

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ЛоваГЕКСАЛ®
(LovaHEXAL®)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: lovastatin; метилбутанової кислоти 1,2,3,7,8,8-гексагідро-3,7-диметил-8- 2-(тетрагідро-4-гідрокси-6-оксо-2Н-піран-2-іл)-етил -1-нафталеніловий ефір;

основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 10 мг: світло-помаранчеві восьмикутні таблетки з плоскою поверхнею та фаскою, написом «L 10» на одному боці та рисою з обох боків таблетки; на поверхні таблеток допускаються вкраплення;

таблетки по 20 мг: світло-блакитні восьмикутні таблетки з плоскою поверхнею та фаскою, написом «L 20» на одному боці та рисою з обох боків таблетки; на поверхні таблеток допускаються вкраплення;

таблетки по 40 мг: світло-зелені восьмикутні таблетки з плоскою поверхнею та фаскою, написом «L 40» на одному боці та рисою з обох боків таблетки; на поверхні таблеток допускаються вкраплення;

склад: 1 таблетка містить ловастатину 10 мг, або 20 мг, або 40 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний желатинізований, целюлоза мікрокристалічна, магнію стеарат; барвники для таблеток по 10 мг: заліза оксид жовтий (E 172), заліза оксид червоний (E 172); барвник для таблеток по 20 мг: індиготин E132 Al(OH)₃; барвник для таблеток по 40 мг: хіноліновий жовтий E104 Al(OH)₃, індиготин E132 Al(OH)₃.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Гіполіпідемічні засоби. Препарати, що знижують рівень холестерину і тригліцеридів у сироватці крові. Інгібітори ГМГ-КоА редуктази.
Код АТС С10А А02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Гіполіпідемічний засіб групи статинів, що був виділений з продуктів життєдіяльності гриба *Aspergillus terreus*. Препарат гальмує початкові стадії біосинтезу холестерину в печінці. В організмі метаболізується з утворенням бета-оксикислоти, яка конкурентно блокує 3-гідрокси-3-метилглутарил-коензим-А-редуктазу (ГМК-КоА-редуктазу) та порушує перетворення ГМГ-КоА на мевалонат. Таким чином ловастатин інгібує синтез холестерину на стадії утворення мевалонаної кислоти, посилює катаболізм холестерину, знижує в плазмі крові концентрацію холестерину, ліпопротеїнів низької щільності (ЛПНЩ) та дуже низької щільності (ЛПДНЩ), апопротеїну В. Ловастатин підвищує кількість рецепторів до ЛПНЩ, прискорює сироватковий кліренс ЛПНЩ та холестерину. Меншою мірою препарат діє на тригліцериди і підвищує вміст ліпопротеїнів високої щільності.

Фармакокінетика. Прийом їжі підвищує абсорбцію ловастатину (на 30%) і його системну біодоступність на 50%. Сік грейпфрута підвищує біодоступність ловастатину в 12 разів, його активних метаболітів – майже в 4 рази. Максимальна концентрація препарату реєструється через 2 - 4 год після перорального прийому. Стабільна терапевтична концентрація препарату досягається на 2-гу - 3-тю добу лікування. Понад 95% прийнятої дози зв'язується з білками крові. Біодоступність ловастатину становить десь 5%. Препарат метаболізується в печінці за участю системи цитохрому P₄₅₀ (СYP3A). Проникає через гематоенцефалічний та плацентарний бар'єри, накопичується в печінці, де окислюється до β-оксикислоти β-оксипохідного та інших метаболітів, частина яких зберігає активність блокаторів ГМГ КоА-редуктази.

Ловастатин виділяється, в основному, з жовчю. Приблизно 90% дози виводиться з калом і лише 10% – з сечею. Період напіввиведення препарату – приблизно 3 год. Виражений гіполіпідемічний ефект розвивається через 2 тижні застосування, максимальний – через 4 - 6 тижнів.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Показання для застосування. Підвищений рівень загального холестерину і ліпопротеїнів низької щільності (ЛПНЩ) у пацієнтів з первинною гіперхолестеринемією, що не коригується спеціальною дієтою, особливо за наявності інших факторів ризику. Підвищений рівень холестерину у пацієнтів з комбінованою гіперхолестеринемією та гіпертригліцеридемією.

Спосіб застосування та дози. Звичайна початкова доза становить 20 мг ЛоваГЕКСАЛу® 1 раз на добу під час вечері. За необхідності дозу підвищують (1 раз кожні 4 тижні) до 40 - 80 мг ЛоваГЕКСАЛу® на добу в 1 - 2 прийоми під час сніданку та вечері. Максимальна добова доза – 80 мг.

Доза ЛоваГЕКСАЛу® повинна бути зменшена, якщо рівні холестерину ЛПНЩ зменшуються нижче 75 мг/дл (1,94 ммоль/л) або рівні загального холестерину в плазмі зменшуються нижче 140 мг/дл (3,6 ммоль/л).

Для пацієнтів, які одержують препарати-імуносупресори, початкова доза ловастатину становить 10 мг на добу, максимальна доза не повинна перевищувати 20 мг/добу.

Дозування при нирковій недостатності.

Для пацієнтів з помірно вираженою нирковою недостатністю корекція дози не потрібна. У пацієнтів з тяжкою нирковою недостатністю (кліренс креатиніну 30 мл/хв) дози вище 20 мг/добу слід призначати з обережністю.

Ловастатин рекомендовано приймати під час їди, оскільки за таких умов препарат має найбільшу ефективність. Дозу та термін лікування визначає лікар.

