

Nuevos principios activos

Cuesta Terán MT. *
Martínez de la Gándara M. *

CERIVASTATINA

LIPOBAY	0,1 mg 28 comp.	PVP: 4.131	Química Fca. Bayer, S.A.
	0,2 mg 28 comp.	PVP: 5.536	
	0,3 mg 28 comp.	PVP: 6.089	
LIPOSTEROL	0,1 mg 28 comp.	PVP: 4.131	Vita, S.A.
	0,2 mg 28 comp.	PVP: 5.536	
	0,3 mg 28 comp.	PVP: 6.089	
VASLIP	0,1 mg 28 comp.	PVP: 4.131	Ferrer Internacional, S.A.
	0,2 mg 28 comp.	PVP: 5.536	
	0,3 mg 28 comp.	PVP: 6.089	
ZENAS MICRO	0,1 mg 28 comp.	PVP: 4.131	Fournier, S.A.
	0,2 mg 28 comp.	PVP: 5.536	
	0,3 mg 28 comp.	PVP: 6.089	

Con receta médica. Aportación: 40%.

Grupo terapéutico: BO4A.

Potencial terapéutico: C.

La *cerivastatina* es otro nuevo inhibidor sintético de la HMG-CoA (3-hidroxi-metil-glutaril-CoA) reductasa, del grupo de las estatinas, siendo el sexto que se comercializa en España. Es la sal sódica de un fluorofenil piridinil sustituido del ácido heptanoico.

Su indicación aprobada es el tratamiento de la hipercolesterolemia primaria (tipo IIa y IIb) en pacientes que no han respondido adecuadamente a la dieta.

Como las otras estatinas, actúa como inhibidor competitivo y selectivo sobre la HMG-CoA reductasa hepática, principal responsable de la transformación de HMG-CoA a ácido mevalónico que impide la formación del mismo y, como consecuencia se afecta la biosíntesis de colesterol, lo que se traduce en una disminución de los niveles de colesterol total, LDL-colesterol y triglicéridos (TG) y un aumento en los niveles de HDL-colesterol. Estudios «*in vitro*» han mostrado mayor potencia de la *cerivastatina* frente a las otras estatinas, pero por el momento en los estudios experimentales este hecho no ha tenido ninguna significación clínica, no habiendo diferencias importantes entre ellas a dosis equivalentes.

Se absorbe rápidamente a nivel gastrointestinal alcanzándose la concentración plasmática máxima a las 2-3 horas de su administración oral, no afectándose su biodisponibilidad (60%) por la presencia de alimento.

Presenta una alta unión a proteínas plasmáticas (aprox. 99%), se metaboliza a nivel hepático a través del sistema citocromo P₄₅₀ transformándose en 3 metabolitos farmacológicamente activos. Se excreta principalmente en heces (70%) y algo en orina (30%) con una semivida de eliminación de 2-3 horas.

Se administra en dosis única por la noche, siendo la inicial 0,1 mg/día y según respuesta aumentar 0,1 mg/día cada 4 semanas hasta un máximo de 0,3 mg/día.

En los ensayos clínicos controlados con placebo en pacientes con hipercolesterolemia primaria tipo IIa y dieta, la *cerivastatina* ha resultado ser más eficaz en disminuir los niveles de colesterol (total y LDL) y TG de partida, siendo el grado de reducción dependiente de la dosis. Se han realizado estudios comparativos randomizados frente a otras estatinas (lovastatina y simvastatina) en hipercolesterolemia tipo IIa y frente a gemfibrozilo en hipercolesterolemia tipo IIb. Con la lovastatina se redujeron más los niveles de colesterol total (20% *cerivastatina* vs 24% lovastatina) y LDL-colesterol (28% *cerivastatina* vs 33% lovastatina); con la simvastatina se obtuvo mayor reducción de los niveles de LDL-colesterol (27% *cerivastatina* vs 34% simvastatina). En el caso del gemfibrozilo la reducción en los niveles de triglicéridos fue superior con gemfibrozilo (14,8-20,3% *cerivastatina* vs 50,3% gemfibrozilo) pero en los niveles de LDL-colesterol fue superior la reducción en el grupo tratado con *cerivastatina* (15,1-24,2% *cerivastatina* vs 7,5% gemfibrozilo). Por el momento no hay estudios comparativos con otras estatinas así como tampoco estudios a muy largo plazo para poder determinar su influencia sobre la morbi-mortalidad de patologías cardíacas.

Es un fármaco bien tolerado siendo sus reacciones adversas similares a las de las otras estatinas transitorias y poco frecuentes (incidencia inferior al 5%) entre las que se citan: sinusitis, cefalea, rinitis, tos, insomnio y sintomatología gripal. La elevación de transaminasas, que, ocurre con otras estatinas, es leve y poco frecuente.

En los ensayos clínicos se observó una mayor incidencia de miopatía que con lovastatina y simvastatina y una incidencia similar de alteraciones del cristalino.

Aunque por el momento no hay descritas interacciones clínicamente significativas, debe utilizarse con

(*) Dirección Gral. de Farmacia y Productos Sanitarios. Mº Sanidad y Consumo. Madrid.

precaución junto a inhibidores o a inductores del citocromo P₄₅₀. Con la colestiramina debe haber un intervalo de 4 horas.

Se encuentra contraindicada en caso de miopatía, insuficiencia hepática o elevación de transaminasas, embarazo, lactancia y niños (debido a la ausencia de experiencia clínica). Debe utilizarse con precaución en casos con antecedentes de alcoholismo o enfermedad hepática.

COSTE TRATAMIENTO/DÍA	Dosis (mg)	Pesetas
Cerivastatina	0,1-0,3	148-217
Lovastatina	20-80	(100-149) - (400-474) *
Simvastatina	10-40	147-399

(*) Debido a la amplia variabilidad de precios.

CONCLUSIONES

La *cerivastatina* es un principio activo con eficacia demostrada en el tratamiento de la hipercolesterolemia primaria y en los estudios comparativos realizados hasta la fecha ha presentado una eficacia ligeramente

inferior respecto a otras estatinas. Por otro lado, se desconoce su efecto sobre la morbi-mortalidad en enfermedad cardíaca coronaria debido a la ausencia de estudios a muy largo plazo aunque es de esperar que sea similar a las otras estatinas debido a que presenta igual mecanismo de acción.

BIBLIOGRAFIA RECOMENDADA

- Drugdex^(R) Editorial Staff. *Drugdex^(R) Information System*. Micromedex Inc. Denver, Colorado. Vol. 98 (1998). Monograph of: Cerivastatine.
- P&T Quik^(R) Editorial Staff. *P&T Quik^(R) Information System*. Micromedex Inc. Denver, Colorado. Vol. 98 (1998). Report of «Cerivastatine».
- McClellan KJ, Wiseman LR, McTavish D. Cerivastatin. *Drugs* 1998; 55:415-420.
- Anon. Cerivastatin for hypercholesterolemia. *Med Lett Drugs Ther* 1998; 40:13-14.
- Fichas técnicas de las especialidades LIPOBAY, LIPOSTEROL, VASLIP y ZENAS MICRO. Ministerio de Sanidad y Consumo (1998).