Симвалимит

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе - белого цвета.

	1 таб.
симвастатин	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 55.95 мг, крахмал кукурузный 24.47 мг, целлюлоза микрокристаллическая 42.91 мг, метилцеллюлоза 1.25 мг, магния стеарат 1.4 мг, бутилгидроксианизол 0.02 мг, аскорбиновая кислота 2.5 мг, лимонной кислоты моногидрат 1.5 мг.

Состав пленочной оболочки: 33G28707 Опадрай белый (гипромеллоза 40%, лактозы моногидрат 24%, макрогол 3000 22%, титана диоксид (Е171) 8%, триацетин 6%) - 5.6 мг, карнаубский воск.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-розового цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе видны два слоя.

	1 таб.
симвастатин	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 111.9 мг, крахмал кукурузный 48.94 мг, целлюлоза микрокристаллическая 85.82 мг, метилцеллюлоза 2.5 мг, магния стеарат 2.8 мг, бутилгидроксианизол 0.04 мг, аскорбиновая кислота 5 мг, лимонной кислоты моногидрат 3 мг, воск карнаубский.

Состав пленочной оболочки: 85F 24678 Опадрай розовый (поливиниловый спирт частично гидролизированный 40%, титана диоксид (Е171) 24.93%, макрогол 3000 20.2%, тальк 14.8%, железа оксид черный (Е172) 0.02%, железа оксид желтый (Е172) 0.01%, кармоизин (азорубин) (Е122) 0.04%) - 11.2 мг, карнаубский воск.

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гиполипидемический препарат из группы статинов, получаемый синтетическим путем из продукта ферментации Aspergillus terreus, является неактивным лактоном, в организме подвергается гидролизу с образованием гидроксикислотного производного. Активный метаболит ингибирует ГМГ-КоА-редуктазу, фермент, катализирующий начальную реакцию образования мевалоната из ГМГ-КоА. Поскольку превращение ГМГ-КоА в мевалонат представляет собой ранний этап синтеза холестерина, то применение симвастатина не вызывает накопления в организме потенциально токсичных стеролов. ГМГ-КоА легко метаболизируется до ацетил-ГМГ-КоА, который участвует во многих процессах синтеза в организме.

Симвастатин вызывает снижение уровня ТГ, ЛПНП, ЛПОНП и общего холестерина в плазме (в случаях гетерозиготной семейной и несемейной форм гиперхолестеринемии, при смешанной гиперлипидемии, когда повышенное содержание холестерина является фактором риска. Повышает содержание ЛПВП и уменьшает соотношение ЛПНП/ЛПВП и общий холестерин/ЛПВП.

Начало проявления эффекта - через 2 недели от начала приема, максимальный терапевтический эффект - через 4-6 недель. Действие сохраняется при продолжении лечения; при прекращении терапии содержание холестерина возвращается к исходному уровню (до начала лечения).

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь абсорбция симвастатина высокая. C_{max} в плазме крови достигается через 1.3-2.4 ч после приема и снижается на 90% через 12 ч.

Распределение

Связывание с белками плазы - 95%. Симвастатин и его бета-гидроксикислотный метаболит связаны с протеинами плазмы в большом соотношении (примерно 95%).

Метаболизм

Симвастатин метаболизируется в печени, подвергается эффекту первого прохождения через печень (в основном гидролизуется в свою бета-гидроксиксилоту; обнаружены и другие активные, а также неактивные метаболиты).

Выведение

$T_{1/2}$ активных метаболитов составляет 1.9 ч. В основном выводится с калом (60%) в виде метаболитов. Около 10-15% выводится почками в неактивной форме.

Показания к применению:

— первичная гиперхолестеринемия IIa и IIb типа (при неэффективности диетотерапии у пациентов с повышенным риском возникновения коронарного атеросклероза), комбинированная гиперхолестеринемия и гипертриглицеридемия, гиперлипопротеинемия, не поддающаяся коррекции специальной диетой и физической нагрузкой;

— профилактика инфаркта миокарда (для замедления прогрессирования коронарного атеросклероза), инсульт и преходящие нарушения мозгового кровообращения.

Относится к болезням:

- Атеросклероз
- Гипертриглицеридемия
- Гиперхолестеринемия
- Инсульт
- Липома
- Миокардит
- Нарушение мозгового кровообращения
- Холера

Противопоказания:

— печеночная недостаточность;

— острые заболевания печени (в активной форме);

— стойкое повышение активности печеночных трансаминаз неясной этиологии;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность другим препаратам статинового ряда (ингибиторам ГМГ-КоА-редуктазы в

анамнезе).

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам с хроническим алкоголизмом и/или имеющим в анамнезе заболевания печени, пациентам после трансплантации органов, которым проводится терапия иммунодепрессантами (в связи с повышенным риском возникновения рабдомиолиза и почечной недостаточности); при состояниях, которые могут привести к возникновению почечной недостаточности тяжелой степени, таких как артериальная гипертензия, острые инфекционные заболевания тяжелого течения, тяжелые метаболические и эндокринные нарушения, нарушения водно-электролитного баланса, хирургические вмешательства или травмы; при эпилепсии.

Способ применения и дозы:

Назначают внутрь 1 раз/сут, вечером.

При *легкой или умеренной гиперхолестеринемии* начальная доза составляет 5 мг; при выраженной гиперхолестеринемии - в начальной дозе 10 мг/сут. При необходимости дозу можно увеличить не ранее чем через 4 недели. Максимальная суточная доза составляет 80 мг.

