

ROSULIP®

ROSUVASTATINA

HIPOCOLESTEROLEMIANTE

COMPRIMIDOS RECUBIERTOS
VIA DE ADMINISTRACION: ORAL

FORMULA:

ROSULIP 5: Cada comprimido recubierto contiene:

Rosuvastatina Cálcica equivalente a Rosuvastatina Base.....	5 mg
Excipientes.....	c.s.

ROSULIP 10: Cada comprimido recubierto contiene:

Rosuvastatina Cálcica equivalente a Rosuvastatina Base.....	10 mg
Excipientes.....	c.s.

ROSULIP 20: Cada comprimido recubierto contiene:

Rosuvastatina (equiv. a 22,87 mg de Rosuvastatina Cálcica).....	20 mg
Excipientes.....	c.s.

ROSULIP 40: Cada comprimido recubierto contiene:

Rosuvastatina Cálcica equivalente a Rosuvastatina Base.....	40 mg
Excipientes.....	c.s.

ACCION TERAPEUTICA:

Hipocolesterolemiante.

Pertenece a la familia de las estatinas (lovastatina, simvastatina, pravastatina, atorvastatina, etc.) y como ellas actúa como un inhibidor competitivo y selectivo de la enzima HMG-CoA reductasa que cataliza la conversión de la coenzima A 3-hidroxi-3-metilglutaril en mevalonato, un precursor del colesterol. Los triglicéridos (TG) y el colesterol en el hígado se incorporan a la apolipoproteína B (ApoB) para formar la lipoproteína de muy baja densidad (VLDL), la cual se libera al torrente sanguíneo y se distribuye a los tejidos periféricos. A su vez, la lipoproteína de baja densidad (LDL) rica en colesterol se forma a partir de la VLDL y es depurada principalmente en el hígado a través de su receptor de alta afinidad. La rosuvastatina aumenta el número de receptores hepáticos de LDL, produciendo un aumento de la captación y del catabolismo de LDL e inhibe la síntesis hepática de VLDL, reduciendo el número total de partículas de VLDL y LDL. Además, aumenta la cantidad de lipoproteína de alta densidad (HDL), la cual contiene ApoA-I, y dicha fracción está involucrada, entre otras cosas, en el transporte de colesterol desde los tejidos de regreso al hígado (transporte inverso de colesterol). Estudios clínicos han demostrado que reduce la LDL-C elevada, ApoB, no HDL-C, VLDL-C, VLDL-TG colesterol y TG totales y aumenta la HDL-C y la ApoA-I. Además, disminuye los índices LDL-C/HDL-C, C-total /HDL-C, no HDL-C/HDL-C y ApoB/ApoA-I. Rosuvastatina se absorbe por vía digestiva y presenta una biodisponibilidad del 20 % debido al efecto de primer paso en el hígado, sitio primario de la síntesis del colesterol y depuración de LDL-C. Acanza su máxima concentración plasmática luego de las 5 h de su administración y se acumula mínimamente con la administración repetida. Rosuvastatina se une aproximadamente 90 % a las proteínas plasmáticas, principalmente a la albúmina. El compuesto sin modificaciones representa más del 90 % de la actividad inhibidora de la HMG CoA reductasa circulante. Sufre un metabolismo limitado (aproximadamente 10 %), transformándose principalmente en la forma N-desmetilada. Su eliminación sin modificar se realiza en un 90 % por heces y el resto es excretado en la orina.

INDICACIONES:

Hipercolesterolemia primaria, dislipidemia mixta e hipertrigliceridemia aislada, incluyendo Fredrickson Tipo IIa, IIb y IV; e hipercolesterolemia familiar heterocigota, como un coadyuvante cuando sea inadecuada la respuesta a la dieta y el ejercicio. Hipercolesterolemia familiar homocigota, ya sea solo o como coadyuvante en la dieta y otros tratamientos para reducción de lípidos, tal como aféresis de LDL.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad conocida a la droga, enfermedad hepática activa, embarazo, lactancia y en mujeres con potencial de concebir que no utilicen medidas anticonceptivas adecuadas.

REACCIONES ADVERSAS / EFECTOS COLATERALES:

Las principales son: cefalea, mialgia, astenia, estreñimiento, mareo, náusea, dolor abdominal. Menos frecuentemente se observa miopatía y rabdomiolisis. Al igual que con otros inhibidores de la HMG CoA reductasa, la incidencia de reacciones medicamentosas adversas tiende a aumentar con dosis mayores. Los datos preclínicos no revelan riesgos especiales para humanos basados en estudios de toxicidad con dosis repetidas, toxicidad genética, potencial carcinogénico y embriotóxico.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Se recomienda administrar con precaución en pacientes que consuman cantidades excesivas de alcohol y/o que tengan una historia de enfermedad hepática. Al igual que otros inhibidores de HMG-CoA, puede producir molestias en el músculo esquelético, como mialgia no complicada y miopatía. Por ello, se aconseja determinar los niveles de creatin-quinasa (CK) en aquellos pacientes que desarrollen cualquier signo o síntoma sugerente de miopatía y discontinuar su administración si los niveles de CK son considerablemente elevados (> 10 x ULN) o si se diagnostica o sospecha miopatía. Se recomienda administrar con precaución rosuvastatina junto con ciclosporina y derivados de ácido fibrótico, incluyendo gemfibrozilo, ácido nicotínico, antimicóticos azoles y antibióticos macrólidos ya que se ha observado mayor incidencia de miositis y miopatía en pacientes que han recibido concomitantemente dichas drogas con otros inhibidores de HMG-CoA reductasa.

