

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**  
**ЛОВАСТАТИН**  
**(LOVASTATIN)**

**Загальна характеристика:**

**міжнародна та хімічна назви:** lovastatin;

2-метил-1,2,3,7,8,8а-гексагідро-3,7-диметил-8-[2-(тетрагідро-4-гідрокси-6-оксо-2Н-піран-2-іл)-етил]-1-нафталанілової ефір бутанової кислоти, 1S-1(R),3R,7R,8(2S,4S),8R;

**основні фізико-хімічні властивості:** таблетки білого або білого з кремуватим відтінком кольору, з плоскою поверхнею та фаскою;

**склад:** 1 таблетка містить ловастатину в перерахунку на 100 % речовину 0,02 г;

**допоміжні речовини:** крохмаль картопляний, гранулак-70, полівінілпіролідон низькомолекулярний медичний, аеросил, кальцію стеарат або магнію стеарат.

**Форма випуску.** Таблетки.

**Фармакотерапевтична група.** Гіполіпідемічні засоби. Код АТС С10А А02.

**Фармакологічні властивості.** *Фармакодинаміка.* Ловастатин належить до гіполіпідемічних засобів, виділений із культури *Aspergillus terreus*. Гальмує початкові стадії біосинтезу холестерину в печінці. Після прийому внутрішньо ловастатин, як неактивний лактон, гідролізується до бета-гідроксикислоти (активна форма ловастатину), яка специфічно блокує 3-гідрокси-3-метилглутарил-коензимА (ГМГ-КоА) редуктазу, фермент, що каталізує перетворення ГМГ-КоА у мевалонат, що дозволяє блокувати біосинтез холестерину на початковій стадії. Приводить до зниження в крові концентрації загального холестерину, ліпопротеїдів низької щільності (ЛПНЩ), в дещо меншій мірі - тригліцеридів і ліпопротеїдів дуже низької щільності (ЛПДНЩ), аполіпопротеїну В. Разом з тим дещо підвищує вміст антиатерогенних ліпопротеїдів високої щільності (ЛПВЩ). Малотоксичний.

*Фармакокінетика.* При прийомі внутрішньо ловастатин із травного тракту всмоктується повільно і не повністю (близько 30 % прийнятої дози), прийом натще знижує абсорбцію на 30 %. Максимальна концентрація досягається через 2 години, але потім рівень у плазмі швидко знижується і становить через 24 години 10 % від максимуму. Як ловастатин, так і його бета-гідроксикислотний метаболіт у загальному судинному руслі циркулюють у зв'язанні з білками плазми формі (близько 95 %). Стабільна рівноважна концентрація ловастатину (і його активних похідних) при застосуванні 1 раз на добу на ніч (холестерин синтезується здебільшого уночі) досягається на 2 - 3-й день терапії та в 1,5 рази перевищує створену одноразовою дозою. Проникає крізь ГЕБ та плацентарний бар'єр, накопичується у печінці, де окислюється до метаболітів, частина із яких зберігає активність. Ловастатин здебільшого виділяється з жовчю. Близько 85 % дози виводиться з калом і лише 10 % - з сечею. Виразений гіполіпідемічний ефект розвивається через 2 тижні, максимальний - протягом 4 - 6 тижнів.

**Показання для застосування.** Гіперхолестеринемія:

- первинна з високим вмістом ЛПНЩ (типи Іа і Іб) за відсутністю ефекту від дієтотерапії;

- комбінована з гіпертригліцеридемією (гіперліпопротеїнемія типу Іб).

Атеросклероз (для уповільнення прогресування коронарного атеросклерозу у пацієнтів з ІХС та гіперхолестеринемією). Існують попередні дані про застосування Ловастатину для корекції рівня холестерину в крові у хворих, які перенесли операції на магістральних судинах.

**Спосіб застосування та дози.** Ловастатин призначають при легких формах гіперхолестеринемії внутрішньо по 1 таблетці (20 мг) 1 раз на добу увечері (під час їди), при атеросклерозі - по 1 - 2 таблетки (20 - 40 мг). Максимальна добова доза - 80 мг в 1 - 2 прийоми (під час сніданку та вечері). У випадку зниження концентрації холестерину в плазмі до 140 мг/100 мл (3,6 моль/л) дозу Ловастатину слід зменшити. При недостатній дієвості препарату дозу збільшують (з інтервалами не менше 4 тижнів) до 40 - 80 мг в 1 або 2 прийоми - під час сніданку та вечері.

**Побічна дія.** Можливі: нудота, блювання, втрата апетиту, біль у животі, запори, метеоризм, сухість у роті, розлад смаку, підвищення рівня трансаминаз у крові, транзиторне підвищення вмісту креатинфосфокінази, запаморочення, головний біль, безсоння, судоми, психічні розлади, парестезії, кропивниця, набряк Квінке. Дуже рідкі - міопатії, гепатит. У деяких пацієнтів може відмічатися помутніння кришталіка, хоча чіткого причинно-наслідкового зв'язку з прийомом препарату не виявлено.

**Протипоказання.** Підвищена чутливість до препарату, виражена печінкова недостатність, порушення функції нирок, стійке підвищення рівня трансаминаз у плазмі крові, вагітність, годування груддю (на час лікування припиняють).

**Передозування.** Тривалий прийом препарату посилює імовірність прояву побічних дій.

При появі болю в м'язах або слабкості, особливо на фоні пропасниці, необхідно припинити прийом препарату.

**Особливості застосування.** Дітям препарат не призначають. Під час лікування пацієнти повинні перебувати на стандартній дієті з низьким вмістом холестерину. З обережністю застосовують Ловастатин для лікування пацієнтів з захворюваннями печінки в анамнезі, а також при хронічному алкоголізмі. У процесі лікування Ловастатином необхідно періодично перевіряти рівень холестерину в крові та проводити печінкові тести. У випадку стійкого підвищення вмісту в крові печінкових трансаминаз та/або креатинфосфокінази показана відміна препарату. Терапія Ловастатином повинна бути перервана на тривалий час або припинена при загальному тяжкому стані пацієнта внаслідок якого-небудь захворювання. При одночасному призначенні Ловастатину та імуносупресорів добова доза Ловастатину не повинна перевищувати 20 мг.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами.** Холестирамін і жовчні кислоти посилюють гіполіпідемічний ефект Ловастатину. Фібрати, ніоцин, ітраконазол та інші протигрибкові засоби групи азолів, еритромицин, циклоспорин, гемфіброзил, нікотинова кислота - збільшують ризик розвитку міопатій (інколи мали місце випадки рабдоміолізу з подальшим розвитком гострої ниркової недостатності). Циклоспорин підвищує плазмовий рівень активних метаболітів препарату. Ловастатин не виявляє впливу на концентрацію дигоксину в плазмі крові. Не відмічено значущих клінічних взаємодій з блокаторами  $\alpha$ -адренорецепторів.

**Умови та термін зберігання.** Зберігати в сухому, прохолодному, захищеному від світла місці. Термін зберігання - 1 рік.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

**Умови відпуску.** За рецептом.

**Упаковка.** По 10 таблеток в контурній чарунковій упаковці, 3 контурні чарункові упаковки в паці.

**Виробник.** ВАТ "Київмедпрепарат".

**Адреса.** 01032, Україна, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.