

## Ловастерол



### Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Ловастатин](#)

### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)  
[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>  
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Фармакотерапевтическая группа:

- [Метаболики](#)

### Фармакологические свойства:

#### Фармакодинамика

Гиполипидемическое средство из группы статинов, ингибитор ГМГ-КоА-редуктазы. Является пролекарством, поскольку имеет в своей структуре закрытое лактоновое кольцо, которое после поступления в организм гидролизуется.

Лактоновое кольцо статинов по своей структуре схоже с частью фермента 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.

По данным контролируемых исследований ловастатин повышает уровень Хс-ЛПВП до 10%.

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

При приеме внутрь ловастатин медленно и не полностью (около 30% принятой дозы) абсорбируется из ЖКТ. Прием

## Ловастерол

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

---

натошак снижает абсорбцию на 1/3.  $C_{max}$  достигается в течение 2-4 ч, затем уровень в плазме быстро снижается, составляя через 24 ч 10% от максимума. Связывание с белками плазмы - 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.

Ловастатин проникает через ГЭБ и плацентарный барьер. Подвергается интенсивному метаболизму при "первом прохождении" через печень, окисляется до бета-гидроксикислоты, ее 6-оксипроизводного и других метаболитов, часть из которых фармакологически активны (блокируют 3-гидрокси-3-метилглутарил-коэнзим А-редуктазу).  $T_{1/2}$  - 3 ч. Через кишечник выводится 83%, 10% - почками.

### Показания к применению:

Первичные гиперхолестеринемии (гиполиппротеинемии IIa и IIb типов) с высоким содержанием ЛПНП (при неэффективности диетотерапии у пациентов в повышенном риском возникновения коронарного атеросклероза), комбинированная гиперхолестеринемия и гипертриглицеридемия, атеросклероз.

### Относится к болезням:

- [Атеросклероз](#)
- [Гипертриглицеридемия](#)
- [Гиперхолестеринемия](#)
- [Холера](#)

### Противопоказания:

Острые заболевания печени, повышение активности печеночных трансаминаз в сыворотке крови неясной этиологии, беременность (или ее вероятность), лактация (грудное вскармливание), тяжелое общее состояние пациента, повышенная чувствительность к ловастатину.

### Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Начальная доза - 10-20 мг 1 раз/сут вечером во время еды. При необходимости увеличивают дозу 1 раз в 4 недели.

*Максимальная суточная доза* составляет 80 мг в 1 или 2 приема (во время завтрака и ужина). В случае снижения концентрации в плазме  $X_c$  до 140 мг/дл (3.6 ммоль/л) или  $X_c$ -ЛПНП до 75 мг/дл (1.94 ммоль/л) дозу ловастатина следует уменьшить.

При одновременном применении с препаратами, подавляющими иммунитет, суточная доза ловастатина не должна превышать 20 мг.

### Побочное действие:

*Со стороны пищеварительной системы:* изжога; редко - тошнота, диарея, запор, метеоризм, сухость во рту, нарушения вкуса, анорексия, повышение активности печеночных трансаминаз в крови, в единичных случаях - холестатическая желтуха, гепатит, панкреатит, гастралгия, нарушение функции печени.

*Со стороны костно-мышечной системы:* миалгии, миопатии, миозит, рабдомиолиз (при одновременном применении циклоспорина, гемфиброзила или никотиновой кислоты), артралгии, повышение содержание экстракардиальной фракции КФК в плазме крови.

*Со стороны ЦНС и периферической нервной системы:* головокружение, головная боль, нарушения сна, судороги, парестезии; в единичных случаях - психические нарушения.

*Со стороны системы кроветворения:* гемолитическая анемия, лейкопения, тромбоцитопения.

*Со стороны органа зрения:* затуманивание зрения, помутнение хрусталика, катаракта, атрофия зрительного нерва.

*Аллергические реакции:* кожная сыпь, зуд; в единичных случаях - крапивница, отек Квинке, токсический эпидермальный некролиз.

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

## **Применение при беременности и кормлении грудью:**

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

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

При одновременном применении с антибиотиками группы макролидов, гемфиброзилом, иммунодепрессантами (в т.ч. с циклоспорином), никотиновой кислотой повышается риск развития рабдомиолиза с последующим развитием острой почечной недостаточности (особенно у пациентов с диабетической нефропатией).

При одновременном применении с антикоагулянтами, производными кумарина и индандиола отмечается усиление кровоточивости и увеличение протромбинового времени.

При одновременном применении с пероральными контрацептивами ловастатин может предотвращать гиперлипидемию, обусловленную приемом гормональных контрацептивов.

Полагают, что возможно уменьшение гиполипидемического действия ловастатина при одновременном применении "петлевых" и тиазидных диуретиков.

Дилтиазем, верапамил, исрадипин ингибируют изофермент CYP3A4, который участвует в метаболизме ловастатина, поэтому при одновременном применении возможно повышение концентрации ловастатина в плазме крови и увеличение риска развития миопатии.

Имеются сообщения о развитии острого рабдомиолиза и гепатотоксичности при одновременном применении с итраконазолом.

Описан случай развития тяжелой гиперкалиемии у пациента с сахарным диабетом при одновременном применении лизиноприла.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

С осторожностью применяют у пациентов с заболеваниями печени в анамнезе, а также при хроническом алкоголизме.

Ловастатин следует отменить в случае стойкого повышения содержания в крови печеночных трансаминаз и/или КФК, а также при общем тяжелом состоянии пациента вследствие какого-либо заболевания.

### ***При нарушениях функции печени***

Противопоказан при острых заболеваниях печени, повышении активности печеночных трансаминаз в сыворотке крови неясной этиологии. С осторожностью применяют у пациентов с заболеваниями печени в анамнезе.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Lovasterol>