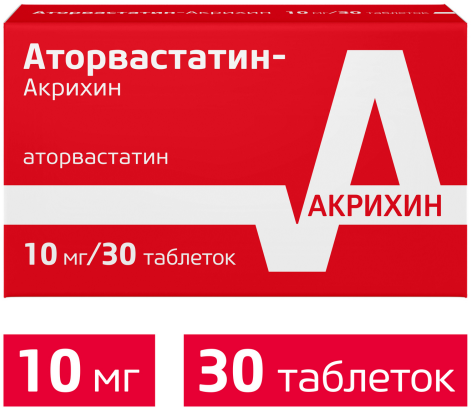
Инструкция по применению
Аторвастатин Таблетки покрытые оболочкой 10 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Индия
Производитель: Акрихин
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Аторвастатин
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 10 мг



Описание

Белые круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой. На изломе таблетки белые или почти белые.

Действующее вещество

Аторвастатин

Состав

Каждая таблетка, покрытая оболочкой, содержит: активное вещество: аторвастатин кальциевая соль 10,84/21,68 мг, в количестве эквивалентном 10/20 мг аторвастатина вспомогательные вещества: кальция карбонат 20/40 мг, микрокристаллическая целлюлоза 43/86 мг, лактоза 17,5/35,0 мг, твин 80 0,5/1,0 мг, гидроксипропилцеллюлоза 1,0/2,0 мг, кроскармеллоза 5,66/11,32 мг, магния стеарат 0,75/1,5 мг оболочка: гидроксипропилметилцеллюлоза (гипромеллоза) 1,5/3,0 мг, титана диоксид 0,35/0,7 мг, полиэтиленгликоль 0,15/0,3 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Абсорбция - высокая. Время достижения максимальной концентрации - 1-2 ч, максимальная концентрация у женщин выше на 20%, AUC (площадь под кривой) - ниже на 10%, максимальная концентрация у больных алкогольным циррозом печени в 16 раз, AUC - в 11 раз выше нормы. Пища несколько снижает скорость и длительность абсорбции препарата (на 25% и 9% соответственно), однако снижение холестерина ЛПНП сходно с таковым при применении аторвастатина без пищи. Концентрация аторвастатина при применении в вечернее время ниже, чем в утреннее (приблизительно на 30%). Выявлена линейная зависимость между степенью всасывания и дозой препарата. Биодоступность - 14%, системная биодоступность ингибирующей активности в отношении ГМГ-КоА редуктазы - 30%. Низкая системная биодоступность обусловлена пресистемным метаболизмом в слизистой оболочке желудочно-кишечного тракта и при "первом прохождении" через печень. Средний объем распределения - 381 л, связь с белками плазмы крови - 98%. Метаболизируется преимущественно в печени под действием цитохрома P450 CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7 с образованием фармакологически активных метаболитов (орто- и парагидроксилированных производных, продуктов бета-окисления). Ингибирующий эффект препарата в отношении ГМГ-КоА редуктазы примерно на 70% определяется активностью циркулирующих метаболитов. Выводится с желчью после печеночного и /или внепеченочного метаболизма (не подвергается выраженной кишечно-печеночной рециркуляции). Время полувыведения - 14 ч. Ингибирующая активность в отношении ГМГ-КоА редуктазы сохраняется около 20-30 ч, благодаря наличию активных метаболитов. Менее 2% от принятой внутрь дозы препарата определяется в моче. Не выводится в ходе гемодиализа.

Показания

Первичная гиперхолестеринемия, смешанная гиперлипидемия, гетерозиготная и гомозиготная семейная гиперхолестеринемия (в качестве дополнения к диете).

Способ применения и дозы

До начала лечения Аторвастатином больной должен быть переведен на диету, обеспечивающую снижение содержания липидов в крови, которую необходимо соблюдать в течение лечения препаратом. Внутрь, принимать в любое время дня (но в одно и то же время), независимо от приема пищи. Рекомендуемая начальная доза - 10 мг 1 раз в сутки. Далее дозу подбирают индивидуально в зависимости от содержания холестерина - ЛПНП. Изменять дозу следует с интервалом не менее 4 недели. Максимальная суточная доза - 80 мг в 1 прием. Первичная (гетерозиготная наследственная и полигенная) гиперхолестеринемия (тип IIa) и смешанная гиперлипидемия (тип IIb). Лечение начинают с рекомендуемой начальной дозы, которую увеличивают после 4-х недель терапии в зависимости от реакции больного. Максимальная суточная доза составляет 80 мг. Гомозиготная наследственная гиперхолестеринемия. Диапазон доз такой же, как и при других типах гиперлипидемии. Начальная доза подбирается индивидуально в зависимости от выраженности заболевания. У большинства больных с гомозиготной наследственной гиперхолестеринемией оптимальный эффект наблюдается при использовании препарата в суточной дозе 80 мг (однократно). У больных с почечной недостаточностью и у пациентов пожилого возраста коррекции доз Аторвастатина не требуется. У больных с нарушениями функции печени следует соблюдать осторожность в связи с замедлением выведения препарата из организма. Следует тщательно контролировать клинические и лабораторные показатели и при выявлении значительных патологических изменений доза должна быть снижена или лечение должно быть прекращено.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата, заболевания печени в активной стадии (в т.ч. активный хронический гепатит, хронический алкогольный гепатит), повышение активности "печеночных" трансаминаз (более чем в 3 раза по сравнению с верхней границей нормы) неясного генеза, печеночная недостаточность (классы А и В по классификации Чайлд-Пью), цирроз печени любой этиологии, беременность, период лактации, детский возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены), непереносимость лактозы, недостаточность лактазы, глюкозогалактозная мальабсорбция, применение у женщин, планирующих беременность и не использующих надежных методов контрацепции.

