

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

УТВЕРЖДАЮ

И. В. Руководитель Департамента
государственного контроля
лекарственных средств и
медицинской техники МЗ РФ

ОДОБРЕНО

Фармакологическим комитетом
МЗ РФ

Протокол № 46

И. А. Топорков
« 17 » *ноября* 2003 г.

« 19 » *июня* 2003 г.

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ПРАВАСТАТИН

Регистрационный номер: Р N 003029/01

Торговое название препарата: Правастатин

Международное непатентованное название: правастатин

Лекарственная форма: таблетки

Состав

1 таблетка содержит активного вещества правастатина натрия 0,010 г или 0,020 г.

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, сахар молочный, аэросил, магния окись, Коллидон CL - М или Коллидон CL, кальций стеарат.

Описание

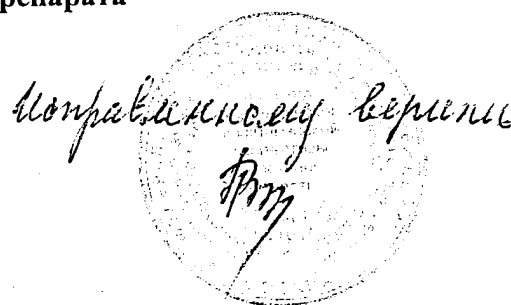
Таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрической формы с фаской.

Фармакотерапевтическая группа: Гиполипидемическое средство

Код АТХ: [C10AA03]

Фармакологическое действие

Правастатин - относится к классу статинов (ингибиторов 3-гидрокси-3-метилглутарил-коэнзим А-редуктазы (ГМГ-КоА-редуктазы) - ключевого фермента эндогенного биосинтеза холестерина, обратимое ингибирование активности которого приводит к подавлению синтеза холестерина на стадии мевалоновой кислоты и умеренному снижению его внутриклеточного содержания. Правастатин компенсаторно увеличивает количество рецепторов липопротеидов низкой плотности (ЛПНП) на поверхности клетки, повышает катаболизм холестерина ЛПНП, осуществляемого через рецепторы, увеличивает выведение ЛПНП, находящихся в кровеносном русле. Угнетает синтез в печени липопротеидов очень низкой плотности (ЛПОНП), которые являются предшественниками ЛПНП; несколько увеличивает содержание в крови липопротеидов высокой плотности (ЛПВП), обладающих антиатерогенными свойствами; снижает содержание общего холестерина и триглицеридов. Обладает тканевой селективностью: его подавляющая активность наиболее выражена в тех тканях, где синтез холестерина осуществляется с максимальной скоростью, в частности, в печени, подвздошной кишке.



В отличие от др. ингибиторов ГМГ-КоА-редуктазы, меньше влияет на синтез холестерина в других тканях.

Фармакокинетика

Абсорбция - быстрая (30-54% от введенной дозы), биодоступность составляет 15-20% (за счет эффекта "первого прохождения" через печень). Прием за 1 час до еды или вместе с пищей снижает системную биодоступность и специфическую активность. Концентрация правастатина в плазме крови прямо пропорциональна введенной дозе. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1-1.5 ч. Связь с белками плазмы крови - 50%. Проникает в грудное молоко. Метаболизируется несколькими путями: изомеризация до 6-эпиправастатина и 3-гидроксиизомера, ферментативное гидроксилирование кольца и последующее окисление до кетона, окисление эфирного или карбоксильного концов цепи, конъюгация. Основные продукты метаболизма - 3-гидроксиизомеры - обладают специфической активностью, которая составляет от 1/14 до 1/10 от первоначальной. Период полувыведения составляет - 1.3-2.7 ч.

Выводится почками - 20%, через кишечник - 70%. 47% от величины общего клиренса приходится на почки и 53% - на экстрапочечные пути (например, за счет выделения через желчь и биотрансформацию). В связи с наличием 2 путей выведения, возможно компенсаторное усиление выведения по одному из них при нарушении другого, а также развитие кумуляции правастатина и его метаболитов при почечной и/или печеночной недостаточности.

Показания к применению

- Гиперхолестеринемия (первичная гиперлипидемия IIa и IIb типа, за исключением семейной гомозиготной) (при неэффективности диетотерапии у пациентов с повышенным риском возникновения коронарного атеросклероза);

- первичная гиперхолестеринемия в сочетании с гипертриглицеридемией.

Противопоказания

Повышенная чувствительность, острые заболевания или обострения хронических заболеваний печени, печеночная недостаточность; стойкое изменение функциональных проб печени неясной этиологии; беременность, период лактации, возраст до 18 лет (безопасность и эффективность применения не установлены).

С осторожностью применяют при алкоголизме, после трансплантации органов, при иммунодепрессивной терапии и почечной недостаточности, заболеваниях печени в анамнезе.

Способ применения и дозы

Правастатин

Перед началом терапии препаратом больному следует назначить стандартную диету для снижения уровня холестерина. Во время лечения препаратом данную диету необходимо соблюдать.

