Лескол

Код АТХ:

- C10AA04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Флувастатин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гиполипидемическое средство из группы статинов, ингибитор ГМГ-КоА-редуктазы. По принципу конкурентного антагонизма молекула статина связывается с той частью рецептора коэнзима А, где прикрепляется этот фермент. Другая часть молекулы статина ингибирует процесс превращения гидроксиметилглутарата в мевалонат, промежуточный продукт в синтезе молекулы холестерина. Ингибирование активности ГМГ-КоА-редуктазы приводит к серии последовательных реакций, в результате которых снижается внутриклеточное содержание холестерина и происходит компенсаторное повышение активности ЛПНП-рецепторов и соответственно ускорение катаболизма холестерина Хс-ЛПНП.

Гиполипидемический эффект статинов связан со снижением уровня общего Хс за счет Хс-ЛПНП. Снижение уровня ЛПНП является дозозависимым и имеет не линейный, а экспоненциальный характер.

Статины не влияют на активность липопротеиновой и гепатической липаз, не оказывают существенного влияния на синтез и катаболизм свободных жирных кислот, поэтому их влияние на уровень ТГ вторично и опосредовано через их основные эффекты по снижению уровня Хс-ЛПНП. Умеренное снижение уровня ТГ при лечении статинами, по-видимому, связано с экспрессией ремнантных (апо Е) рецепторов на поверхности гепатоцитов, участвующих в катаболизме ЛППП, в составе которых примерно 30% ТГ.

Помимо гиполипидемического действия, статины оказывают положительное влияние при дисфункции эндотелия (доклинический признак раннего атеросклероза), на сосудистую стенку, состояние атеромы, улучшают реологические свойства крови, обладают антиоксидантными, антипролиферативными свойствами.

Фармакокинетика

C_{max}, AUC, $T_{1/2}$ флувастатина зависят от принимаемой лекарственной формы, времени приема пищи, содержания жиров в пище, длительности приема препарата и индивидуальных особенностей метаболизма.

V_d - 330 л. Связывание с белками плазмы - более 98%.

Подвергается интенсивному метаболизму при "первом прохождении" через печень до поступления в системный кровоток. У больных с печеночной недостаточностью существует вероятность кумуляции препарата.

Выводится в виде метаболитов через желчные пути (93%), с мочой (6%), в неизмененном виде - 2%. Пути биотрансформации флувастатина не связаны с изоферментами системы цитохрома P450 и метаболизм практически не изменяется под действием препаратов, влияющих на эту ферментную систему. Основные компоненты, циркулирующие в крови, - флувастатин и фармакологически неактивный метаболит - N-дезизопропил-пропионовая кислота. Гидроксилированные метаболиты обладают фармакологической активностью, но в системный кровоток они не поступают.

Показания к применению:

Первичная гиперхолестеринемия (гиперхолестеринемия IIa-IIb) при отсутствии или недостаточной эффективности диетотерапии.

Относится к болезням:

- Гиперхолестеринемия
- Холера

Противопоказания:

Активный патологический процесс в печени, стойкое повышение уровня печеночных трансаминаз в крови, почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин или содержание сывороточного креатинина более 250 мкмоль/л), нарушение тонуса мышц неясного генеза, повышение активности КФК, беременность, лактация, повышенная чувствительность к флувастатину.

Способ применения и дозы:

Средняя доза - внутрь по 20-40 мг 1 раз/сут обычно вечером.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия, боли в абдоминальной области, тошнота, запор, диарея; очень редко - гепатит.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - головная боль, головокружение, бессонница; иногда - парестезии, дизестезия, гипестезия (возможно связанные с основным заболеванием).

Аллергические реакции: редко - сыпь, крапивница; очень редко - экзема, дерматит, экзантема, ангионевротический отек, тромбоцитопения, васкулит, волчаночно-подобный синдром.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - миалгия, болезненность мышц, мышечная слабость, миопатия; очень редко - миозит, рабдомиолиз.

Со стороны лабораторных показателей: повышение активности печеночных трансаминаз, КФК, ЩФ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Флувастатин противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Женщинам детородного возраста в период терапии флувастатином необходимо применять надежные методы контрацепции. Если все же на фоне лечения флувастатином наступает беременность, лечение следует немедленно прекратить.

Поскольку ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы снижают синтез холестерина и, вероятно, других биологически активных веществ - производных холестерина, при назначении этих препаратов беременным женщинам они могут нанести вред плоду.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с варфарином усиливается антикоагулянтное действие варфарина.

При одновременном применении с колестирамином уменьшается биодоступность флувастатина, при этом общий гиполипидемический эффект усиливается.

При одновременном применении с рифампицином уменьшается концентрация флувастатина в плазме крови, по-видимому, вследствие усиления его метаболизма в печени под влиянием рифампицина, который является индуктором микросомальных ферментов печени.

При одновременном применении с циклоспорином имеются сообщения о развитии миалгии и повышении активности КФК.

При одновременном применении с циметидином, ранитидином, омепразолом возможно увеличение абсорбции флувастатина.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с заболеваниями печени, при хроническом алкоголизме, диффузных миалгиях, при эпилепсии, почечной недостаточности.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин или содержании сывороточного креатинина более 250 мкмоль/л). С осторожностью применяют у пациентов с умеренной почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при активном патологическом процессе в печени, стойком повышении уровня печеночных трансаминаз в крови. С осторожностью применяют у пациентов с заболеваниями печени.

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