Se aconseja suspender temporalmente su administración en pacientes con miopatía o con predisposición a desarrollar insuficiencia renal secundaria a rabdomiólisis con dosis superiores a 20 mg, tales como sepsis, hipertensión, cirugía mayor, traumatismos, trastornos metabólicos graves, alteraciones endocrinas y electrolíticas o convulsiones no controladas. No administrar a mujeres durante el embarazo y la lactancia. Las mujeres con potencial de concebir deben utilizar medidas anticonceptivas adecuadas.

Este medicamento contiene Lactosa. Los pacientes con intolerancia hereditaria a la galactosa, insuficiencia a la lactosa del APP insuficiencia observada en ciertas poblaciones de laponia o mala absorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.

INTERACCIONES:

Su coadministración con warfarina puede ocasionar un aumento en International Normalized Ranges (INR) referido a los tiempos de coagulación, en comparación con warfarina sola. En pacientes que reciben antagonistas de la vitamina K se recomienda el monitoreo de INR, tanto al inicio como al término de la terapia con rosuvastatina o después de un ajuste de la dosis. Su coadministración con ciclosporina aumenta considerablemente la concentración plasmática de rosuvastatina. No se recomienda la administración conjunta de estas drogas. El uso concomitante con gemfibrozilo aumenta la concentración plasmática máxima y el ABC (0 - t) de rosuvastatina, por lo que se aconseja iniciar el tratamiento con una dosis inicial de 10 mg por día y no exceder de 20 mg diarios. La administración simultánea con una suspensión antiácida que contiene hidróxido de aluminio y de magnesio produce una disminución de aproximadamente 50 % en la concentración plasmática de rosuvastatina. Este efecto se reduce cuando el antiácido se administra 2 horas después del hipolipemiante.

Estudios *in vitro* e *in vivo* indican que la rosuvastatina no tiene interacciones del citocromo P450 clínicamente significativas. No hubo interacciones clínicamente significativas con anticonceptivos orales, digoxina o fenofibrato, drogas antihipertensivas, anti diabéticos y terapia de reemplazo hormonal.

Gemfibrozilo y otros medicamentos reductores del colesterol: la administración concomitante de rosuvastatina y gemfibrozilo duplicó la Cmax y el ABC de la rosuvastatina.

De acuerdo con los resultados de los estudios de interacción específica no se espera ninguna interacción farmacocinética significativa con el fenofibrato, sin embargo, sí podría darse una interacción farmacodinámica.

El gemfibrozilo, fenofibrato, bezafibrato y otros fibratos y dosis reductoras de lípidos (mayores o iguales a 1g/día) de niacina (ácido nicotínico), aumentan el riesgo de miopatía cuando se administran de forma concomitante con inhibidores de la HMG-CoA reductasa, probablemente debido a que pueden provocar miopatía cuando se administran solos. La dosis de 40 mg está contraindicada con el uso concomitante con fibratos.

POSOLOGIA:

Dosis usual: vía oral 10 – 40 mg una vez al día, en cualquier hora del día con o sin alimento. La dosificación debe individualizarse de acuerdo con la patología y la respuesta del paciente. La mayoría se controla con la dosis inicial sin embargo si es necesario puede hacerse ajuste de la dosis después de 2 semanas. Hipercolesterolemia primaria (incluyendo hipercolesterolemia familiar heterocigótica) dislipidemias mixta e hipertiglicidemia familiar heterocigótica) dislipidemias mixtas e hipertiglicidemia aislada: dosis inicial recomendada 10 mg una vez al día. Hipercolesterolemia severa (incluyendo hipercolesterolemia familiar heterocigótica) dosis inicial recomendada 20 mg una vez al día. Hipercolesterolemia familiar homocigótica dosis inicial recomendada: 20 mg una vez al día. Pacientes con insuficiencia renal severa la dosis no debe exceder de 10 mg al día.

SOBREDOSIS (SIGNOS, SÍNTOMAS, CONDUCTA Y TRATAMIENTO):

No existe un tratamiento específico en caso de sobredosis. En este caso, el paciente debería ser tratado sintomáticamente y se instaurarán las medidas de soporte necesarias. Se deberían monitorear la función hepática y los niveles de CK. No se sugiere realizar hemodiálisis.

Tratamiento orientativo inicial de la sobredosificación: luego de la cuidadosa evaluación clínica del paciente, de la valorización del tiempo transcurrido desde la ingesta o administración, de la cantidad de medicación ingerida y descartando la contraindicación de ciertos procedimientos, el profesional decidirá la realización o no del tratamiento general de rescate: vómito provocado o lavado gástrico, carbón activado, purgante salino, etc.

RECOMENDACION:

En caso de sobredosis recurrir al Centro Nacional de Toxicología en el Centro de Emergencias Médicas Av. Gral. Santos y Teodoro S. Mongelos - Tel. 204800

PRESENTACION:

ROSULIP 5: Caja x 30 comprimidos recubiertos.
ROSULIP 10: Caja x 30 y 100 comprimidos recubiertos.
ROSULIP 20: Caja x 30 y 100 comprimidos recubiertos.
ROSULIP 40: Caja x 30 comprimidos recubiertos.

Venta Bajo Receta

Mantener a temperatura ambiente (15 °C a 30 °C). Conservar en lugar seco.
Elaborado por Laboratorios Catedral de Scavone Hnos. S.A. - Acceso Norte.
Planta Industrial: Vía Férrea esq. Cándido Vasconellos - Asunción - Paraguay
Director Técnico: Farm. Jaime Cristófol - Reg. Prof. N° 2.719
SCAVONE HNOS. S.A.
Santa Ana N° 431 c/ Avda. España.
Director Técnico: Q.F. Amílcar Sena - Reg. Prof. N° 4.885
Todo medicamento debe ser mantenido fuera del alcance de los niños.