Симвастатин-Чайкафарма



Код АТХ:

- C10AA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Симвастатин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой персикового цвета, овальные, с риской на одной стороне.

	1 таб.
симвастатин	10 мг

Вспомогательные вещества: лактоза - 70.726 мг, крахмал кукурузный - 10 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 5 мг, бутилгидроксианизол - 0.024 мг, аскорбиновая кислота - 2.5 мг, лимонная кислота - 1.25 мг, магния стеарат - 0.5 мг, гидроксипропилметилцеллюлоза - 0.764 мг, гидроксипропилцеллюлоза - 0.764 мг, титана диоксид (E171) - 0.694 мг, тальк - 0.2727 мг, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.0015 мг, краситель железа оксид красный (E172) - 0.0038 мг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, овальные, с риской на одной стороне.

	1 таб.
симвастатин	20 мг

Вспомогательные вещества: лактоза - 141.452 мг, крахмал кукурузный - 20 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10 мг, бутилгидроксианизол - 0.048 мг, аскорбиновая кислота - 5 мг, лимонная кислота - 2.5 мг, магния стеарат - 1 мг, гидроксипропилметилцеллюлоза - 1.527 мг, гидроксипропилцеллюлоза - 1.527 мг, титана диоксид (E171) - 1.388 мг, тальк - 0.536 мг, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.0022 мг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой темно-розового цвета, круглые, плоскоцилиндрические.

	1 таб.
симвастатин	40 мг

Вспомогательные вещества: лактоза - 282.904 мг, крахмал кукурузный - 40 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 20 мг, бутилгидроксианизол - 0.096 мг, аскорбиновая кислота - 10 мг, лимонная кислота - 5 мг, магния стеарат - 2 мг, гидроксипропилметилцеллюлоза - 3.05 мг, гидроксипропилцеллюлоза - 3.05 мг, титана диоксид (E171) - 2.78 мг, тальк - 1 мг, краситель железа оксид красный (E172) - 0.12 мг.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гиполипидемическое средство, получаемое синтетическим путем из продукта ферментации Aspergillus terreus, является неактивным лактоном, в организме подвергается гидролизу с образованием гидроксикислотного производного. Активный метаболит ингибирует 3-гидрокси-3-метил-глутарил-КоА-редуктазу (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-КоА, который участвует во многих процессах синтеза в организме.

Симвастатин вызывает снижение концентрации в плазме крови триглицеридов (ТГ), липопротеинов низкой плотности (ЛПНП), липопротеинов очень низкой плотности (ЛПОНП) и общего холестерина (в случаях гетерозиготной семейной и несемейной форм гиперхолестеринемии, при смешанной гиперлипидемии, когда повышенная концентрация холестерина является фактором риска развития сердечно-сосудистых заболеваний).

Повышает концентрацию липопротеинов высокой плотности (ЛПВП) и уменьшает соотношение ЛПНП/ЛПВП и общий холестерин/ЛПВП. Начало проявления эффекта - через 2 недели от начала приема, максимальный терапевтический эффект достигается через 4-6 недель. Действие сохраняется при продолжении лечения, при прекращении терапии концентрация холестерина постепенно возвращается к исходному значению.

Фармакокинетика

Всасывание: после приема внутрь симвастатин абсорбируется из ЖКТ - около 61-85 % и попадает в системный кровоток. C_{max} в плазме крови достигается через 1.3 - 2.4 ч и снижается на 90 % через 12 ч. Одновременный прием пищи не влияет на всасывание симвастатина.

Распределение: связь с белками плазмы крови составляет около 98%.

Метаболизм: симвастатин подвергается эффекту "первичного прохождения" через печень (в основном гидролизуется в свою активную форму бета-гидрокислоту). В метаболизме препарата участвуют изоферменты CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7. $T_{1/2}$ активных метаболитов составляет 1.9 ч. Концентрация активного метаболита симвастатина в системном кровотоке составляет 5% от принятой дозы.

Выведение: $T_{1/2}$ активных метаболитов составляет 1.9 ч. Выводится преимущественно через кишечник (около 60%) в виде метаболитов. Около 10-15% выводится почками в неактивной форме.

