Тг-Тор



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с надписью "10" на одной стороне.

	1 таб.
аторвастатин	10 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, магния стеарат, натрия крахмала гликолат, повидон, натрия лаурилсульфат, гипромеллоза, полиэтиленгликоль 400, титана диоксид, тальк очищенный.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой светло-желтого цвета, овальные, двояковыпуклые, с надписью "20" на одной стороне.

	1 таб.
аторвастатин	20 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, магния стеарат, натрия крахмала гликолат, повидон, натрия лаурилсульфат, гипромеллоза, полиэтиленгликоль 400, титана диоксид, тальк очищенный, краситель хинолин желтый.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гиполипидемический препарат из группы статинов. Основным механизмом действия аторвастатина является ингибирование активности ГМГ-КоА-редуктазы, фермента, катализирующего превращение ГМГ-КоА в мевалоновую кислоту. Это превращение является одним из ранних этапов в цепи синтеза холестерина в организме. Подавление аторвастатином синтеза холестерина приводит к повышенной реактивности рецепторов ЛПНП в печени, а также во внепеченочных тканях. Эти рецепторы связывают частицы ЛПНП и удаляют их из плазмы крови, что приводит к снижению Хс-ЛПНП.

Антиатеросклеротический эффект аторвастатина является следствием воздействия препарата на стенки сосудов и компоненты крови. Препарат подавляет синтез изопреноидов, являющихся факторами роста клеток внутренней оболочки сосудов. Под действием аторвастатина улучшается эндотелий-зависимое расширение кровеносных сосудов. Аторвастатин снижает содержание холестерина, ЛПНП, аполипопротеина В, триглицеридов. Вызывает повышение содержания Хс-ЛПВП и аполипопротеина А.

Действие препарата, как правило, развивается через 2 недели приема, а максимальный эффект достигается через 4 недели.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь абсорбция препарата высокая. Время достижения C_{max} в плазме крови - 1-2 ч.

Пища несколько снижает скорость и длительность абсорбции аторвастатина (на 25% и 9% соответственно), однако снижение уровня Хс-ЛПНП сходно с таковым при применении аторвастатина без пищи. Выявлена линейная зависимость между степенью всасывания и дозой препарата.

Биодоступность составляет 14%, системная биодоступность ингибирующей активности в отношении ГМГ-КоА-редуктазы – 30%. Низкая системная биодоступность обусловлена пресистемным метаболизмом в слизистой оболочке ЖКТ при “первом прохождении” через печень.

Распределение

Связывание с белками плазмы – 98%.

Средний V_d составляет 381 л.

Метаболизм

Метаболизируется преимущественно в печени при участии изоферментов CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7 с образованием фармакологически активных метаболитов (орто- и парагидроксилированных производных, продуктов β-окисления). Ингибирующий эффект препарата в отношении ГМГ-КоА-редуктазы примерно на 70% определяется активностью циркулирующих метаболитов и сохраняется около 20-30 ч.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет 14 ч.

Выводится с желчью после печеночного и/или внепеченочного метаболизма (не подвергается выраженной кишечно-печеночной рециркуляции).

Менее 2% принятой внутрь дозы определяется в моче.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

C_{max} у женщин выше на 20%, AUC ниже на 10%, C_{max} у пациентов с алкогольным циррозом печени в 16 раз выше, AUC в 11 раз выше, чем у пациентов с нормальной функцией печени.

Концентрация аторвастатина при применении в вечернее время ниже, чем в утреннее, приблизительно на 30%.

Аторвастатин не выводится во время гемодиализа.

Показания к применению:

— первичная гиперхолестеринемия;

— смешанная гиперлипидемия;

— гетерозиготная и гомозиготная семейная гиперхолестеринемия (в качестве дополнения к диетотерапии).

Относится к болезням:

- Гиперхолестеринемия
- Холера

Противопоказания:

— заболевания печени в активной фазе (в т.ч. активный хронический гепатит, хронический алкогольный гепатит);

— повышение активности печеночных трансаминаз (более чем в 3 раза по сравнению с верхней границей нормы /ВГН/) неясного генеза;

— печеночная недостаточность;

— цирроз печени различной этиологии;

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

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при заболеваниях печени в анамнезе, тяжелых нарушениях электролитного баланса, эндокринных и метаболических нарушениях, хроническом алкоголизме, артериальной гипотензии, тяжелых острых инфекциях (сепсис), неконтролируемых судорогах, обширных хирургических вмешательствах, при травме.

Способ применения и дозы:

До начала лечения ТГ-тором пациента следует перевести на диету, обеспечивающую снижение содержания липидов в крови, которую необходимо соблюдать в процессе лечения.

