

## **Состав**

*действующее вещество:* левоноргестрел;

1 таблетка содержит 0,75 мг левоноргестрела;

*вспомогательные вещества:* лактоза моногидрат, крахмал кукурузный гипромеллоза; тальк кремния диоксид коллоидный магния стеарат.

## **Лекарственная форма**

Таблетки.

*Основные физико-химические свойства:* круглые плоские таблетки без оболочки белого или почти белого цвета, со скошенными краями, с тиснением «403» с одной стороны и гладкие с другой стороны.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Гормональные контрацептивы для системного применения. Экстренные контрацептивы. Левоноргестрел. Код АТХ G03A D01.

## **Фармакодинамика**

Точный механизм действия левоноргестрела неизвестен.

Предполагается, что в рекомендуемых дозах левоноргестрел предотвращает овуляцию и оплодотворение, если половой акт происходит в преовуляторного фазе, когда вероятность оплодотворения максимальна. Препарат неэффективен, если процесс имплантации уже начался.

*Эффективность.* Согласно результатам клинического исследования, 750 мкг левоноргестрела (применяли две дозы по 750 мкг, принятые с интервалом в 12 часов) предотвращают беременности в 85% случаев. Вероятно, эффективность препарата снижается с увеличением времени, прошедшего после полового акта (95% при применении в течение 24 часов, 85% - при применении через 24-48 часов, 58% - при применении через 48-72 часа).

Согласно результатам клинического исследования, 2 таблетки левоноргестрела 750 мкг, принятые одновременно в течение 72 часов после незащищенного полового акта, предотвращают беременности в 85% случаев. Различий в частоте наступления беременности у женщин, принимавших препарат на 3-й или 4-й день после незащищенного полового акта, нет ( $p > 0,2$ ).

Есть ограниченные данные, требующие дальнейшего подтверждения влияния избыточной массы тела/высокого индекса массы тела (ИМТ) на контрацептивное 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-анализы проведены у женщин с исключением случаев приема препарата через 72 часа после незащищенного полового акта (применение не по назначению) и женщин, которые имели незащищенные половые акты после приема препарата.

Таблица 1

ИМТ (кг/м <sup>2</sup> )	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 <sup>2</sup> )	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.

При рекомендуемом режиме дозирования левоноргестрел не оказывает существенного влияния на факторы свертывания крови, липидный и углеводный обмен.

### **Фармакокинетика**

После приема внутрь левоноргестрел быстро и почти полностью всасывается.

По результатам исследования фармакокинетики у 16 здоровых женщин после приема 1,5 мг левоноргестрела максимальная концентрация в плазме крови составляет 18,5 нг/мл и достигается через 2 часа.

После достижения максимума концентрация левоноргестрела снижается, период полувыведения составляет около 26 часов.

Левоноргестрел выводится в виде метаболитов и не выводится в неизменном виде. Метаболиты левоноргестрела выводятся с мочой и калом примерно в равных количествах. Метаболизм левоноргестрела соответствует метаболизму стероидов. Левоноргестрел гидроксилируется в печени, а метаболиты выводятся в форме конъюгированных глюкуронаты. Фармакологически активные метаболиты левоноргестрела неизвестны.

Левоноргестрел связывается с альбумином сыворотки крови и с глобулином, связывающим половые гормоны (ГСПГ). Всего около 1,5% дозы находится в свободной форме, а 65% - специфически связывается с ГСПГ. Биодоступность левоноргестрела составляет почти 100%.

Около 0,1% дозы попадает в организм ребенка с грудным молоком.

### **Показания**

Экстренная контрацепция в течение 72 часов после незащищенного полового акта или в случае если применен метод контрацепции был ненадежен.

### **Противопоказания**

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

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Метаболизм левоноргестрела активизируется при одновременном применении препаратов, которые являются индукторами печеночных ферментов, преимущественно индукторами ферментной системы СYP3A4. При одновременном применении с эфавирензом было выявлено снижение уровня левоноргестрела в плазме (AUC) приблизительно на 50%.

