности следует рассматривать особенно у тех женщин, которые обращаются с болью в брюшной/тазовой области или коллапсом и которые имели в анамнезе эктопическую беременность, операции на органах малого таза или их воспаление.

Поэтому, левоноргестрел не рекомендуется применять женщинам, у которых есть риск развития внематочной беременности (наличие в анамнезе сальпингита или эктопической беременности).

При тяжелых нарушениях функции печени применение таблеток Эскапел противопоказано.

Тяжелые нарушения всасывания в пищеварительном тракте (например, болезнь Крона) снижают эффективность противозачаточного препарата.

Применение препарата обычно не нарушает регулярность и нормальный характер менструаций. Однако иногда возможно преждевременное появление менструации или ее задержка. После применения таблетки Эскапел рекомендуется проконсультироваться с врачом для подбора или коррекции регулярной контрацепции. Если Эскапел применять из-за ошибок, допущенных в регулярной гормональной контрацепции, и при этом в соответствующий семидневный срок перерыва, менструация не начинается, следует исключить наличие беременности.

Есть ограниченные данные, требующие дальнейшего подтверждения о том, что контрацептивный эффект препарата Эскапел может снижаться с увеличением массы тела или индекса массы тела (ИМТ) (см раздел. «Фармакодинамика»). У всех женщин, независимо от их массы тела и ИМТ, средства экстренной контрацепции должны быть приняты как можно раньше после незащищенного полового акта.

По сравнению с обычными регулярными противозачаточными средствами таблетки Эскапел менее эффективны. Женщинам, которые часто прибегают к средству срочной контрацепции, следует посоветоваться с врачом для подбора

метода регулярной контрацепции.

Срочная контрацепция не заменяет необходимость в защите от венерических заболеваний.

Препарат содержит лактозу. Больным с редкой наследственной непереносимостью галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом мальабсорбции глюкозы или галактозы не следует применять препарат.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Исследований по изучению возможного влияния на способность управлять автотранспортом или другими рабочими механизмами не проводили.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Прием таблеток Эскапел в период беременности противопоказан. Препарат не вызывает прерывание беременности. По данным эпидемиологических исследований при беременности, возникшей на фоне применения экстренного контрацептива, препарат не оказывает нежелательного воздействия на плод, но клинических данных о возможных последствиях приема левоноргестрела в дозе более 1,5 мг нет.

Кормления грудью. Левоноргестрел проникает в грудное молоко. Потенциальное влияние левоноргестрела на ребенка можно уменьшить, принимая препарат непосредственно после кормления грудью или воздерживаясь от кормления грудью после приема препарата в течение 8 часов.

Фертильность. Левоноргестрел увеличивает возможность нарушений менструального цикла, в некоторых случаях приводит к более ранней или поздней овуляции. Эти изменения могут влиять на даты фертильного периода, однако данных по фертильности при длительном наблюдении нет.

Способ применения и дозы

Дозировка. 1 таблетку необходимо принять как можно скорее после незащищенного полового акта, желательно в первые 12 часов и не позднее 72 часов (см. раздел «Фармакологические свойства»).

Если в течение 3 часов после приема таблетки возникла рвота, необходимо принять еще 1 таблетку.

Женщинами, которые принимали в течение последних 4 недель препараты - индукторы ферментов печени и нуждающихся в экстренной контрацепции, рекомендуется использование негормональных контрацептивов (например, внутриматочной системы, которая содержит медь). Если женщина не имеет возможности или не желает использовать внутриматочную систему, содержащую медь, рекомендуется прием двойной дозы левоноргестрела (2 таблетки однократно) (см. раздел «Особенности применения»).

Таблетки Эскапел можно принимать в любой день менструального цикла при условии, что предыдущая менструация протекала нормально.

После применения экстренного средства для предотвращения зачатия, до начала следующей менструации, следует применять местные барьерные противозачаточные средства (презерватив, диафрагму, спермициды, шеечный колпачок). Применение таблетки Эскапел не является противопоказанием для продолжения регулярного приема перорального гормонального противозачаточного средства.

Способ применения. Таблетки для перорального применения.

Дети

Препарат Эскапел не предназначен для применения у детей подросткового возраста по показаниям экстренной контрацепции.

Передозировка

Данных о тяжелых побочных реакциях после приема больших доз препарата нет. Передозировка может вызвать тошноту и кровотечения отмены. Специфического антидота нет, лечение симптоматическое.

Побочные реакции

Частым нежелательным эффектом при применении препарата Эскапел была тошнота.

Системы органов согласно MedRA 16.0	Частота побочных реакций	
	очень часто (≥10 %)	часто (≥1 % - <10 %)

Со стороны нервной системы	головная боль	головокружение
Со стороны желудочно-кишечного тракта	тошнота, боль в нижнем отделе живота	диарея, рвота
Со стороны репродуктивной системы и молочных желез	кровотечение, которое не связано с менструацией	задержка менструации более чем на 7 дней, нерегулярные менструации, нагрубание молочных желез
Системные нарушения	повышенная утомляемость	

Возможна временная изменение характера менструации. У большинства женщин нарушение сроков менструации происходят в пределах 5 дней. При задержке менструации дольше чем на пятидневный срок следует исключить наличие беременности.

Во время постмаркетингового наблюдения отмечались дополнительно следующие побочные реакции:

со стороны желудочно-кишечного тракта:

редкие (<1/10000): боль в животе;

со стороны кожи и подкожной клетчатки:

редкие (<1/10000): сыпь, крапивница, зуд;

со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

редкие (<1/10000): боль в области малого таза, дисменорея;

системные нарушения:

редкие (<1/10000): отек лица.

Сообщение о подозреваемых побочные реакции

Сообщение о подозреваемых побочные реакции в период постмаркетингового наблюдения очень важны. Это дает возможность осуществлять контроль за соотношением польза/риск для лекарственных средств. Медицинские работники должны сообщать о подозреваемых побочные реакции.

Срок годности

5 лет.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке для защиты от воздействия света. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 1 таблетке в блистере. 1 блистер в картонной упаковке вместе с картонным футляром для хранения блистера.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ОАО «Гедеон Рихтер».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Н-1103, Будапешт, ул. Демреи, 19-21, Венгрия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).