Возможность проникновения симвастатина через гематоэнцефалический барьер и гематоплацентарный барьер не изучена.

Показания к применению:

— первичная гиперхолестеринемия (тип IIa и IIb по Фредриксону) при неэффективности диетотерапии с низким содержанием холестерина и других немедикаментозных мероприятий (физическая нагрузка и снижение массы тела у пациентов с повышенным риском возникновения коронарного атеросклероза);

— комбинированная гиперхолестеринемия и гипертриглицеридемия; гиперлипопротеинемия, не поддающаяся коррекции специальной диетой и физической нагрузкой;

— гомозиготная наследственная гиперхолестеринемия (в качестве дополнения к гиполипидемической терапии);

— ишемическая болезнь сердца (вторичная профилактика): препарат показан пациентам с целью снижения общей смертности; с целью уменьшения риска коронарной смертности и профилактики инфаркта миокарда; с целью снижения риска развития инсульта и преходящих нарушений мозгового кровообращения; с целью замедления прогрессирования коронарного атеросклероза.

Относится к болезням:

- Атеросклероз
- Гипертриглицеридемия
- Гиперхолестеринемия

- Инсульт
- Ишемическая болезнь сердца
- Липома
- Миокардит
- Нарушение мозгового кровообращения
- Холера

Противопоказания:

— заболевания печени в активной фазе или стойкое повышение активности "печеночных" трансаминаз неясной этиологии;

— заболевания скелетной мускулатуры (миопатия);

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

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции;

— одновременное применение с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 (итраконазол, кетоконазол, позаконозол, ингибиторами ВИЧ-протеазы, эритромицин, кларитромицин, телитромицин и нефазодон);

— одновременное применение с гемфиброзолом, циклоспорином или даназолом;

— повышенная чувствительность к симвастатину или к другим компонентам препарата, а также другим препаратам статинового ряда (ингибиторам ГМГ-КоА-редуктазы) в анамнезе.

С осторожностью: больным алкоголизмом, пациентам с заболеваниями печени в анамнезе, пациентам после трансплантации органов, которым проводится терапия иммунодепрессантами (в связи с повышенным риском возникновения рабдомиолиза и почечной недостаточности); при состояниях, которые могут привести к развитию выраженной недостаточности функции почек, таких как артериальная гипотензия, острые инфекционные заболевания тяжелого течения, выраженные метаболические и эндокринные нарушения, нарушения водно-электролитного баланса, хирургические вмешательства (в том числе стоматологические) или травмы; пациентам с пониженным или повышенным тонусом скелетных мышц неясной этиологии; эпилепсия, неконтролируемые судороги; одновременный прием с фибратами (кроме гемфиброзила), никотиновой кислотой в липидснижающих дозах (более 1 г/сут), амиодароном, верапамилом, дилтиаземом, грейпфрутовым соком; выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин).

Способ применения и дозы:

До начала лечения Симвастатином-Чайкафарма пациенту следует назначить стандартную гипохолестериновую диету, которая должна соблюдаться в течение всего курса лечения.

Симвастатин-Чайкафарма принимают внутрь 1 раз в сутки вечером, запивая достаточным количеством воды. Время приема препарата не следует связывать с приемом пищи.

Рекомендуемые дозы для лечения гиперхолестеринемии составляют - от 5 до 80 мг, препарат следует принимать однократно, в вечернее время. При подборе дозы препарата Симвастатин-Чайкафарма ее изменение следует производить с интервалами не менее чем в 4 недели. Рекомендуемая начальная доза для пациентов с выраженной гиперхолестеринемией составляет 10 мг. У большинства больных оптимальный эффект достигается при приеме препарата в дозе 20 мг в сутки. Максимальная суточная доза - 80 мг.

Препарат в дозе 80 мг должен назначаться только тем пациентам, которые не достигли желаемого результата по уровню ЛПНП при приеме дозы 40 мг.