Досвіду застосування препарату для лікування дітей до 12 років немає.

Побічна дія. Метеоризм, діарея, запор, нудота, розлади травлення, біль у животі, запаморочення, “затуманення” зору, головний біль, висипання, судомні міалгії.

Поодинокі випадки: м'язова слабкість, втомлюваність, свербіж, сухість слизової оболонки рота, розлади сну, порушення смаку, порушення статевої функції.

Рідко – міопатія, гострий некроз скелетних м'язів (рабдоміоліз), еректильна дисфункція; реакції підвищеної чутливості: анафілаксія, ангіоневротичний набряк, вовчакоподібний синдром, поліміалгія, васкуліт, тромбоцитопенія, лейкопенія, еозинофілія, гемолітична анемія, наявність позитивних антиядерних антитіл, збільшення швидкості осідання еритроцитів, артрит і артралгія, кропив'янка, астенія, фоточутливість, лихоманка, гіперемія, тремор, задишка.

Зрідка можливі: панкреатит, гепатит, холестатична жовтяниця, блювання, відсутність апетиту, парестезія, периферична нейропатія, почуття страху і тривоги, алопеція, токсичний епідермальний некроліз, множинна еритема, синдром Стівенса–Джонсона.

За даними лабораторних досліджень повідомлялося про підвищення сироваткових рівнів печінкових трансаміназ, лужної фосфатази, білірубину, а також креатинкінази, зумовлене фракцією ферменту несерцевого походження.

Протипоказання. Підвищена чутливість до активного інгредієнта або до будь-якої з допоміжних речовин препарату; захворювання печінки у стадії загострення, печінкова недостатність і тяжкі порушення функції нирок; стійке підвищення рівнів печінкових трансаміназ у сироватці крові (більше, як у 3 рази порівняно з нормою); тяжкий загальний стан пацієнта; періоди вагітності та лактації; діти до 12 років.

Передозування.

Симптоми: міопатії (рабдоміоліз), погіршення функції печінки, нудота, блювання, діарея.

Лікування: симптоматичне. Специфічного антидоту немає. Гемодіаліз неефективний.

Особливості застосування. Під час лікування пацієнти повинні дотримуватись стандартної гіпохолестеринемічної дієти. До призначення препарату і під час лікування необхідно періодично

перевіряти рівень холестерину в крові та проводити лабораторні тести (визначення рівнів креатинфосфокінази і печінкових трансаміназ). Підвищення рівнів печінкових трансаміназ (АЛТ, АСТ) більше, як у 3 рази та креатинфосфокінази більше, як у 10 разів, порівняно з нормою, вимагають відміни препарату, відповідного медичного нагляду та за необхідності проведення симптоматичної терапії.

Ловастатин з обережністю призначають пацієнтам, які мають в анамнезі захворювання печінки або зловживають алкоголем.

Наявність трансплантованих органів і лікування імунодепресантами збільшують ризик рабдоміолізу і розвитку ниркової недостатності.

Особливої обережності вимагає призначення ловастатину за наявності ниркової недостатності або патологічних станів, які можуть спровокувати її розвиток, таких як виражена гіпотензія, тяжкі інфекційні захворювання, ендокринні і електролітні розлади, неконтрольовані судоми, великі хірургічні втручання, травми.

Хворі похилого віку можуть виявити підвищену чутливість до дії препарату, навіть при застосуванні звичайних доз ловастатину.

Гомозиготна сімейна гіперхолестеринемія: ловастатин неефективний при лікуванні пацієнтів, що страждають на гомозиготну сімейну гіперхолестеринемію.

Гіпертригліцеридемія: ловастатин помірно знижує концентрацію тригліцеридів, тому його застосування є недоцільним у випадках, коли гіпертригліцеридемія є основною метою терапії.

Інші патології: препарат не рекомендовано приймати пацієнтам зі спадковою непереносимістю галактози, дефіцитом лактози або глюкозо-галактозною мальабсорбцією.

Вплив на здатність керувати транспортними засобами і рухливими механізмами, що потребують великої концентрації уваги.

Не відомо, чи впливає ловастатин на здатність керувати транспортними засобами і обслуговувати рухомі механізми. У деяких пацієнтів можуть виникати запаморочення, зуманення зору, головний біль, тому слід утримуватися від керування автотранспортом та працювати зі складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Фібрати (гемфіброзил), препарати нікотинової кислоти (ніацин), імуносупресори (циклоспорин), антибіотики-макроліди (еритроміцин) при призначенні з ловастатином збільшують ризик міопатії/рабдоміолізу.

При одночасному застосуванні ловастатину з антикоагулянтами (похідні кумарину або індандіону) можливе збільшення часу кровотечі і протромбінового часу. У хворих, які отримують антикоагулянти і ловастатин, необхідно контролювати протромбіновий час.

При одночасному застосуванні з холестираміном або колестиполом біодоступність ловастатину може знижуватись. Тому ловастатин доцільно приймати через 4 год після прийому холестираміну або колестиполу.

Пропранолол може спричинити зниження біодоступності ловастатину.

Обережність та медичний контроль необхідні при застосуванні ловастатину з препаратами, які метаболізуються за участю цитохромної системи P₄₅₀ (CYP3A).

Умови та термін зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 С. Термін придатності – 4 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 30 таблеток в упаковці; по 3 (3 – 10) блістери у картонній коробці.

Виробник. “Салюгас Фарма ГмбХ”, підприємство компанії “Тексал АГ”, Німеччина.

Адреса. HEXAL AG, Industriestrasse 25, D-83607 Holzkirchen, Germany.