При *ИБС* рекомендуемая начальная доза составляет 20 мг (1 раз/сут. вечером); при необходимости дозу постепенно повышают через каждые 4 недели до 40 мг. Если содержание ЛПНП не менее 75 мг/дл (1.94 ммоль/л), а содержание общего холестерина - менее 140 мг/дл (3.6 ммоль/л), дозу препарата необходимо уменьшить.

У **пациентов с хронической почечной недостаточностью (КК < 30 мл/мин), или получающих циклоспорин, фибраты, никотинамид,** начальная доза составляет 5 мг, максимальная суточная доза - 10 мг.

На **фоне иммунодепрессивной терапии** рекомендуемая начальная доза составляет 5 мг/сут, максимальная суточная доза составляет 5 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: диспепсия (тошнота, рвота, гастралгия, боли в животе, запор или диарея, метеоризм), гепатит, желтуха, возможно выраженное и устойчивое повышение активности печеночных трансаминаз, ЩФ, КФК, острый панкреатит.

Со стороны нервной системы и органов чувств: астенический синдром, головокружение, головная боль, бессонница, судороги, парестезии, периферическая невропатия, расплывчатость зрения, нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны костно-мышечной системы: миопатия, миалгия, мышечная слабость, рабдомиолиз.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, волчаночноподобный синдром, ревматическая полимиалгия, васкулит, тромбоцитопения, фотосенсибилизация, лихорадка, гиперемия кожи, приливы крови к лицу, одышка.

Дерматологические реакции: кожная сыпь, зуд, алопеция.

Прочие: анемия, сердцебиение, острая почечная недостаточность (вследствие рабдомиолиза), снижение потенции.

Передозировка:

Симптомы: возможно усиление побочного действия.

Лечение: необходимо вызвать рвоту, назначить активированный уголь. Проведение симптоматической терапии. Следует контролировать функции печени и почек, активность КФК в сыворотке крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Отмена гиполипидемических средств при беременности не оказывает существенного влияния на результаты длительного лечения первичной гиперхолестеринемии. В связи с тем, что ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы тормозят синтез холестерина, а холестерин и продукты его синтеза играют существенную роль в развитии плода, включая синтез стероидов и клеточных мембран, симвастатин при назначении беременным оказывает неблагоприятное воздействие на плод.

Женщины репродуктивного возраста должны избегать зачатия.

Если в процессе лечения возникает беременность, препарат следует отменить. Пациентку необходимо предупредить о возможной опасности для плода.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Симвалимит усиливает действие непрямых антикоагулянтов и повышает риск развития кровотечений.

Цитостатики, противогрибковые препараты (кетоконазол, итраконазол), фибраты, никотиновая кислота в высоких дозах, иммунодепрессанты, эритромицин, кларитромицин, ингибиторы протеаз повышают риск развития рабдомиолиза.

Симвастатин способствует повышению концентрации дигоксина в плазме крови.

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

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом и во время лечения необходимо проводить исследование функции печени: контролировать активность печеночных трансаминаз каждые 6 недель в течение первых 3 месяцев, затем каждые 8 недель в течение оставшегося первого года, и затем - 1 раз в 6 месяцев). У пациентов, получающих Симвалимит в суточной дозе 80 мг, функцию печени контролируют 1 раз в 3 месяца. В тех случаях, когда содержание трансаминаз нарастает (превышение в 3 раза выше ВГН), лечение отменяют. У пациентов с миалгией, миастенией и/или выраженным повышением активности КФК лечение препаратом прекращают. Симвалимит не следует применять при повышенном риске развития рабдомиолиза и почечной недостаточности (на фоне тяжелой острой инфекции, артериальной гипертензии, планируемой большой хирургической операции, травм, тяжелых метаболических нарушений).

Симвастатин не показан в случаях, когда имеется гипертриглицеридемия I, IV и V типов. Препарат эффективен как в виде монотерапии, так и в сочетании с секвестрантами желчных кислот.

До начала и во время курса лечения пациент должен находиться на гипохолестериновой диете.

В случае пропуска очередной дозы препарат необходимо принять как можно скорее. Если наступило время следующего приема, то дозу не следует удваивать.

У пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени лечение проводят под контролем функции почек.

Пациентам рекомендуется немедленно сообщать о необъяснимых болях в мышцах, вялости или слабости, особенно если это сопровождается недомоганием и лихорадкой.

При необходимости назначения препарат пациентам с непереносимостью лактозы следует иметь в виду, что 1 таблетка Симвалимита 10 мг содержит 55.95 мг, а в 1 таблетке 20 мг - содержится 111.9 мг лактозы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не выявлено.

При нарушениях функции почек

Симвалимит не следует применять при повышенном риске развития рабдомиолиза и почечной недостаточности (на фоне тяжелой острой инфекции, артериальной гипертензии, планируемой большой хирургической операции, травм, тяжелых метаболических нарушений). У **пациентов с хронической почечной недостаточностью (КК < 30 мл/мин)** начальная доза составляет 5 мг, максимальная суточная доза - 10 мг. У пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени лечение проводят под контролем функции почек.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при печеночной недостаточности, острых заболевания печени (в активной форме), при стойком повышении активности печеночных трансаминаз неясной этиологии.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям и подросткам до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом темном месте при температуре не выше 25°С.

Условия отпуска из аптек

Препарат отпускается по рецепту.

Срок годности:

2 года.

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