У больных с гомозиготной наследственной гиперхолестеринемией рекомендуемая суточная доза составляет 40 мг 1 раз в сутки вечером или 80 мг в три приема (20 мг утром, 20 мг днем и 40 мг вечером). Дозу 80 мг рекомендуется назначать только в случае, если предполагаемая польза терапии превышает возможный риск.

При лечении больных с ишемической болезнью сердца (ИБС) или высоким риском развития ИБС препарат назначают в начальной дозе 20 мг в сутки вечером; при необходимости дозу постепенно увеличивают через каждые 4 недели до 40 мг. У больных пожилого возраста и у больных с легкой или умеренно выраженной степенью почечной недостаточностью изменений дозы препарата не требуется. Для больных с хронической почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 30 мл/мин) или принимающих фибраты (кроме фенофибрата и гемфиброзила), никотиновую кислоту в липидснижающих дозах (>1 г/сутки) одновременно с Симвастатином-Чайкафарма, максимально рекомендуемая доза Симвастатина-Чайкафарма не должна превышать 10 мг в сутки. Для пациентов, принимающих амиодарон или верапамил одновременно с препаратом Симвастатин-Чайкафарма, суточная доза не должна превышать 20 мг, а для пациентов, принимающих дилтиазем одновременно с препаратом Симвастатин-Чайкафарма, суточная доза препарата Симвастатин-Чайкафарма не должна превышать 40 мг.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: диспепсия (тошнота, рвота, гастралгия, абдоминальные боли, запор или диарея, метеоризм), гепатит, холестатическая желтуха, нарушение функции печени, повышение активности "печеночных" трансаминаз, щелочной фосфатазы и креатинфосфокиназы КФК); острый панкреатит.

Со стороны центральной нервной системы и органов чувств: астения, головокружение, головная боль, нарушение памяти, бессонница, парестезии, периферическая невропатия, нечеткость зрительного восприятия, нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: миопатия, миалгия, миастения; рабдомиолиз.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, алопеция, ангионевротический отек, волчаночноподобный синдром, ревматическая полимиалгия, васкулит, тромбоцитопения, эозинофилия, увеличение СОЭ, артрит, артралгия, фотосенсибилизация, лихорадка, гиперемия кожи, "приливы" крови к коже лица, одышка.

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

Передозировка:

Ни в одном из известных нескольких случаев передозировки (максимально принятая доза 450 мг) специфических симптомов выявлено не было.

Лечение: вызвать рвоту, принять активированный уголь, симптоматическая терапия. Следует контролировать функции печени и почек, активность КФК в сыворотке крови.

При развитии миопатии с рабдомиолизом и острой почечной недостаточности (редкий, но тяжелый побочный эффект) следует немедленно прекратить прием препарата и ввести больному диуретик и раствор натрия гидрокарбоната (внутривенная инфузия). При необходимости показан гемодиализ. Рабдомиолиз может вызывать гиперкалиемию, которую можно устранить внутривенным введением кальция хлорида или кальция глюконата, инфузией 5% раствора декстрозы (глюкозы) с инсулином короткого действия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Симвастатин-Чайкафарма противопоказан и не должен назначаться беременным, а также женщинам, у которых беременность предполагается или планируется. Так как безопасность для беременных не доказана, и нет данных, что лечение Симвастатином-Чайкафарма во время беременности принесет большую пользу, чем риск для плода, прием препарата следует немедленно прекратить при диагностировании беременности. Если в процессе лечения Симвастатином-Чайкафарма диагностирована беременность, препарат должен быть отменен, а сама женщина предупреждена о возможной опасности для плода (см. раздел противопоказания).

Данных о выделении симвастатина в грудное молоко нет, но поскольку небольшое количество других лекарственных препаратов данного класса выделяется в грудное молоко, женщинам, принимающим Симвастатин-Чайкафарма, не рекомендуется кормление грудью в связи с возможностью развития серьезных нежелательных реакций у детей.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Цитостатики, противогрибковые средства (кетоконазол, итраконазол), фибраты, высокие дозы никотиновой кислоты, иммунодепрессанты, эритромицин, кларитромицин, телитромицин, ингибиторы ВИЧ-протеазы, нефазодон повышают риск развития миопатии/рабдомиолиза.