Препарат назначают внутрь в одно и то же время дня, независимо от приема пищи.

Рекомендуемая начальная доза – 10 мг 1 раз/сут. Далее дозу подбирают индивидуально в зависимости от содержания Хс-ЛПНП. Изменять дозу следует с интервалом не менее 4 недель. Максимальная суточная доза – 80 мг в 1 прием.

При *первичной (гетерозиготной семейной и полигенной) гиперхолестеринемии (тип IIa) и смешанной гиперлипидемии (тип IIb)* лечение начинают с рекомендуемой начальной дозы, которую повышают через 4 недели терапии в зависимости от клинической эффективности. Максимальная суточная доза составляет 80 мг.

При *гомозиготной семейной гиперхолестеринемии* диапазон доз такой же, как и при других типах гиперлипидемии. Начальную дозу устанавливают индивидуально в зависимости от выраженности заболевания. В большинстве случаев оптимальный эффект наблюдается при применении ТГ-тора в дозе 80 мг 1 раз/сут.

У **пациентов с нарушениями функции печени** препарат следует применять с осторожностью в связи с замедлением выведения аторвастатина из организма.

В период лечения следует тщательно контролировать клинические и лабораторные показатели функции организма и при выявлении значительных патологических изменений следует уменьшить дозу или прекратить лечение.

Пациентам с почечной недостаточностью и пациентам пожилого возраста коррекции дозы ТГ-тора не требуется.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: более 2% - бессонница, головокружение; менее 2% - головная боль, астенический синдром, недомогание, сонливость, кошмарные сновидения, амнезия, парестезии, периферическая невропатия, эмоциональная лабильность, атаксия, паралич лицевого нерва, гиперкинезы, депрессия, гиперестезия, потеря сознания.

Со стороны органов чувств: амблиопия, звон в ушах, сухость конъюнктивы, нарушение аккомодации, кровоизлияние в глаз, глухота, глаукома, паросмия, потеря вкусовых ощущений, извращение вкуса.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: более 2% - боль в груди; менее 2% - сердцебиение, вазодилатация, мигрень, постуральная гипотензия, повышение АД, флебит, аритмия, стенокардия.

Со стороны дыхательной системы: более 2% - бронхит, ринит; менее 2% - пневмония, диспноэ, бронхиальная астма, носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительной системы: более 2% - тошнота, изжога, запор или диарея, метеоризм, гастралгия, боли в животе, анорексия или повышение аппетита, сухость во рту, отрыжка, дисфагия, рвота, стоматит, эзофагит, глоссит, эрозивно-язвенные поражения слизистой оболочки полости рта, гастроэнтерит, гепатит, печеночная колика, хейлит, язва двенадцатиперстной кишки, панкреатит, холестатическая желтуха, нарушение функции печени, повышение ЩФ, АЛТ, АСТ, ректальное кровотечение, мелена, кровоточивость десен, тенезмы.

Со стороны костно-мышечной системы: более 2% - артрит; менее 2% - судороги мышц ног, бурсит, тендосиновит, миозит, миопатия, артралгия, миалгия, рабдомиолиз, кривошея, мышечный гипертонус, контрактуры суставов.

Со стороны системы кроветворения: анемия, лимфаденопатия, тромбоцитопения.

Со стороны мочевыделительной системы: более 2% - урогенитальные инфекции, периферические отеки; менее 2% - дизурия (в т.ч. поллакиурия, никтурия, недержание мочи или задержка мочеиспускания, императивные позывы на мочеиспускание), нефрит, гематурия, нефроуролитиаз.

Со стороны половой системы: менее 2% - вагинальное кровотечение, метроррагия, эпидидимит, снижение либидо, импотенция, нарушение эякуляции.

Дерматологические реакции: менее 2% - алопеция, ксеродермия, повышенное потоотделение, экзема, себорея, экхимозы, петехии.

Аллергические реакции: менее 2% - кожный зуд, кожная сыпь, контактный дерматит; редко – крапивница, ангионевротический отек, отек лица, фотосенсибилизация, анафилаксия, мультиформная экссудативная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Со стороны лабораторных показателей: менее 2% - повышение сывороточной КФК, альбуминурия.

Со стороны обмена веществ: менее 2% - гипергликемия, гипогликемия, увеличение массы тела, обострение подагры.

Со стороны эндокринной системы: менее 2% - гинекомастия, мастодиния.

Передозировка:

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля, проведение симптоматической терапии, меры, направленные на поддержание жизненно-важных функций организма. Специфический антидот неизвестен.