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи в начальной дозе - 10-20 мг однократно, перед сном. При значительном повышении концентрации холестерина в плазме (более 300 мг/дл) начальную дозу увеличивают до 40 мг 1 раз в сутки. Максимальный терапевтический эффект развивается в течение 4 недель от начала лечения, этот период возможна коррекция дозы в зависимости от динамики концентрации липидов в плазме крови.

Больным, принимающим одновременно циклоспорин в сочетании с другим иммунодепрессантами лечение начинают с дозы 10 мг с постепенным увеличением. Максимальная доза составляет 20 мг.

Нотариальному верен



При печеночной или почечной недостаточности начальная доза не должна превышать 10 мг. Для пожилых пациентов обычно эффективной является доза 20 мг/сутки.

Побочное действие

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, дисфункция черепномозговых нервов (нарушение вкусового восприятия, произвольные движения глаз, парез лицевого нерва), периферическая полинейропатия, тремор, тревожность, бессонница (редко), депрессия, амнезия, парестезии.

Со стороны органов чувств: офтальмоплегия, прогрессирование катаракты.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, снижение аппетита, гастралгия, диарея или запоры, метеоризм, гепатит (в т.ч. хронический активный и холестатический), жировая инфильтрация печени, цирроз или некроз печени, гепатома, повышение активности "печеночных" трансаминаз (в 2-3 раза по сравнению с нормой) и щелочной фосфатазы, гипербилирубинемия, гиперкреатининемия (в 3 раза по отношению к верхней границе нормы), теоретически возможен – острый панкреатит.

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения, гемолитическая анемия, эозинофилия.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: миалгия, миопатия, миозит, рабдомиолиз.

Со стороны мочеполовой системы: редко снижение либидо и потенции.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, волчаночноподобный синдром, анафилактический шок, ангионевротический отек, дерматомиозит, васкулит, пурпура, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), многоформная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона).

Со стороны кожных покровов: алоpecia, депигментация кожи, фотосенсибилизация, сухость кожи и слизистых оболочек.

Лабораторные показатели: повышение активности креатинфосфокиназы, миоглобинурия.

Прочие: гинекомастия, сердцебиение, нарушение дыхания, почечная недостаточность (вследствие рабдомиолиза).

Передозировка

Симптомы: изменения биохимического анализа крови. *Лечение:* симптоматическое.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Увеличивает эффект непрямых антикоагулянтов и риск возникновения кровотечения.

При одновременном назначении с ацетилсалициловой кислотой, антацидами, циметидином, гемфибросилом, никотиновой кислотой и пробуколом биодоступность этих препаратов не изменяется. Совместим с диуретиками, гипотензивными средствами, препаратами дигиталиса, ингибиторами АПФ, блокаторами "медленных" кальциевых каналов, бета-адренорецепторами, нитратами.

Фибраты, циклослорин, эритромицин, никотиновая кислота увеличивает риск развития миопатии; гемфибросил повышает концентрацию креатинфосфокиназы в плазме и риск развития побочных эффектов со стороны опорно-двигательного аппарата.



Анионообменные смолы (колестирамин, колестипол) уменьшают AUC на 40-50% (правастатин следует назначать за 1 ч до или через 4 ч после приема указанных препаратов).

Особые указания

Перед началом и во время лечения необходимо соблюдать диету, способствующую понижению содержания холестерина в плазме.

Перед назначением необходимо исключить вторичные гиперхолестеринемии, в частности, при плохо компенсированном сахарном диабете, гипотиреозе, нефротическом синдроме, диспротеинемии.

В период лечения необходимо контролировать содержание трансаминаз в сыворотке крови. В случаях, когда наблюдается стабильное превышение активности "печеночных" трансаминаз по отношению к верхней границе нормы в 3 раза и более, лечение следует прекратить.

При возникновении в период лечения миалгии, слабости мышц и/или значительного увеличения креатинфосфокиназы, следует учитывать возможность развития миопатии. В таких случаях препарат отменяют.

У больных, получающих иммунодепрессивные препараты (циклоsporин), обязателен мониторинг уровня креатинфосфокиназы и симптомов рабдомиолиза.

В случае пропуска текущей дозы препарат необходимо принять как можно скорее. Если наступило время следующей дозы, дозу не удваивать.

Форма выпуска

Таблетки по 10 мг и 20мг. По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке.

По 2,3,5 или 10 контурных упаковок вместе с инструкцией по применению в пачку из картона.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

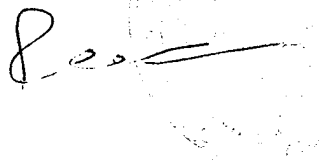
Срок годности

2 года. Не использовать позже даты, указанной на упаковке.

Условия отпуска из аптек
по рецепту

Производитель: ОАО «Щелковский витаминный завод»,
141100 Щелково-1, Московская область, ул. Фабричная,2.
Тел. (095) 933-48-62, факс (095) 933-48-63.

Директор ИДКЭЛС, профессор



В.В. Чельцов

Генеральный директор ОАО
«Щелковский витаминный завод»