Применение при беременности и кормлении грудью

Препарат Аторвастатин-Акрихин противопоказан при беременности. Женщины репродуктивного возраста во время лечения должны пользоваться адекватными методами контрацепции. Препарат Аторвастатин-Акрихин можно назначать женщинам репродуктивного возраста только в том случае, если вероятность беременности у них очень низкая и пациентка информирована о возможном риске для плода во время лечения. Контролируемых клинических исследований применения аторвастатина у беременных не проводилось. Были получены редкие сообщения о врожденных аномалиях развития плода после воздействия ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы. Исследования, проведенные на животных, показали присутствие токсического воздействия аторвастатина на репродуктивную функцию. Лечение матерей препаратом Аторвастатин-Акрихин может уменьшить образование мевалоната в клетках печени плода, который является предшественником холестерина. Атеросклероз является хроническим процессом, и обычно прекращение применения гиполипидемических лекарственных средств во время беременности должно оказывать незначительное влияние на отдаленный риск, связанный с первичной гиперхолестеринемией. По этим причинам, препарат Аторвастатин-Акрихин не следует применять женщинам, которые планируют беременность и у которых не исключается беременность. Лечение препаратом Аторвастатин-Акрихин следует приостановить на период беременности или до тех пор, пока не будет установлено, что женщина не беременна. Препарат Аторвастатин-Акрихин противопоказан в период грудного вскармливания. Неизвестно, выделяется ли аторвастатин с грудным молоком. При необходимости назначения препарата в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить во избежание риска нежелательных явлений у грудных детей.

Побочные действия

Классификация частоты развития побочных эффектов Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто (⩾ 1/10), часто (⩾ 1/100 до 1/10), нечасто (⩾ 1 /1000 до < 1/100), редко (⩾ 1/10000 до < 1/1000), очень редко (<1/10000), неуточненная частота (не может быть подсчитана по имеющимся данным). Со стороны нервной системы: часто - головная боль, астенический синдром нечасто - головокружение, недомогание, сонливость, потеря или снижение памяти, парестезия, периферическая нейропатия, гиперестезия редко - нарушения сна, включая бессонницу и кошмарные сновидения, эмоциональная лабильность, атаксия, паралич лицевого нерва, гиперкинезы, слабость, потеря сознания неуточненная частота - депрессия. Со стороны органов чувств: нечасто - шум в ушах редко - амблиопия, сухость конъюнктивы, нарушение аккомодации, кровоизлияние в глаза, глаукома,

паросмия, потеря вкусовых ощущений, извращение вкуса очень редко - глухота. Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - боль в груди, ощущение сердцебиения, симптомы вазодилатации, мигрень, постуральная гипотензия, повышение артериального давления, флебит, аритмия, стенокардия, васкулит. Со стороны системы кроветворения: нечасто - тромбоцитопения редко - анемия, лимфаденопатия. Со стороны дыхательной системы: часто - бронхит, ринит нечасто - пневмония, диспноэ, бронхиальная астма, носовое кровотечение неуточненная частота - интерстициальное заболевание легких (особенно при длительном применении). Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, запоры или диарея, боль в животе, метеоризм нечасто: рвота, анорексия или повышение аппетита, гепатит, панкреатит редко - изжога, гастралгия, сухость слизистой оболочки полости рта, отрыжка, дисфагия, стоматит, эзофагит, глоссит, гастроэнтерит, печеночная колика, хейлит, язва двенадцатиперстной кишки, нарушение функции печени, ректальное кровотечение, мелена, кровоточивость десен, эрозивно-язвенные поражения слизистой оболочки полости рта, тенезмы, холестатическая желтуха. Со стороны опорно-двигательного аппарата: часто - ревматическая полимиалгия, миалгия, кривошея нечасто - боль в спине, судороги мышц ног, миозит, миопатия, артралгия редко - артрит, бурсит, мышечный гипертонус, тендосиновит, контрактуры суставов, припухлость суставов, тендопатия, рабдомиолиз неуточненная частота - иммуноопосредованная некротизирующая миопатия. Со стороны мочеполовой системы: часто - урогенитальные инфекции, периферические отеки редко - дизурия (в т.ч. поллакиурия, никтурия, недержание мочи или задержка мочеиспускания, императивные позывы на мочеиспускание), нефрит, гематурия, вагинальное кровотечение, нефроуролитиаз, метроррагия, эпидидимит, снижение либидо, импотенция, нарушение эякуляции. Со стороны кожных покровов: часто - алопеция, ксеродермия, повышенное потоотделение, экзема, себорея, экхимозы, петехии. Аллергические реакции: нечасто - кожный зуд, кожная сыпь, мультиформная экссудативная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла) редко - контактный дерматит, крапивница, ангионевротический отек, отек лица, фотосенсибилизация очень редко - анафилаксия. Лабораторные показатели: нечасто - гипергликемия, гипогликемия, повышение сывороточной креатинфосфокиназы (КФК), щелочной фосфатазы, редко - альбуминурия, повышение концентрации гликозилированного гемоглобина, аланинаминотрансферазы (АЛТ) или аспартатаминотрансферазы (АСТ). Прочие: нечасто - увеличение массы тела, гинекомастия, мастодиния, обострение течения подагры неуточненная частота - сахарный диабет частота развития зависит от наличия или отсутствия факторов риска (уровень глюкозы крови натощак #5,6 ммоль/л, индекс массы тела (ИМТ) #30 кг/м2, повышенная концентрация триглицеридов, артериальная гипертензия в анамнезе).

