

Първият български лекарствен продукт от групата на статините, понастоящем считани за най-ефективно понижаващи нивото на серумния холестерол медикаменти - Lipopres®

Проф. Атанас Киряков
Българска липидна лига

Lipopres® (Lovastatin) е първият висококачествен български статин, производство на "Балканфарма". Предлага се в опаковки от 20 mg x 30 tabl. и 40 mg x 30 tabl.

Lipopres® е показан при лечение на първична хиперхолестеролемия (тип IIa и IIb), при високи нива на общия холестерол (ОХОЛ) и на LDL-холестерола (ХОЛ-ЛНП) в случаите на недостатъчен отговор към диетолечението, както и при ИБС за забавяне на прогресията на коронарната атеросклероза чрез понижаване на нивата на ХОЛ-ЛНП, като част от комплексното лечение. Началната дневна доза е 20 mg, приемана еднократно по време на вечерното хранене. При лека до умерена хиперхолестеролемия лечението може да започне с 10 mg дневно. За лечение на ИБС дозата е 20-80 mg дневно, приети еднократно или разпределени в 2 приема. Максималната дневна доза е 80 mg. Коригиране на дозата се прави през интервал, не по-малък от 4 седмици. Дозата на Lipopres® трябва да се намали, ако нивото на ХОЛ-ЛНП е по-голямо от 75 mg/dL (1.94 mmol/l) или ако нивото на ОХОЛ е по-голямо от 140 mg/dL (3.6 mmol/l). По време на лечението с Lipopres® пациентите трябва да спазват понижаваща холестероловото ниво диета. Еднократният прием вечер е с по-голяма ефективност, отколкото сутрешния прием на същата доза, тъй като синтеза на холестерола е по-активен през нощта.

Не е необходима корекция на дозата при пациенти с умерена степен на бъбречна недостатъчност, тъй като lovastatin не се подлага на значителна ренална екскреция. При пациенти с тежка бъбречна недостатъчност (креатининов клирънс по-малък от 30 ml/min) прилагането му трябва да бъде внимателно.

Фармакодинамични свойства

Lipopres® е понижаващ нивото на холестерола лекарствен продукт. Lovastatin действа чрез инхибиране на 3-хидрокси-3-метил-глутарил-коензим А (HMG-CoA)-редуктазата – ензим, който контролира началния стадий на биосинтетичния път на холестерола. Lovastatin е неактивен лактон, който се хидролизира до бета-хидрокси-киселина. Той е главният активен метаболит, инхибиращ синтеза на HMG-CoA-редуктазата, скоростоопределящият ензим в синтетичния път на холестерола. Lovastatin намалява нивата на ОХОЛ, ХОЛ-ЛНП и плазмените триглицериди и умерено повишава нивото на HDL-холестерола (ХОЛ-ЛВП). Lovastatin понижава преди всичко съотношенията ОХОЛ/ХОЛ-ЛВП и ХОЛ-ЛНП/ХОЛ-ЛВП.

Изразен ефект се установява 2 седмици след началото на приема на lovastatin, а максимален терапевтичен отговор се постига за 4-6 седмици. Този ефект се запазва по време на лечението. След прекратяване на терапията с lovastatin нивото на общия холестерол се връща към изходната си стойност, установена преди началото на лечението. Превръщането на HMG-CoA до мевалонат е ранно стъпало в биосинтезата на холестерола, затова се предполага, че терапията с lovastatin няма да доведе до натрупването на потенциално токсични стероли. Освен това HMG-CoA лесно се метаболизира обратно до ацетил-CoA, който участва в много биосинтетични процеси в организма.

Фармакокинетични свойства

След перорално приложение на маркиран с радиоактивен въглерод lovastatin, максималните плазмени концентрации се достигат след 2-4 часа и намаляват бързо през следващите 24 часа до около 10% от максималните си стойности. Steady-state концентрациите се достигат след 2-3 дневно приложение.

След перорален прием lovastatin показва висока селективност към черния дроб, където достига по-високи концентрации в сравнение с останалите органи. Метаболизира се в голяма степен при първото си преминаване през черния дроб, където е първичното място на неговото действие, с последваща екскреция на продукта чрез жлъчката.

Lipopres® трябва да се приема едновременно с храна, при които се достигат по-високи плазмени концентрации, отколкото при прием на гладно.

След перорално приложение на lovastatin около 10% от дозата се екскретира с урината и около 83% - с фекалиите.

Lovastatin и неговият основен метаболит – бета-хидрокси-киселина, се свързват в значителна степен с плазмените протеини (над 95%). Lovastatin преминава през кръвно-мозъчната и плацентарната бариера.

Противопоказания

Свръхчувствителност към някои от компонентите на препарата; активно чернодробно заболяване или персистиращи повишени стойности на трансаминазите; бременност и кърмене.

Проведено е изследване за оценка на биоеквивалентността на Lipopres®, което удовлетворява статистическия критерий.