

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
АТОКОР
(АТОCOR)

Склад:

діюча речовина: atorvastatin;

1 таблетка містить аторвастатину кальцію тригідрату у перерахуванні на аторвастатин 10 мг або 20 мг;

допоміжні речовини: : лактоза (у вигляді моногідрату), кальцію карбонат, натрію кроскармелоза, полісорбат-80,

гідроксипропілцелюлоза, магнію стеарат, гіпромелоза, пропіленгліколь, тальк, титану діоксид (E 171).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Гіполіпідемічні засоби, що знижують рівень холестерину тригліцеридів у сироватці крові. Інгібітор ГМГ КоА-редуктази. Код АТС С10А А05.

Клінічні характеристики.

Показання. Як доповнення до дієти з метою зниження підвищеного рівня загального холестерину, ліпопротеїдів низької щільності, аполіпропротеїну В і тригліцеридів у хворих з первинною гіперхолестеринемією, комбінованою (змішаною) гіперліпідемією і гетерозиготною і гомозиготною сімейною гіперхолестеринемією у тих випадках, коли дієта й інші немедикаментозні методи не забезпечують належного ефекту.

Протипоказання. Підвищена чутливість до препарату. Активні захворювання печінки або підвищення активності сироваткових трансаміназ (більше ніж у 3 рази) невстановленого генезу, вагітність і період годування груддю. Препарат не призначають жінкам дітородного віку, які не використовують адекватні методи контрацепції. Дитячий вік до 10 років.

Спосіб застосування та дози. Перед початком терапії Атокором хворому потрібно призначити стандартну гіпохолестеринемічну дієту, якої він повинен дотримуватись під час лікування. Дозу потрібно встановлювати індивідуально, враховуючи початковий рівень ліпопротеїдів низької щільності і мету терапії. Рекомендована початкова доза становить 10 мг 1 раз на добу. Змінювати дозу потрібно з інтервалом 4 тижні і більше. Максимальна доза становить 80 мг 1 раз на добу. Препарат можна приймати у будь-яку годину дня, незалежно від прийому їжі.

При первинній гіперхолестеринемії і комбінованій (змішаній) гіперліпідемії призначають по 10 мг 1 раз на добу. Ефект проявляється протягом 2 тижнів, а максимальний ефект розвивається протягом 4 тижнів. При тривалій терапії ефект зберігається.

При гомозиготній сімейній гіперхолестеринемії у більшості дорослих пацієнтів застосування Атокору у дозі 80 мг на добу призводить до зниження рівня ліпопротеїдів низької густини більш ніж на 15 % (18-45 %).

При гетерозиготній родинній гіперхолестеринемії для пацієнтів 10-17 років рекомендовано призначати Атокор у стартовій дозі по 10 мг один раз на добу щоденно. Максимальна рекомендована доза становить 20 мг один раз на добу щоденно (دوزи, що перевищують 20 мг, не вивчали у пацієнтів цієї вікової групи). Корекція дози може проводитися з інтервалом 4 тижні і більше.

Якщо Атокор застосовують одночасно з циклоспорином, доза Атокору не повинна перевищувати 10 мг.

У хворих з порушеннями функції нирок концентрація аторвастатину у плазмі крові і його гіполіпідемічна дія не змінюються, тому корекція дози не потрібна.

Побічні реакції. З боку нервової системи: головний біль, інсомнія, периферична нейропатія, парестезія.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, діарея, біль у животі, диспепсія, запор, метеоризм, панкреатит, блювання.

З боку опорно-рухового апарату: міалгія, міопатія, міозит, судомні м'язів.

З боку обміну речовин: гіпоглікемія, гіперглікемія, анорексія.

З боку гепатобіліарної системи: гепатит, холестатична жовтяниця.

Дерматологічні реакції: алопеція, свербіж, висип.

З боку репродуктивної системи: імпотенція.

З боку організму в цілому: астенія.