К лекарственным средствам, которые, вероятно, могут снижать уровень левоноргестрела в плазме, принадлежат барбитураты (включая примидон), фенитоин, карбамазепин, растительные препараты, содержащие зверобой (*Hypericum perforatum St. John's Wort*), рифампицин, ритонавир, рифабутин и гризеофульвин.

В некоторых случаях, при одновременном применении с ингибиторами протеазы ВИЧ, или нуклеозидными ингибиторами обратной транскриптазы были отмечены значительные изменения (увеличение или уменьшение) уровня левоноргестрела в плазме крови.

Женщинам, которые принимают в течение последних 4 недель препараты, которые являются индукторами микросомальных ферментов печени, в случае необходимости экстренной контрацепции следует рассмотреть вопрос о применении негормональных экстренных контрацептивов (например, медной внутриматочной системы (ВМС)). Прием двойной дозы левоноргестрела (например, 3 мг левоноргестрела в течение 72 часов после незащищенного полового акта) рекомендуется для тех женщин, которые не имеют возможности или не желают использовать медную ВМС, хотя это специфическое сочетание (двойная доза левоноргестрела при применении индукторов микросомальных ферментов печени) не исследовались.

Лекарственные средства, содержащие левоноргестрел, могут повышать токсичность циклоспорина в связи с возможным угнетением его метаболизма.

## **Особенности применения**

Экстренная контрацепция - это метод, который можно использовать эпизодически. Она не должна заменять регулярную контрацепцию.

Экстренная контрацепция не во всех случаях позволяет предотвратить наступление беременности.

Если есть сомнения относительно времени незащищенного полового акта или если с момента незащищенного контакта прошло более 72 часов в течение этого же менструального цикла, то существует вероятность того, что зачатие уже произошло. В связи с этим применение препарата Лергесан при повторном

половом акте может оказаться неэффективным по предотвращению беременности. Если менструальный цикл задерживается более чем на 5 дней или если в день ожидаемой менструации наблюдается необычное кровотечение, или если есть другие основания предположить наступления беременности, то необходимо исключить беременность.

Если беременность наступила после применения препарата Лергесан, следует рассмотреть возможность эктопической беременности. Абсолютная вероятность внематочной беременности низкая, поскольку левоноргестрел предотвращает овуляцию и оплодотворение.

Внематочная беременность может развиваться, несмотря на маточное кровотечение. Следует рассмотреть возможность эктопической беременности, особенно у женщин, которые обратились с болью в брюшной / тазовой области или коллапсом и которые имели в анамнезе эктопическую беременность, операции на органах малого таза или их воспаление. Таким образом, препарат следует применять с повышенной осторожностью пациенткам с риском развития внематочной беременности (сальпингит или внематочная беременность в анамнезе).

Применение препарата Лергесан не рекомендуется пациенткам с серьезным нарушением функции печени.

На эффективность препарата Лергесан могут негативно влиять тяжелые синдромы мальабсорбции, например болезнь Крона. Женщины с подобными заболеваниями при необходимости проведения экстренной контрацепции должны обратиться к врачу.

После приема Лергесану обычно не нарушается регулярность и характер менструации. Иногда менструация может начинаться на несколько дней раньше или позже. Женщинам следует рекомендовать обратиться к врачу, чтобы подобрать и начать использовать один из методов регулярной контрацепции. Если не наступает кровотечение отмены в следующем периоде без таблеток, после применения препарата Лергесан и после применения регулярной гормональной контрацепции, беременность должна быть исключена.

Повторное применение препарата в течение одного менструального цикла не рекомендуется в связи с возможностью нарушения цикла.

Есть ограниченные данные, требующие дальнейшего подтверждения того, что контрацептивный эффект левоноргестрела может снижаться с увеличением массы тела или ИМТ. Всем женщинам, независимо от их массы тела и ИМТ, средства экстренной контрацепции следует принять как можно раньше после

незащищенного полового акта.

Лергесан неэффективен как средство регулярного метода контрацепции, его можно применять только как экстренная мера. Женщинам, которые обращаются по поводу повторной экстренной контрацепции, следует рекомендовать использовать долгосрочные методы контрацепции.

