

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

SIMVASTATINA

- Sinónimos:** Velastatina. Sinvinolina.
- Fórmula Molecular:** $C_{25}H_{38}O_5$
- Peso Molecular:** 418,56
- Datos Físico-Químicos:** Polvo cristalino, blanco o casi blanco. Prácticamente insoluble en agua, muy soluble en cloruro de metileno, fácilmente soluble en etanol al 96 %. Punto de fusión: 135 – 138 °C. Absorción UV máx.: 231, 238, 247 nm (acetonitrilo). Rotación óptica: +292° (c=0,5, acetonitrilo).
- Antioxidante: BHA (aprox. al 0,01 %).
- Propiedades y usos:** Es un fármaco hipolipemiante del grupo de las estatinas, que actúan como un inhibidor competitivo de la hidroximetilglutaril coenzima A reductasa, la enzima determinante de la tasa para síntesis del colesterol.
- Se absorbe en el tubo digestivo y se hidroliza a la forma β -hidroxiácido activa. Experimenta un importante metabolismo a nivel hepático. Tanto la simvastatina como su metabolito circulan unidos alrededor del 95 % a las proteínas plasmáticas. Se excreta principalmente por las heces, a través de la bilis, como metabolitos. Se recupera en la orina, principalmente en forma inactiva, alrededor de un 10 – 15 %. La vida media del metabolito activo es de 1,9 h.
- Reduce las concentraciones plasmáticas de colesterol total, tanto el que está unido a LDL como a VLDL, así como el nivel de triglicéridos, y por el contrario tiende a aumentar la concentración del colesterol unido a HDL. Se considera que aumenta la producción de receptores LDL en el hepatocito, de manera que aumenta el aclaramiento de estas proteínas de la circulación.
- Se utiliza para reducir las concentraciones de colesterol LDL, apolipoproteína B, y triglicéridos, y para aumentar la de colesterol HDL. También es eficaz como tratamiento coadyuvante en hipercolesterolemia familiar homocigota, y como medida profiláctica en pacientes con hipercolesterolemia asociada a cardiopatía isquémica.
- Dosificación:** Vía oral, a la dosis de 10 – 80 mg/día.
- Efectos secundarios:** Los más frecuentes son molestias gastrointestinales, cefaleas, erupciones cutáneas, mareo, insomnio, visión borrosa, y disgeusia. Puede provocar el aumento reversible de la aminotransferasa sérica. Raramente se ha observado hepatitis, pancreatitis, hipersensibilidad incluso con angioedema, miopatías, y rabdomiolisis con insuficiencia renal.

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Precauciones:

No administrar a pacientes con hepatopatía aguda o con una concentración de las aminotransferasas séricas aumentada persistentemente de manera inexplicable.

Evitar durante el embarazo, ya que puede interferir en la síntesis de de esteroides en el feto.

Si hay aumento significativo de las aminotransferasas séricas o la creatinquinasa, se cesará en la administración.

Usar con precaución en pacientes con disfunción renal grave.

En los pacientes tratados con ciclosporina, derivados del ácido clofíbrico, o del ácido nicotínico, se recomiendan dosis bajas y se debe considerar el riesgo de miopatía.

Interacciones:

Los pacientes tienen más riesgo de presentar una miopatía si reciben tratamiento concomitante con otras estatinas y algunos otros fármacos que actúan sobre el citocromo P450 (ciclosporina, itraconazol, ketaconazol, eritromicina, claritromicina, inhibidores de la proteasa del VIH, nefazodona...), que provocan un aumento de los niveles plasmáticos de simvastatina, lo que aumenta el riesgo de miopatía.

El ácido nicotínico y los derivados del ácido clofíbrico aumentan el riesgo de miopatía cuando se administran junto con simvastatina.

En pacientes tratados con simvastatina y anticoagulantes dicumarínicos se han descrito hemorragias y un aumento del tiempo de protombina.

También se observó un aumento de las concentraciones de simvastatina en pacientes que recibieron tratamiento con mibefradil.

Observaciones:

Fácilmente oxidable.

Conservación:

En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Simvastatina solución 10 mg/5 ml

Simvastatina	0,1 g
Aerosil 200	2 - 4 g
Butilhidroxitolueno (BHT)	0,05 g
Sacarina sódica	0,1 g
Saborizante c.s.	
Aceite de almendras dulces c.s.p.	100 ml

Modus operandi:

Calentar un poco parte del aceite de almendras dulces, y añadir con agitación la sacarina y el BHT previamente bien triturados y pulverizados (la sacarina no se disolverá por completo). Añadir el saborizante. Añadir el Aerosil 200, mezclado inicialmente con un poco de mezcla oleosa. Añadir la simvastatina mezclada con cantidad suficiente de aceite hasta formar una pasta fina. Añadir el resto de aceite y agitar todo muy bien.

Nota: la Simvastatina de Acofarma contiene BHA como antioxidante.

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Conservación: aprox. 30 días a temperatura ambiente.

Cápsulas de simvastatina

Simvastatina 10 mg
Excipiente c.s.p. 1 cápsula

Bibliografía:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).
- *Preparações Orais Líquidas*, Anderson de Oliveira Ferreira y Gilberto Fernandes de Souza. 3ª edição. 2011.