При совместном применении циклоспорина или даназола повышается риск развития миопатии/рабдомиолиза. При одновременном применении амлодипина с симвастатином в дозе 80 мг имеется незначительно повышенный риск развития миопатии. Увеличивает риск развития миопатии одновременное применение других гиполипидемических средств, которые не являются мощными ингибиторами изофермента CYP3A4, но способны вызывать миопатию в условиях монотерапии, такие как гемфиброзил и другие фибраты (кроме фенофибрата), а также никотиновая кислота в липиднижающих дозах (более 1 г в сутки).

Риск развития миопатии увеличивается при одновременном применении амиодарона или верапамила с высокими дозами симвастатина. Риск развития миопатии незначительно увеличивается у пациентов, получающих дилтиазем одновременно с симвастатином в дозе 80 мг.

Симвастатин потенцирует действие непрямых антикоагулянтов (например, фенпрокумон, варфарин) и увеличивает риск возникновения кровотечений, что требует проведения контроля показателей свертываемости крови до начала лечения, а также достаточно часто в начальный период терапии. Как только достигается стабильный уровень

показателя протромбинового времени или международного нормализованного отношения (МНО), их дальнейших контроль следует проводить с интервалами, рекомендуемыми для пациентов, получающих терапию непрямыми антикоагулянтами. При изменении дозы или прекращении приема симвастатина также следует проводить контроль протромбинового времени или МНО по вышеизложенной схеме. Терапия симвастатином не вызывает изменений протромбинового времени и риска кровотечений у пациентов, не принимающих непрямые антикоагулянты. Симвастатин повышает концентрацию дитоксина в плазме крови.

Колестирамин и колестипол снижают биодоступность (применение Симвастатина-Чайкафарма возможно через 4 ч после приема указанных лекарственных препаратов, при этом отмечается аддитивный эффект). Сок грейпфрута содержит один или более компонентов, которые ингибируют изофермент CYP3A4 и могут повышать концентрацию в плазме крови средств, метаболизирующихся с участием изофермента CYP3A4. Увеличение активности ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы после употребления 250 мл сока в день является минимальным и не имеет клинического значения. Однако потребление большого объема сока (более 1 литра в день) при приеме симвастатина значительно увеличивает ингибирующую активность в отношении ГМГ-КоА-редуктазы в плазме крови. В связи с этим необходимо избегать потребления сока грейпфрута в больших количествах.

При одновременном применении симвастатина с фузидовой кислотой повышается риск развития миопатии.

При одновременном применении колхицина и симвастатина у пациентов с нарушением функции почек описаны случаи миопатии и рабдомиолиза (необходим контроль состояния пациентов).

Особые указания и меры предосторожности:

В начале терапии Симвастатином-Чайкафарма возможно преходящее повышение активности "печеночных" трансаминаз.

Симвастатин-Чайкафарма эффективен как в 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 текущей дозы препарат необходимо принять как можно скорее. Если наступило время приема следующей дозы, дозу не удваивать. Длительность применения препарата определяется врачом индивидуально. Перед началом терапии и далее регулярно проводить исследование функции печени (контролировать активность "печеночных" трансаминаз каждые 6 недель в течение первых 3 месяцев, далее каждые 8 недель в течение оставшегося первого года и затем 1 раз в полгода), а также при повышении доз следует проводить тест на определение функции печени.

Пациентам, получающим Симвастатин-Чайкафарма в суточной дозе 80 мг, функцию печени контролируют 1 раз в 3 месяца. В тех случаях, когда активность "печеночных" трансаминаз нарастает (превышение в 3 раза верхней границы нормы), терапию отменяют.

У больных с миалгией, миастенией и/или с выраженным повышением активности КФК лечение препаратом прекращают.

Среди предрасполагающих факторов для развития миопатии выделяют пожилой возраст (старше 65 лет), принадлежность к женскому полу, неконтролируемый гипотиреоз и почечную недостаточность.