Передозировка

Лечение. Специфического антидота нет. Проводится симптоматическая терапия. Принимают меры для поддержания жизненно важных функций организма и меры по предупреждению дальнейшего всасывания препарата: промывание желудка, прием активированного угля. Гемодиализ не эффективен. При появлении признаков и наличии факторов риска развития острой печеночной недостаточности на фоне рабдомиолиза (редкий, но тяжелый побочный эффект), препарат должен быть немедленно отменен. Поскольку аторвастатин в значительной степени связывается с белками плазмы крови, гемодиализ является малоэффективным способом удаления этого вещества из организма.

Взаимодействие с другими препаратами

При одновременном назначении циклоспорина, фибратов, эритромицина, кларитромицина, иммунодепрессивных, противогрибковых препаратов (относящихся к азолам) и никотинамида концентрация аторвастатина в плазме (и риск возникновения миопатии) повышается. Антациды снижают концентрацию на 35% (влияние на содержание холестерина ЛПНП не меняется). Одновременное применение аторвастатина с ингибиторами протеаз, известными как ингибиторы цитохрома P450 CYP3A4, сопровождается увеличением концентрации аторвастатина в плазме. При применении дигоксина в комбинации с аторвастатином в дозе 80 мг/сут концентрация дигоксина увеличивается примерно на 20%. Увеличивает концентрацию на 20% (при назначении с аторвастатином в дозе 80 мг/сут) пероральных контрацептивов, содержащих норэтиндрон и этинилэстрадиол. Гиполипидемический эффект комбинации с колестиполом превосходит таковой для каждого препарата в отдельности. При одновременном приеме с варфарином в первые дни снижается протромбиновое время, однако через 15 суток этот показатель нормализуется. В связи с этим пациентам, принимающим аторвастатин с варфарином следует чаще, чем обычно контролировать протромбиновое время. Употребление сока грейпфрута в течение лечения аторвастатином может приводить к повышению концентрации препарата в плазме крови. В связи с этим больные, принимающие препарат, должны избегать употребления этого сока.

Особые указания

Нарушение функции печени Применение ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы для снижения уровня липидов в кровиможет приводить к изменению биохимических показателей, отражающих функцию печени. Функцию печени следует контролировать перед началом лечения, через 6 недель, 12 недель после начала приема Аторвастатина и после каждого повышения дозы, а также периодически, например, каждые 6 месяцев. Изменение активности ферментов печени обычно наблюдается в течение первых трех месяцев после начала приема Аторвастатина. Пациенты, у которых отмечается повышение уровня трансаминаз, должны находиться под контролем до возвращения уровня ферментов в норму. В том случае, если значения аланинаминотрансферазы (АЛТ) или аспарагинаминотрансферазы (АСТ) более чем в 3 раза превышают уровень верхнего допустимого предела, рекомендуется снизить дозу Аторвастатина или прекратить лечение. Скелетная мускулатура Пациенты с диффузной миалгией, вялостью или слабостью мышц и/или значительным повышением КФК представляют собой группу риска в отношении развития миопатии (определяемой как боли в мышцах с сопутствующим повышением уровня КФК более чем в 10 раз по сравнению с верхней границей нормы). При назначении сочетанной терапии Аторвастатин с циклоспорином, производными фибровой кислоты, эритромицином, кларитромицином, иммунодепрессантами, и противогрибковыми препаратами азоловой структуры, а также вызывающими снижение уровня липидов дозами ниацина, необходимо сопоставить потенциальную пользу и степень риска при данном лечении и осуществлять наблюдение за пациентами, 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 Аторвастатином должно быть временно приостановлено или прекращено при развитии тяжелого состояния, могущего 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). У женщин репродуктивного возраста, не использующих надежную контрацепцию, применение Аторвастатина не рекомендуется. Если больная планирует беременность, она должна прекратить прием Аторвастатина по крайней мере за месяц до запланированной беременности. Больной должен немедленно обратиться к врачу при появлении необъяснимых болей или слабости в мышцах, особенно, если они сопровождаются недомоганием и лихорадкой.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте при температуре ниже 25°С. Хранить в местах, недоступных для детей.