

## Розуфаст



### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

#### Форма выпуска, описание и состав

**Таблетки, покрытые пленочной оболочкой** розового цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе ядро таблетки от белого или почти белого цвета.

	<b>1 таб.</b>
розувастатин кальция	20.8 мг,
что соответствует содержанию розувастатина	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 330.1 мг, кальция фосфат - 25 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10 мг, кросповидон - 6 мг, бутилгидрокситолуол - 0.01 мг, тальк - 6 мг, магния стеарат - 2 мг.

**Состав оболочки:** Опадрай II розовый (31K84972) (гипромеллоза (28%), титана диоксид (23.4%), лактозы моногидрат - (40%), триацетин (8%), краситель железа оксид красный (0.6%)) - 8 мг.

10 шт. - блистеры Ал/Ал (3) - пачки картонные.

### 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.

Терапевтический эффект проявляется в течение 1 нед. после начала терапии и через 2 недели лечения составляет 90% от максимально возможного эффекта, который обычно достигается к 4 неделе и после этого остается постоянным.

### **Фармакокинетика**

После приема внутрь  $C_{max}$  розувастатина в плазме крови достигается приблизительно через 5 ч. Биодоступность - примерно 20%.

Розувастатин накапливается в печени.  $V_d$  - примерно 134 л. Связывание с белками плазмы (преимущественно с альбумином) составляет приблизительно 90%.

Биотрансформируется в небольшой степени (около 10%), являясь непрофильным субстратом для изоферментов системы цитохрома P450. Основным изоферментом, участвующим в метаболизме розувастатина, является CYP2C9. Изоферменты CYP2C19, CYP3A4 и CYP2D6 вовлечены в метаболизм в меньшей степени.

Основными выявленными метаболитами розувастатина являются N-дисметил и лактоновые метаболиты. N-дисметил примерно на 50% менее активен, чем розувастатин, лактоновые метаболиты фармакологически не активны.

Около 90% дозы розувастатина выводится в неизменном виде с калом. Оставшаяся часть выводится с мочой. Плазменный  $T_{1/2}$  - примерно 19 ч.  $T_{1/2}$  не изменяется при увеличении дозы. Среднее значение плазменного клиренса составляет приблизительно 50 л/ч (коэффициент вариации 21.7%).

Как и в случае других ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы, в процесс печеночного захвата розувастатина вовлечен мембранный переносчик Xc, выполняющий важную роль в печеночной элиминации розувастатина.

Системная экспозиция розувастатина увеличивается пропорционально дозе.

У пациентов с выраженной почечной недостаточностью ( $КК < 30$  мл/мин) концентрация розувастатина в плазме крови в 3 раза выше, а концентрация N-дисметила в 9 раз выше, чем у здоровых добровольцев. Концентрация розувастатина в плазме крови у пациентов на гемодиализе была примерно на 50% выше, чем у здоровых добровольцев.

У пациентов с печеночной недостаточностью, степень которой составляла 8 и 9 по шкале Чайльд-Пью отмечено увеличение  $T_{1/2}$  по крайней мере в 2 раза.

## **Показания к применению:**

Гиперхолестеринемия (тип IIa, включая семейную гетерозиготную гиперхолестеринемию) или смешанная гиперхолестеринемия (тип IIb) в качестве дополнения к диете, когда диета и другие немедикаментозные методы лечения (например, физические упражнения, снижение массы тела) оказываются недостаточными.

Семейная гомозиготная гиперхолестеринемия в качестве дополнения к диете и другой холестеринснижающей терапии или в случаях, когда подобная терапия не подходит пациенту.

## **Относится к болезням:**

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

## **Противопоказания:**

Заболевания печени в активной фазе (включая стойкое повышение активности печеночных трансаминаз или любое повышение активности трансаминаз более чем в 3 раза по сравнению с ВГН), выраженные нарушения функции почек ( $КК < 30$  мл/мин), миопатия, одновременный прием циклоспорина, беременность, лактация (грудное вскармливание), женщины репродуктивного возраста, не пользующиеся адекватными методами контрацепции, детский и подростковый возраст до 18 лет (т.к. эффективность и безопасность не установлены), повышенная чувствительность к розувастатину.

## **Способ применения и дозы:**

Принимают внутрь. Рекомендуемая начальная доза составляет 10 мг 1 раз/сут. При необходимости доза может быть повышена до 20 мг через 4 недели. Повышение дозы до 40 мг возможно только у пациентов с тяжелой гиперхолестеринемией и высоким риском сердечно-сосудистых осложнений (особенно у пациентов с семейной гиперхолестеринемией) при недостаточной эффективности в дозе 20 мг и при условии контроля врача.

## Побочное действие:

*Со стороны ЦНС:* часто - головная боль, головокружение, астенический синдром; возможно - тревожность, депрессия, бессонница, невралгия, парестезии.

*Со стороны пищеварительной системы:* часто - запор, тошнота, абдоминальная боль; возможны - обратимое преходящее дозозависимое повышение активности печеночных трансаминаз, диспепсия (в т.ч. диарея, метеоризм, рвота), гастрит, гастроэнтерит.

*Со стороны дыхательной системы:* часто - фарингит; возможно - ринит, синусит, бронхиальная астма, бронхит, кашель, диспноэ, пневмония.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* возможно - стенокардия, повышение АД, сердцебиение, вазодилатация.