При появлении признаков и наличии факторов риска развития острой почечной недостаточности на фоне рабдомиолиза препарат следует немедленно отменить.

Поскольку аторвастатин в значительной степени связывается с белками плазмы крови, гемодиализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

У **женщин репродуктивного возраста**, не использующих надежные методы контрацепции, не рекомендуется применение ТГ-тора. Прием ТГ-тора следует прекратить, по крайней мере, за месяц до запланированной беременности.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном назначении ТГ-тора и циклоспорина, фибратов, эритромицина, кларитромицина, иммунодепрессантов, противогрибковых препаратов производных азола, никотинамида концентрация аторвастатина в плазме крови увеличивается и повышается риск развития миопатии.

Антациды снижают концентрацию аторвастатина на 35%, при этом влияние на содержание Хс-ЛПНП не меняется.

Одновременное применение ТГ-тора с ингибиторами протеазы, являющимися ингибиторами CYP3A4, сопровождается повышением концентрации аторвастатина в плазме крови.

При применении дигоксина в комбинации с ТГ-тором в дозе 80 мг/сут концентрация дигоксина в плазме крови повышается примерно на 20%.

ТГ-тор в дозе 80 мг/сут при одновременном применении повышает концентрацию пероральных контрацептивов, содержащих норэтидрон и этинилэстрадиол, на 20%.

Гиполипидемический эффект комбинации с колестиполом превосходит таковой для каждого препарата в отдельности.

При одновременном приеме с варфарином в первые дни протромбиновое время снижается, однако через 15 сут этот показатель нормализуется. В связи с этим пациентам, принимающим ТГ-тор с варфарином, следует чаще, чем обычно контролировать протромбиновое время.

Употребление сока грейпфрута во время терапии ТГ-тором может приводить к повышению концентрации аторвастатина в плазме крови. В связи с этим пациенты, принимающие препарат, должны избегать употребления этого сока.

Особые указания и меры предосторожности:

Функцию печени следует контролировать перед началом лечения, через 6, 12 недель терапии ТГ-тором и после каждого повышения дозы, а также периодически, например, через каждые 6 мес. Изменение активности ферментов печени обычно наблюдается в течение первых 3 мес после начала приема ТГ-тора.

Пациенты, у которых отмечается повышение активности печеночных трансаминаз, должны находиться под контролем до восстановления активности ферментов до нормального уровня. В случае, если значения АЛТ или АСТ более чем в 3 раза превышают ВГН, рекомендуется уменьшить дозу ТГ-тора или прекратить лечение.

Пациенты с диффузной миалгией, вялостью и слабостью мышц и/или значительным повышением КФК относятся к группе риска в отношении развития миопатии (определяемой как боли в мышцах с сопутствующим повышением уровня КФК более чем в 10 раз по сравнению с ВГН).

При назначении ТГ-тора в комбинации с циклоспорином, производными фиброевой кислоты, эритромицином, кларитромицином, иммунодепрессантами и противогрибковыми препаратами производными азола, а также с никотиновой кислотой (в дозах, вызывающих гиполипидемический эффект), необходимо сопоставить потенциальную пользу терапии и степень риска и контролировать состояние пациентов, у которых появляются признаки или симптомы мышечных болей, вялости или слабости, особенно в течение первых месяцев лечения и при повышении дозы какого-либо из препаратов.

Лечение ТГ-тором следует временно приостановить или прекратить при развитии тяжелого состояния, которое может явиться следствием миопатии, а также при наличии факторов риска в отношении развития острой почечной недостаточности вследствие рабдомиолиза (например, острой тяжелой инфекции, артериальной гипотензии, обширного хирургического вмешательства, травмы, тяжелых метаболических и эндокринных нарушений, а также нарушений электролитного баланса).

Пациент должен немедленно обратиться к врачу при появлении необъяснимых болей или слабости в мышцах, особенно если они сопровождаются недомоганием и лихорадкой.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

О неблагоприятном влиянии ТГ-тора на способность управлять автомобилем и выполнять работу, требующую повышенного внимания, не сообщалось.

При нарушениях функции почек

Пациентам с почечной недостаточностью коррекции дозы ТГ-тора не требуется.

При нарушениях функции печени

У **пациентов с нарушениями функции печени** препарат следует применять с осторожностью в связи с замедлением выведения аторвастатина из организма.

В период лечения следует тщательно контролировать клинические и лабораторные показатели функции организма и при выявлении значительных патологических изменений следует уменьшить дозу или прекратить лечение.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста коррекции дозы ТГ-тора не требуется.

Применение в детском возрасте

Эффективность и безопасность применения препарата у детей до 18 лет не установлены.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. Срок годности – 2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Tg-Tor