Применение экстренной контрацепции не заменяет необходимых мер, связанных с защитой от заболеваний, передающихся половым путем.

Данное лекарственное средство содержит лактозу, поэтому его не следует применять пациенткам с редкими наследственными нарушениями толерантности к галактозы, непереносимостью лактозы или синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы.

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

Действие препарата на способность управлять автотранспортом или другими механизмами не исследовались.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

#### *Беременность*

Прием таблеток Лергесан 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. Однако нет клинических данных о возможных последствиях при применении дозы, превышающей 1,5 мг левоноргестрела.

#### *Период кормления грудью*

Левоноргестрел проникает в грудное молоко. Потенциальное воздействие на ребенка левоноргестрел 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 более поздней овуляции. Эти изменения могут влиять на дату фертильного периода, однако данных о фертильности при длительном наблюдении нет.

## **Способ применения и дозы**

### Дозы

Необходимо применить 2 таблетки по 0,75 мг. Обе таблетки необходимо принять вместе как можно быстрее, желательно в течение 12 часов и не позднее чем через 72 часа после незащищенного полового акта (см. Раздел «Фармакологические свойства»).

Если в течение 3-х часов после приема таблеток возникает рвота, следует принять еще 2 таблетки немедленно.

Женщинам, которые в течение последних 4-х недель принимали ферментиндукующие препараты и которым необходима экстренная контрацепция, рекомендуется использовать негормональные методы экстренной контрацепции, то есть медную ВМС, или принять двойную дозу левоноргестрела (т.е. 2 таблетки по 1,5 мг или 4 таблетки по 0,75 мг одновременно) для женщин, которые не могут или не хотят использовать медную ВМС (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Лергесан можно использовать в любой фазе менструального цикла при отсутствии задержки менструального кровотечения.

После применения экстренной контрацепции рекомендуется использовать местный барьерный метод (например, презервативы, мембраны, спермицид, цервикальный колпачок) до начала следующей менструации. Применение Лергесану не является противопоказанием для продолжения регулярной гормональной контрацепции.

### **Дети**

Препарат Лергесан не предназначен для применения у детей подросткового возраста по показаниям экстренная контрацепция.

### **Передозировка**

О серьезных побочных эффектах после острой передозировки большими дозами пероральных контрацептивов не сообщалось. При передозировке возможны

тошнота и прорывные кровотечения. Специфических антидотов не существует, лечение симптоматическое.

## Побочные реакции

Наиболее частым нежелательным эффектом была тошнота.

Таблица 3

Класс системы органов	Частота нежелательных реакций	
	Очень часто (> 10 %)	Часто (от > 1 % до < 10%)
Со стороны нервной системы	головная боль	головокружение
Со стороны пищеварительной системы	Тошнота, боль в нижних отделах живота	диарея, рвота
Со стороны репродуктивной системы и молочных желез	кровотечение, не связанное с менструацией	задержка менструации более чем на 7 дней, нерегулярные кровотечения (кровянистые выделения), набухание молочных желез
Системные нарушения	повышенная утомляемость	

Характер кровотечения может несколько измениться, однако у большинства женщин следующая менструация начинается в пределах 5-7 дней от предполагаемого срока.

Если есть задержка менструации более чем на 5 дней, следует исключить беременность.

По данным постмаркетинговых наблюдений, дополнительно сообщалось о таких побочных реакциях:

*Со стороны кожи и подкожных тканей:* очень редко (<1/10000): зуд, крапивница, сыпь.

*Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: очень редко (<1/10000): боль в области таза, дисменорея (расстройство менструального цикла).*

*Со стороны желудочно-кишечного тракта: очень редко (<1/10000): боль в животе.*

*Системные нарушения: очень редко (<1/10000): отек лица.*

### **Срок годности**

3 года.

### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 °С в защищенном от света месте.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 2 таблетки в блистере, по 1 блистеру в картонной упаковке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд.

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Барода Хайвей, Халол, Гуджарат, 389350, Индия.

### **Источник инструкции**

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