У пациентов со сниженной функцией щитовидной железы (гипотиреоз) или при наличии некоторых заболеваний почек (нефротический синдром) при повышении концентрации холестерина следует сначала проводить терапию основного заболевания.

Симвастатин-Чайкафарма, как и другие ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы, не следует применять при повышенном риске возникновения рабдомиолиза и почечной недостаточности (вследствие тяжелой острой инфекции, артериальной гипотензии, травмы, планируемой большой хирургической операции, тяжелых метаболических нарушений).

Все пациенты, начинающие терапию препаратом Симвастатин-Чайкафарма, а также пациенты, которым необходимо увеличить дозу препарата, должны быть предупреждены о возможности возникновения миопатии и необходимости незамедлительного обращения к врачу в случае возникновения необъяснимых болей, болезненности в мышцах, вялости или миастении, особенно если это сопровождается недомоганием или лихорадкой. Терапия препаратом должна быть немедленно прекращена, если миопатия диагностирована или предполагается

В целях диагностирования развития миопатии рекомендуется регулярно проводить измерение активности КФК.

При лечении препаратом Симвастатин-Чайкафарма возможно повышение активности КФК в сыворотке крови, что следует учитывать при дифференциальной диагностике болей за грудиной. Критерием отмены препарата служит увеличение активности КФК в сыворотке крови более чем в 10 раз относительно верхних границ нормы. У больных с миалгией, миастенией и/или выраженным повышением активности КФК на фоне лечения прием препарата прекращают.

Риск миопатии и рабдомиолиза значительно возрастает при одновременном применении симвастатина и мощных

ингибиторов изофермента CYP3A4 (например, итраконазола, кетоконазола, эритромицина, кларитромицина, телитромицина, ингибиторов ВИЧ-протеазы, нефазодона), что свидетельствует о противопоказании их совместного применения.

Риск миопатии и рабдомиолиза также увеличивается при совместном применении фибратов, циклоспорина и никотиновой кислоты в липидснижающих дозах (более 1 г/сут), а также амиодарона и верапамила с высокими дозами препарата Симвастатин-Чайкафарма (выше 20 мг/сут). У пациентов, получавших дилтиазем одновременно с препаратом Симвастатин-Чайкафарма в дозе 80 мг, риск развития миопатии увеличивался.

Применение препарата Симвастатин-Чайкафарма не рекомендуется у женщин детородного возраста, не использующих надежные средства контрацепции. Отмена гиполипидемических средств во время беременности не оказывает существенного влияния на результаты длительного лечения первичной гиперхолестеринемии.

Одновременный прием грейпфрутового сока может усилить степень выраженности побочных явлений, связанных с приемом препарата, поэтому следует избегать одновременного приема.

Данные современных длительных клинических исследований не содержат информации относительно неблагоприятного воздействия симвастатина на хрусталик глаза человека.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

О неблагоприятном влиянии препарата на способность управлять транспортными средствами и занятии другими видами деятельности, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, не сообщалось. Однако, учитывая то, что препарат может вызывать головокружение, нечеткость зрительного восприятия, следует соблюдать осторожность при осуществлении данных видов деятельности.

При нарушениях функции почек

С осторожностью: выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказан при заболеваниях печени в активной фазе или стойком повышении активности "печеночных" трансаминаз неясной этиологии.

С осторожностью: заболевания печени в анамнезе.

Всем пациентам перед началом терапии и далее необходимо регулярно проводить исследование функции печени (контролировать активность "печеночных" трансаминаз каждые 6 недель в течение первых 3 месяцев, далее каждые 8 недель в течение оставшегося первого года и затем 1 раз в полгода), а также при повышении доз следует проводить тест на определение функции печени.

Пациентам, получающим Симвастатин-Чайкафарма в суточной дозе 80 мг, функцию печени контролируют 1 раз в 3 месяца. В тех случаях, когда активность "печеночных" трансаминаз нарастает (превышение в 3 раза верхней границы нормы), терапию отменяют.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

При температуре не выше 25°C в сухом и защищенном от света месте. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Simvastatin-Chaykafarma