

Atorvastatina cálcica

Hipocolesterolemiantes

A Atorvastatina trata-se de uma estatina que atua como inibidor competitivo e seletivo da síntese da enzima 3-hidroxi-3-metilglutaril-coenzima A (HMG-CoA) redutase. São usadas na redução do LDL-colesterol, apolipoproteína B e triglicérides, com aumento do HDL-colesterol, no tratamento de hiperlipidemias e na profilaxia de doenças cardiovasculares. É uma estatina obtida por síntese, que se liga quase por completo com as proteínas plasmáticas (98%), seu metabolismo é hepático e sua meia vida é de 20 horas.

Atorvastatina é indicada para reduzir o risco: infarto do miocárdio não-fatal, de acidente vascular cerebral fatal e não-fatal, de procedimentos de revascularização, de hospitalização por insuficiência cardíaca congestiva e de angina, em pacientes com doença cardíaca coronariana clinicamente evidente.

Propriedades

- Fármaco hipocolesterolemiantes;
- Reduz risco de complicações cardiovasculares.

Mecanismo de ação

Atorvastatina age reduzindo a quantidade de colesterol (gordura) total no sangue diminuindo os níveis das frações prejudiciais (LDL-C, apolipoproteína B, VLDL-C, triglicérides) e aumentando os níveis sanguíneos do colesterol benéfico (HDL-C). A ação de Atorvastatina cálcica se dá pela inibição de produção de colesterol pelo fígado, e aumento da absorção e destruição de frações prejudiciais (LDL) do colesterol.

A Atorvastatina diminui os níveis plasmáticos de colesterol e lipoproteína através da inibição da HMG-CoA redutase e da síntese de colesterol no fígado, e aumenta o número de receptores de LDL hepáticos da superfície da célula, aumentando a absorção e o catabolismo do LDL.

A Atorvastatina reduz a produção e o número de partículas de LDL. Produz um aumento marcante e prolongado na atividade do receptor de LDL. Além de promover uma alteração benéfica na qualidade de partículas de LDL circulante. O fármaco é eficaz na redução de LDL em pacientes com hipercolesterolemia familiar homocigótica, uma população que não responde normalmente à medicação de redução lipídica.

O principal sítio de ação da Atorvastatina é o fígado, que é o principal local de síntese de colesterol e *clearance* de LDL.

Atorvastatina é rapidamente absorvida após a administração oral e concentrações plasmáticas máximas são atingidas dentro de 1 a 2 horas. A extensão de absorção e as concentrações plasmáticas aumentam em proporção à sua dose.

Posologia

Uso humano:

A Atorvastatina é indicada nas doses que variam de 10 a 80mg, uma vez ao dia. Em casos de Hipercolesterolemia familiar homocigota as doses indicadas são de 10mg, uma vez ao dia.

Atorvastatina é administrada na forma de atorvastatina cálcica triidratada, por isso é necessário aplicar fator de equivalência (FEq) – (vide – “Recomendações farmacotécnicas”).

Indicações

Atorvastatina é indicado como adjunto à dieta para o tratamento de pacientes com níveis elevados de colesterol total, LDL-colesterol, apolipoproteína B e triglicérides, para aumentar níveis de HDL-colesterol em pacientes com hipercolesterolemia primária e hiperlipidemia combinada (mista), níveis elevados de triglicérides séricos e para pacientes com disbetilipoproteinemia que não respondem de forma adequada à dieta. Também é indicado para a redução do colesterol total e do LDL-colesterol em pacientes com hipercolesterolemia familiar homocigótica, quando a resposta à dieta e outras medidas não farmacológicas forem inadequadas.

A atorvastatina é indicada para prevenção secundária (prevenção de recorrência de eventos cardiovasculares) após síndrome coronária aguda. Também é indicado para prevenção de complicações cardiovasculares em pacientes sem evidência clínica de doença cardiovascular e com ou sem dislipidemia, mas que possuam múltiplos fatores de risco associados, como tabagismo, hipertensão, diabetes, HDL-colesterol baixo ou história familiar de doença cardíaca precoce.

Atorvastatina é indicada para reduzir o risco: infarto do miocárdio não-fatal, de acidente vascular cerebral fatal e não-fatal, de procedimentos de revascularização, de hospitalização por insuficiência cardíaca congestiva e de angina, em pacientes com doença cardíaca coronariana clinicamente evidente.

Contraindicações

Atorvastatina é contraindicada para pacientes que apresentam hipersensibilidade a qualquer componente da fórmula; doença hepática ativa ou elevações persistentes inesperadas das transaminases séricas, excedendo em três vezes o limite superior da normalidade; durante a gravidez ou lactação ou a mulheres em idade fértil que não estejam utilizando medidas contraceptivas eficazes. Atorvastatina deve ser administrada a adolescentes e mulheres em idade fértil somente quando a gravidez se verificar altamente improvável e desde que estas pacientes tenham sido informadas dos potenciais riscos ao feto.

Reações adversas

Os efeitos adversos são os mesmos relacionados a outras estatinas, há risco de miopatias e as enzimas hepáticas devem ser monitoradas.

Em geral as reações adversas são leves a moderadas, podendo ocorrer constipação, dispepsia, dores abdominais e flatulência. Ocasionalmente podem ocorrer edema facial, febre, rigidez cervical, mal-estar, alterações da função hepática, colite, vômitos, gastrite, boca seca, anorexia, aumento do apetite, alterações estomacais e reação de fotossensibilidade.

Interações medicamentosas

As doses de atorvastatina devem ser reduzidas quando usada em conjunto com drogas como a ciclosporina, antibióticos macrolídeos (claritromicina), antifúngicos azólicos (itraconazol), genfibrozila, verapamil, niacina, entre outras, pois aumentam o risco de miopatias. O seu uso é contraindicado na gravidez ou amamentação e mulheres férteis devem utilizar medidas anticoncepcionais.

Recomendações farmacotécnicas

Atorvastatina pode ser manipulada com os seguintes excipientes: celulose microcristalina, estearato de magnésio, carbonato de cálcio, lactose monoidratada, polissorbato 80 e talco farmacêutico.

Atorvastatina é administrada na forma de atorvastatina cálcica triidratada, em doses equivalentes à base: 10,8mg de Atorvastatina cálcica triidratada são aproximadamente equivalentes a 10mg de atorvastatina base – FEq = 1,08 (BATISTUZZO, 2011).

CAS: 344423-98-9

Atorvastatina Cálcica Triidratada - C66H68CaF2N4O10.3H2O

Informações de armazenamento

Atorvastatina deve ser armazenada em recipiente hermético protegido da umidade, ao abrigo da luz solar direta, livre do calor e umidade.

Referências bibliográficas

ANFARMAG. Manual de equivalência – 3ª edição. São Paulo. 2010

BATISTUZZO JAO, ITAYA M, ETO Y. Formulário Médico Farmacêutico, ed.4, São Paulo: Pharmabooks, 2011: 71-73p.

Zarator® (Atorvastatina cálcica). Bula medicamento referência, 054674 – ZRT01a - Wyeth Indústria Farmacêutica Ltda.