

Rapiscal®

Simvastatina 20 mg / 40 mg

Tabletas recubiertas



COMPOSICIÓN:	Rapiscal® Tabletas recubiertas	Rapiscal® Tabletas recubiertas
Simvastatina	20 mg	40 mg
Excipientes, c.s.p.	1 Tableta	1 Tableta

DESCRIPCIÓN:

Rapiscal® contiene simvastatina un fármaco de la familia de las estatinas utilizado para disminuir los niveles de colesterol en sangre.

INDICACIONES:

- Hipercolesterolemia.
- Hipercolesterolemia primaria o dislipidemia mixta.
- Hipercolesterolemia familiar homocigota.
- Prevención cardiovascular.
- Reducción de la morbimortalidad cardiovascular en pacientes con enfermedad cardiovascular aterosclerótica.
- Reducción de la morbimortalidad cardiovascular en pacientes con diabetes mellitus, con niveles de colesterol normal o elevado.
- Tratamiento complementario a la corrección de otros factores de riesgo y otros tratamientos cardioprotectores.

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:

Absorción: la simvastatina es una lactona inactiva que se absorbe en el tracto gastrointestinal, transformándose rápidamente por hidrólisis en el metabolito activo β -hidroxiácido correspondiente, el cual es un potente inhibidor de la reductasa de la 3-hidroxi-3-metilglutaril-coenzima A (HMG-CoA), enzima que cataliza el primer paso en la biosíntesis de colesterol, así como en otros metabolitos activos e inactivos. Sufre un amplio metabolismo de primer paso en el hígado, su principal sitio de acción.

Distribución: tanto la simvastatina como su principal metabolito activo, se unen en 95% a las proteínas plasmáticas. Se ha calculado que la disponibilidad del metabolito activo principal en la circulación sistémica es menor de 5% de la dosis oral administrada, debido principalmente a su amplio metabolismo en el hígado.

Eliminación: al administrar 100 mg de simvastatina marcada con C14, se recuperó 13% de la radiactividad en la orina y 60% en las heces, esta última cantidad representa la suma del medicamento absorbido, y posteriormente, excretado con la bilis y el medicamento no absorbido. Menos de 0.5% de la dosis administrada se recuperó en la orina en forma de metabolito principal activo. La simvastatina es inhibidora específica de la HMG-CoA reductasa, enzima que cataliza la conversión de HMG-CoA reductasa en mevalonato. En dosis terapéuticas, la simvastatina no bloquea completamente la enzima, por lo que se sigue produciendo cantidades biológicamente necesarias de mevalonato. Dado que la conversión de HMG-CoA en mevalonato es un paso temprano en el proceso de biosíntesis del colesterol, el tratamiento con simvastatina no causa una acumulación de esteroleos potencialmente tóxicos. El HMG-CoA se vuelve a transformar rápidamente en acetil-CoA, el cual participa en muchos procesos anabólicos del organismo.

REACCIONES ADVERSAS:

En general la simvastatina es bien tolerada. En estudios clínicos controlados, menos de 2% de los pacientes tuvieron que suspender el tratamiento por efectos adversos significativos. Los efectos secundarios que se observaron con una frecuencia de 1% o mayor fueron flatulencia, dolor abdominal y estreñimiento, y los observados entre 0.5 y 0.9% de los pacientes fueron cefaleas y astenia. La miopatía se observó en casos muy raros. Los efectos secundarios reportados más frecuentemente en la fase de poslanzamiento han sido, náuseas, diarrea, dispepsia, prurito, erupción cutánea, alopecia, mareo, mialgia, calambres musculares, pancreatitis, parestesias, neuropatía periférica, anemia y vómitos. Se han presentado casos raros de rabdomiólisis y de hepatitis con ictericia. También se han observado casos raros de aparente hipersensibilidad con edema angioneurótico, síndrome semejante al lupus, vasculitis, polimialgia reumática, artritis, artralgia, eosinofilia, trombocitopenia, aumento de la velocidad de sedimentación globular, fotosensibilidad, urticaria, fiebre, disnea y malestar general.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

La simvastatina puede provocar en ocasiones miopatía con dolor y/o debilidad muscular asociados a un incremento importante de la creatinofosfocinasa (CPK), superior a diez veces el límite superior normal. Rara vez se ha observado la aparición de rabdomiólisis con o sin insuficiencia renal aguda secundaria a mioglobinuria. La simvastatina debe usarse con precaución en pacientes con antecedentes de enfermedad hepática y/o que consumen importantes cantidades de alcohol. Es recomendable hacer pruebas de funcionamiento hepático a todos los pacientes antes de iniciar el tratamiento y cada seis meses, durante el primer año y cada año después de un ajuste de la dosis. Si los pacientes llegan a tomar dosis de 80 mg diarios, hay que hacer los estudios al tercer mes después de iniciar dicha dosis. Si se observa aumento

en las cifras de transaminasas séricas, hay que repetir los estudios al poco tiempo y más frecuentemente que lo indicado. Si siguen aumentando las transaminasas y alcanzan el triple del límite superior normal o se mantienen altas de forma persistente, debe suspenderse la administración de simvastatina.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula, enfermedad hepática activa o aumento persistente e inexplicable de las cifras de transaminasas séricas. Embarazo y lactancia.