*Со стороны костно-мышечной системы:* часто - миалгия; возможны - артралгия, артрит, мышечный гипертонус, боль в спине, патологический перлом конечности (без повреждений); редко - миопатия, рабдомиолиз (одновременно с нарушением функции почек, на фоне приема препарата в дозе 40 мг).

*Со стороны мочевыделительной системы:* канальцевая протеинурия (в менее 1% случаев - для доз 10 и 20 мг, 3% случаев - для дозы 40 мг); возможно - периферические отеки (рук, ног, лодыжек, голеней), боль внизу живота, инфекции мочевыводящей системы.

*Аллергические реакции:* возможны - кожная сыпь, кожный зуд; редко - ангионевротический отек.

*Со стороны лабораторных показателей:* преходящее дозозависимое повышение активности КФК (при повышении активности КФК более чем в 5 раз по сравнению с ВГН терапия должна быть временно приостановлена).

*Прочие:* часто - астенический синдром; возможно - случайная травма, анемия, боль в грудной клетке, сахарный диабет, экхимозы, гриппоподобный синдром, периодонтальный абсцесс.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Не применять у женщин репродуктивного возраста, не пользующихся надежными методами контрацепции.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении розувастатина и циклоспорина AUC розувастатина была в среднем в 7 раз выше значения, которое отмечалось у здоровых добровольцев, плазменная концентрация циклоспорина при этом не менялась.

Начало терапии розувастатином или повышение дозы препарата у пациентов, получающих одновременно антагонисты витамина К (например, варфарин), может приводить к увеличению протромбинового времени и МНО, а отмена розувастатина или снижение дозы может приводить к уменьшению МНО (в таких случаях рекомендуется мониторинг МНО).

Совместное применение розувастатина и гемфиброзила приводит к увеличению в 2 раза  $C_{max}$  в плазме крови и AUC розувастатина.

Одновременное применение розувастатина и антацидов, содержащих алюминия и магния гидроксид, приводит к снижению плазменной концентрации розувастатина примерно на 50%. Данный эффект выражен слабее, если антациды применяются через 2 ч после приема розувастатина (клиническое значение неизвестно).

Одновременное применение розувастатина и эритромицина приводит к уменьшению AUC розувастатина на 20% и  $C_{max}$  розувастатина на 30% (вероятно, в результате усиления моторики кишечника, вызываемого приемом эритромицина).

Одновременное применение розувастатина и пероральных контрацептивов увеличивает AUC этинилэстрадиола и AUC норгестрела на 26% и 34% соответственно. Нельзя исключить такое взаимодействие при одновременном применении розувастатина и проведении гормонозаместительной терапии.

Гемфиброзил, другие фибраты и гиполипидемические дозы никотиновой кислоты ( $\geq 1$  г/сут) увеличивали риск возникновения миопатии при одновременном применении с другими ингибиторами ГМГ-КоА-редуктазы возможно в связи с тем, что они могут вызывать миопатию и при применении в качестве монотерапии.

Совместное применение розувастатина и итраконазола (ингибитора СYP3A4) увеличивает AUC розувастатина на 28% (клинически незначимо).

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

С осторожностью применять при наличии факторов риска развития рабдомиолиза (включая почечную недостаточность, гипотиреоз, личный или семейный анамнез наследственных мышечных заболеваний и предшествующий анамнез мышечной токсичности при использовании других ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы или фибратов), при хроническом алкоголизме, у пациентов в возрасте старше 65 лет, при заболеваниях печени в анамнезе, сепсисе, артериальной гипотензии, при проведении обширных хирургических вмешательствах, травмах, тяжелых метаболических эндокринных или электролитных нарушениях, при неконтролируемой эпилепсии, у лиц азиатского происхождения (китайцы, японцы).

Терапию следует прекратить, если уровень КФК значительно увеличен (более чем в 5 раз по сравнению с ВГН) или если мышечные симптомы резко выражены и вызывают ежедневный дискомфорт (даже если уровень КФК в 5 раз меньше по сравнению с ВГН).

При применении розувастатина в дозе 40 мг рекомендуется контролировать показатели функции почек.

В большинстве случаев протеинурия уменьшается или исчезает в процессе терапии и не означает возникновения острого или прогрессирования существующего заболевания почек.

Сообщалось об увеличении числа случаев миозита и миопатии у пациентов, принимавших другие ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы в сочетании с производными фибриновой кислоты (включая гемфиброзил), циклоспорин, никотиновую кислоту, азольные противогрибковые препараты, ингибиторы протеаз и макролидные антибиотики. Гемфиброзил повышает риск возникновения миопатии при сочетании с некоторыми ингибиторами ГМГ-КоА-редуктазы. Таким образом, не рекомендуется одновременное назначение розувастатина и гемфиброзила. Следует тщательно взвесить соотношение риска и возможной пользы при совместном применении розувастатина и фибратов или ниацина.

Рекомендуется проводить определение показателей функции печени до начала терапии и через 3 мес после начала терапии. Применение розувастатина следует прекратить или уменьшить дозу, если уровень активности трансаминаз в сыворотке крови в 3 раза превышает ВГН.

У пациентов с гиперхолестеринемией вследствие гипотиреоза или нефротического синдрома терапию основных заболеваний следует проводить до начала лечения розувастатином.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

При занятии потенциально опасными видами деятельности пациенты должны учитывать, что во время терапии может возникать головокружение.

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