Побічні реакції у дітей з гетерозиготною родинною гіперхолестеринемією (10-17 років).

З боку системи кровотворення: тромбоцитопенія.

Реакції гіперчутливості: алергічні реакції (включаючи анафілаксію).

З боку обміну речовин: збільшення ваги.

З боку нервової системи: гіпестезія, амнезія, запаморочення, дисгевзія.

З боку органа слуху: дзвін у вухах.

Дерматологічні реакції: синдром Стівенса-Джонсона, токсичний епідермальний некроліз, мультиформна еритема, бульозний висип, кропив'янка.

З боку опорно-рухового апарату: рабдоміоліз, артралгія, біль у спині, розриви сухожилля.

З боку організму в цілому: інфекції, біль у грудній клітці, периферичні набряки, нездужання, втомлюваність.

Передозування. При передозуванні можливий розвиток рабдоміолізу, порушення функції печінки. Специфічного антитоду не існує. У випадку передозування проводять симптоматичне і підтримуюче лікування. Через активне зв'язування препарату з білками плазми крові гемодіаліз малоефективний.

Застосування в період вагітності або годування груддю. Препарат протипоказаний в період вагітності та годування груддю.

Діти. Атокор застосовують при гетерозиготній родинній гіперхолестеринемії дітям старше 10 років.

Особливості застосування. Жінкам дітородного віку при лікуванні Атокором потрібно використовувати адекватні методи контрацепції.

Захворювання нирок не впливає на концентрацію аторвастатину у плазмі крові і на його гіполіпідемічну дію, тому корекція дози не потрібна.

З обережністю призначають пацієнтам, які зловживають алкоголем і/або мають захворювання печінки. До початку лікування Атокором потрібно проконтролювати стан показників функції нирок і печінки. Перед початком і весь період лікування потрібно дотримуватися стандартної гіпохолестеринемічної дієти. У випадку підвищення активності трансаміназ показники потрібно контролювати доти, доки вони не нормалізуються. Якщо підвищення активності аспартатамінотрансферази або аланінамінотрансферази більше ніж у 3 рази, рекомендується понизити дозу або відмінити препарат.

Для людей літнього віку корекція дози не потрібна. У процесі досліджень були встановлені безпека і ефективність препарату для пацієнтів цієї групи при максимальній дозі 80 мг на добу.

Терапію Атокором потрібно зупинити у разі вираженого підвищення активності креатинфосфокінази або розвитку міопатії (або посилення її наявності). При появі ознак міопатії потрібно визначити активність креатинфосфокінази. Якщо значне підвищення рівня креатинфосфокінази зберігається, рекомендується понизити дозу або відмінити препарат.

Препарат містить лактозу! Це слід мати на увазі при застосуванні препарату у хворих з непереносимістю лактози.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Атокор не впливає на здатність керувати автомобілем та іншими механічними засобами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Одночасне застосування Атокору і дигоксину супроводжується підвищенням рівноважної концентрації дигоксину у плазмі крові майже на 20 %. При одночасному лікуванні дигоксином необхідно адекватно спостерігати за хворим. Аторвастатин та його метаболіти є субстанціями OATP1B1 переносника. Інгібітори OATP1B1 (наприклад, циклоспорин) можуть підвищити біодоступність аторвастатину. Одночасне застосування аторвастатину 10 мг та циклоспорину 5,2 мг/кг/добу спричиняє підвищення у 7,7 разів експозиції аторвастатину.

У здорових людей паралельне застосування еритроміцину (500 мг 4 рази на добу), що інгібує цитохром P450 3A4, призводило до підвищення концентрації аторвастатину у плазмі крові. При застосуванні Атокору і гормональних контрацептивів підвищується концентрація норетидрону і етинілестрадіолу. При встановленні дози контрацептивного засобу необхідно враховувати можливість підвищення концентрації цих засобів.