INTERACCIONES:

El gemfibrozilo y otros fibratos, así como el ácido nicotínico en altas dosis, incrementan el riesgo de miopatía. Debido a que la simvastatina es un sustrato para la isoforma 3A4 del citocromo P-450, los inhibidores potentes de la citada isoforma, pueden aumentar el riesgo de miopatía, al incrementar los niveles plasmáticos del principal metabolito activo de simvastatina. Estos medicamentos inhibidores son, la ciclosporina, ketoconazol e itraconazol, eritromicina y claritromicina, los inhibidores de la proteasa del VIH y la nefazodona. El jugo de toronja también inhibe a la mencionada isoforma del citocromo P-450 y si bien el consumo de un vaso diario de 250 mL incrementa apenas en 13% la actividad plasmática del metabolito principal, cantidades superiores al litro diario, pueden aumentar mucho la actividad plasmática e incrementa los efectos secundarios, por lo que deberá evitarse su consumo. En algunos estudios clínicos controlados se ha evidenciado que dosis de 20 a 40 mg de simvastatina han potenciado ligeramente el efecto de los anticoagulantes cumarínicos, de ahí que en pacientes que los estén tomando, deba determinarse el tiempo de protrombina antes de iniciar la administración de simvastatina, y periódicamente durante los primeros meses de tratamiento, para detectar oportunamente cualquier alargamiento del tiempo de protrombina.

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:

La simvastatina está contraindicada en el embarazo, debido a que los inhibidores de la reductasa de la HMG-CoA disminuyen la biosíntesis del colesterol y de otras sustancias, esenciales para el desarrollo fetal. Si alguna paciente se embaraza, debe suspenderse de inmediato la administración del medicamento e informar a la paciente sobre el potencial peligro para el feto. Aunque la seguridad de simvastatina no ha sido bien establecida en mujeres embarazadas, existen algunos reportes de anomalías congénitas en recién nacidos de madres tratadas con este principio activo. Debido a que no se sabe si la simvastatina o sus metabolitos son excretados con la leche materna, las madres que están recibiendo simvastatina deben suspender la lactancia.

SOBREDOSIFICACIÓN Y TRATAMIENTO:

Se han comunicado algunos casos de sobredosificación que cursaron sin síntomas particulares y que se recuperaron sin secuelas. La dosis máxima ingerida ha sido de 450 mg. No existe un tratamiento específico, y se deben aplicar medidas generales.

DOSIFICACIÓN Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Vía de administración: oral.

Adultos:

Dosis única: 5-80 mg/día (noche). Ajustar dosis a intervalos de 4 semanas; Dosis máxima 80 mg/día (noche).

Hipercolesterolemia primaria: inicio: 10-20 mg/día (noche). Si se requiere mayor reducción del C-LDL (más del 45 %): 20-40 mg/día (noche).

Hipercolesterolemia familiar homocigótica: 40 mg/día (noche) o 80 mg/día dividido en 3 dosis: 2 dosis de 20 mg y 1 de 40 mg (noche).

Prevención cardiovascular: 20-40 mg/día (noche).

Niños 10-17 años con hipercolesterolemia familiar heterocigótica: 10 mg/día por la tarde. Ajustar la dosis a intervalos de 4 semanas o más; dosis máxima 40 mg/día.

PRESENTACIONES:

Rapiscal 20 mg:

Caja conteniendo 3 blísteres con 10 tabletas recubiertas.

Caja conteniendo 10 blísteres con 10 tabletas recubiertas.

Rapiscal 40 mg:

Caja conteniendo 3 blísteres con 10 tabletas recubiertas.

Caja conteniendo 10 blísteres con 10 tabletas recubiertas.

LEYENDAS DE PROTECCIÓN:

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Venta por receta médica.

Consérvese en un lugar fresco y seco entre 25 - 30°C.



Fabricante y Titular:

LABORATORIO LAPROFAR, S.R.L.

C/2da. Av. Los Restauradores No.1,
Sabana Perdida, Santo Domingo Norte.