Холетар



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки	**1 таб.**
ловастатин	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал прежелатинизированный, бутилгидроксианизол (BHA), красящее вещество Color Patient Blue V (E131), крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки	**1 таб.**
ловастатин	40 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал прежелатинизированный, бутилгидроксианизол (BHA), красящее вещество Quinoline Yellow (E104), красящее вещество Patient Blue V (E131), крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ловастатин является ингибитором эндогенного синтеза холестерина в печени. В организме, ловастатин, в форме неактивного лактона, непосредственно гидролизуется до соответствующей β-гидроксикислоты - терапевтически активной формы. Эта активная форма действует в качестве конкурентного, ингибитора 3-гидрокси-3-метилглутарил-коэнзим А редуктазы (ГМГ-КоА редуктаза) - фермент, который катализирует превращение ГМГ-КоА в мевалонат - начальнойступени биосинтеза холестерина.

Высокоэффективен в отношении снижения общего холестерина в крови и холестерина в составе ЛПНП (липопротеины низкой плотности) и ЛПОНП (липопротеины очень низкой плотности). Также уменьшает концентрацию триглицеридов в плазме крови и умеренно повышает концентрацию ЛПВП (липопротеины высокой плотности). Другие эффекты
ловастатина (улучшениефункции эндотелия, стабилизация бляшек, противовоспалительный и антитромбогенный эффект), некоторые из которых не имеют прямого отношения к эффекту снижения липидов, способствуют антиатеросклеротическому эффекту ловастатина. Выраженный терапевтический эффект препарата проявляется в течение 2 недель, а максимальный - через 4-6 недель с момента начала лечения.

Фармакокинетика

В ЖКТ ловастатин всасывается медленно и не полностью - около 30% принятой дозы, прием натощак снижает

абсорбцию на 30%. C_{max} терапевтическая достигается через 2-4 ч, затем концентрация в плазме крови быстро снижается, составляя через 24 ч 10% от максимума. Связывание с белками плазмы крови - 95%. C_{ss} ловастатина и его активных метаболитов при однократном назначении на ночь достигается на 2-3 сутки терапии и в 1.5 раза выше, чем после однократного приема. Препарат проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры. Подвергается интенсивному метаболизму при первом прохождении через печень. $T_{1/2}$ - 3 ч. Выводится через кишечник - 83%, почками - 10%.

Показания к применению:

— первичная гиперлипидемия (типы IIa и IIb), включая наследственную гиперхолестеринемию и смешанную гиперлипидемию;

— замедление прогрессирования коронарного атеросклероза, при лечении пациентов с коронарной патологией сердца в составе комбинированной терапии.

Относится к болезням:

- Атеросклероз
- Гиперхолестеринемия
- Холера

Противопоказания:

— заболевания печени в активной фазе;

— стойкие подъемы активности печеночных трансаминаз (не выясненной этиологии);

— выраженная печеночная недостаточность;

— общее тяжелое состояние пациента;

— беременность;

— период лактации;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлена);

— повышенная индивидуальная чувствительность к препарату или каким-либо из его ингредиентов.

С *осторожностью* - заболевания печени (в анамнезе), хронический алкоголизм, трансплантация органов, сопутствующая иммунодепрессивная терапия, хроническая почечная недостаточность, ургентные хирургические манипуляции (в т.ч. стоматологические), при одновременное приеме с гемфиброзилом и другими фибратами, ниацином (из-за риска развития миопатии).

Способ применения и дозы:

Дозировка и длительность приема определяются лечащим врачом.

Таблетки принимают внутрь.

Начальная доза - 20 мг принимается 1 раз/сут во время ужина. При необходимости для достижения целевых значений уровня холестерина в сыворотке крови доза Холетара может увеличиваться - максимально до 80 мг/сут в один или несколько приемов. При необходимости через 4 недели после начала приема, доза может быть скорректирована: в случае снижения концентрации в плазме общего холестерина до 140 мг/100 мл (3.6 ммоль/л) или холестерина-ЛПНП - до 75 мг/100 мл (1.94 ммоль/л) дозу следует уменьшить. Максимальная рекомендуемая доза для пациентов, одновременно принимающих циклоспорин - 20 мг/сут.

Увеличивать дозы более 20 мг/сут у **пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина меньше 30 мл/мин)** следует с осторожностью.

Побочное действие:

Холетар, как правило, переносится хорошо.

Со стороны пищеварительной системы: во рту, нарушение вкуса, снижение аппетита, гастралгия, холестатическая желтуха, нарушение функции печени, гепатит, острый панкреатит.

Со стороны ЦНС: головокружение, головная боль, общая слабость, бессонница, судороги, парестезии, психические нарушения.

Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, миозит, миопатия, рабдомиолиз (у больных, получающих одновременно циклоспорин, гемфиброзил или никотиновую кислоту), артралгия.

Со стороны органов кроветворения: гемолитическая анемия, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны органов чувств: туман перед глазами, помутнение хрусталика, катаракта, атрофия зрительного нерва.

Лабораторные показатели: повышение активности печеночных трансаминаз, повышение активности креатинфосфокиназы (КФК).

Аллергические реакции: крапивница, отек Квинке, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), кожная сыпь, зуд.

Прочие: снижение потенции, острая почечная недостаточность (обусловленная рабдомиолизом), боль в грудной клетке, сердцебиение.

Пациенты должны информировать лечащего врача о каких-либо появляющихся побочных эффектах, включая и те, которые не описаны в инструкции по применению.

Передозировка:

Было описано несколько случаев случайного приема больших доз препарата, но специфических симптомов у пациентов при этом не наблюдалось. При передозировке рекомендуется контролировать функцию печени.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации. **Женщинам детородного возраста** рекомендуется принимать ловастатин только в том случае, если вероятность беременности может быть надежно исключена.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременный прием Холетара и никотиновой кислоты, циклоспорина, макролидных антибиотиков, азоловых противогрибковых препаратов, ингибиторов ВИЧ-протеазы, нефазодона может привести к повышению концентрации ловастатина в плазме крови, вследствие чего может развиться миопатия с рабдомиолизом и почечной недостаточностью. Тот же механизм задействован при употреблении грейпфрутового сока во время курса лечения ловастатином.

Одновременный прием Холетара с производными фиброевой кислоты (гемфиброзил) также может привести к развитию миопатии, хотя механизм в этом случае не ясен.

Совместное назначение Холетара и варфарина может усилить влияние последнего на параметры свертываемости крови, в связи с чем может повыситься риск кровотечений. В случае совместного приема этих двух препаратов рекомендуется с соответствующей частотой проводить определение протромбинового времени до момента достижения стабильных цифр этого показателя.

Колестирамин и колестипол снижают биодоступность (применение ловастатина возможно через 4 ч после приема указанных препаратов, при этом отмечается аддитивный эффект).

Особые указания и меры предосторожности:

Лечение ловастатином должно сопровождаться соответствующей диетой (с низким содержанием холестерина)

Терапия ловастатином может вызвать повышение активности печеночных ферментов. Это повышение, как правило, невелико и клинически незначимо. Однако рекомендуется контролировать уровни ферментов до начала терапии и во время курса лечения через равные промежутки времени (в течение 1 года, далее не реже 1 раза в 6 месяцев).

Какие-либо особые отклонения от нормы, требующие прерывания лечения, редки. Если повышение активности АСТ и/или АЛТ превышает в 3 раза величину верхней границы нормы, терапия Холетаром должна быть прекращена.

Лечение Холетаром должно быть прекращено и в том случае, если активность креатинфосфокиназы значительно превышает норму (10-кратное превышение верхней границы). Терапия Холетаром может приводить к развитию миопатии, и как следствие, к рабдомиолизу и почечной недостаточности. Повышенный риск миопатии существует также у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью, если установлена или заподозрена миопатия, и у пациентов с тяжелыми острыми инфекционными заболеваниями при указании на миопатию или при наличии риска развития почечной недостаточности в результате рабдомиолиза (тяжелая острая инфекция, артериальная гипотензия, обширное хирургическое вмешательство, травма, тяжелые метаболические, эндокринные или электролитные нарушения и не поддающаяся медикаментозному контролю эпилепсия).

Пациентам следует своевременно информировать своего лечащего врача в случае появления необъяснимой болезненности в мышцах, особенно если она сопровождается недомоганием или лихорадкой.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не отмечалось какого-либо влияния на способность управлять автомобилем или работать с техническими устройствами.

При нарушениях функции почек

Увеличивать дозы более 20 мг/сут у **пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина меньше 30 мл/мин)** следует с осторожностью.

При нарушениях функции печени

Противопоказан:

— заболевания печени в активной фазе;

— стойкие подъемы активности печеночных трансаминаз (не выясненной этиологии);

— выраженная печеночная недостаточность.

С *осторожностью* - заболевания печени (в анамнезе).

Терапия ловастатином может вызвать повышение активности печеночных ферментов. Это повышение, как правило, невелико и клинически незначимо. Однако рекомендуется контролировать уровни ферментов до начала терапии и во время курса лечения через равные промежутки времени (в течение 1 года, далее не реже 1 раза в 6 месяцев).

Какие-либо особые отклонения от нормы, требующие прерывания лечения, редки. Если повышение активности АСТи/или АЛТ превышает тройную величину верхней границы нормы, терапия Холетаром должна быть прекращена.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлена).

Условия хранения:

Список Б. Хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Holetar