Концентрація аторвастатину в плазмі зменшується на 25 % при одночасному застосуванні холестилолу. При цьому гіполіпопротеїновий ефект був більш виражений при одночасному застосуванні Атокору і холестилолу, ніж при застосуванні одного з цих препаратів.

Одночасне застосування внутрішньо суспензії, яка містить магнію і алюмінію гідроксид, може знижувати концентрацію аторвастатину в плазмі крові майже на 35 %, не змінюючи при цьому впливу Атокору на рівень ліпопротеїдів низької густини.

Ризик розвитку міопатії під час лікування іншими препаратами цієї групи підвищується при одночасному застосуванні циклоспорину, фібрів, еритроміцину, протигрибкових препаратів, які належать до групи азолів, і кислоти нікотинової.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Селективний конкурентний інгібітор 3-гідрокси-3-метилглутарил коензимА-редуктази - ферменту, що перетворює 3-гідрокси-3-метилглутарил коензим А у мевалонову кислоту, яка є попередником стеролів, включаючи холестерин. Атокор знижує рівень холестерину і ліпопротеїдів у плазмі крові за рахунок пригнічення 3-гідрокси-3-метилглутарил коензимА-редуктази і синтезу холестерину у печінці, а також збільшення кількості рецепторів ліпопротеїдів низької щільності на поверхні гепатоцитів, що призводить до посилення захоплення і катаболізму ліпопротеїдів низької щільності. Препарат знижує рівень ліпопротеїдів низької щільності у хворих з гомозиготною сімейною гіперхолестеринемією. Атокор знижує рівень загального холестерину, ліпопротеїдів низької щільності, аполіпопротеїну В і тригліцеридів, викликає підвищення рівня холестерину ліпопротеїдів високої щільності та аполіпопротеїну А. Ці результати реєструються у пацієнтів з гетерозиготною сімейною гіперхолестеринемією і змішаною гіперліпідемією, включаючи хворих на інсулінозалежний цукровий діабет.

Фармакокінетика. Аторвастатин швидко всмоктується після прийому внутрішньо: максимальна концентрація в плазмі крові досягається через 1-2 год. Ступінь всмоктування підвищується пропорційно дозі аторвастатину. Біодоступність препарату становить 95-99 %. Абсолютна біодоступність аторвастатину - приблизно 12 %, а системна доступність інгібуючої активності відносно 3-гідрокси-3-метилглутарил коензимА-редуктази - приблизно 30 %. Низька системна біодоступність зумовлена пресистемним кліренсом у слизовій оболонці шлунково-кишкового тракту і/або біотрансформацією при первинному проходженні через печінку. Середній об'єм розподілу аторвастатину становить приблизно 565 л. Аторвастатин зв'язується з білками плазми крові приблизно 98 %, біотрансформується під дією цитохрому P450 3 A4 з утворенням орто- і парагідроксильованих похідних і різноманітних продуктів

бета-окислення. Ефект аторвастатину щодо 3-гідрокси-3-метилглутарил коензимА-редуктази приблизно на 70 % визначається активністю циркулюючих метаболітів. Препарат виводиться з жовчю після печінкової і/або позапечінкової біотрансформації. Препарат не піддається вираженій кишково-печінковій рециркуляції. Середній період напіввиведення аторвастатину становить приблизно 14 год. Інгібуюча активність відносно 3-гідрокси-3-метилглутарил коензимА-редуктази зберігається приблизно 20-30 год. завдяки наявності активних метаболітів. Дані з фармакокінетики препарату у дітей відсутні.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: білі або майже білі, трикутні, двоопуклі, вкриті плівковою оболонкою таблетки з тисненням «А» з одного боку і тисненням «10» або «20» з іншого боку.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері, по 1 блістеру у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. «Д-р Редді'с Лабораторіс Лтд», Індія.

Місцезнаходження. Дільниця № 137, 138 & 146 С.В. Кооператив Індустріал Істейт, І.Д.А., Болларам, Джінарам Мандал, округ Медак – 502 325. Андра Прадеш, Індія.