Инструкция по применению
Ксеникал Капсулы 120 мг 21 шт

Характеристики



Форма выпуска: Капсулы
Страна: Россия
Производитель: Роста
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Орлистат
Количество в упаковке: 21
Дозировка действующего вещества: 120 мг
Срок годности: 36

Действующее вещество

Орлистат

Состав

Орлистат 120 мг

Форма выпуска

Капсулы

Фармакокинетика

Всасывание;У добровольцев с нормальной массой тела и ожирением системное воздействие препарата минимально. После однократного перорального приема препарата в дозе 360 мг неизмененный орлистат в плазме определить не удалось, что означает, что его концентрации находятся ниже уровня 5 нг/мл.;В целом, после приема терапевтических доз выявить неизмененный орлистат в плазме удавалось лишь в редких случаях, при этом концентрации его были крайне малы (<10 нг/мл или 0.02 мкмоль). Признаки кумуляции отсутствовали, что подтверждает, что всасывание препарата минимально.;Распределение;Vd определить нельзя, поскольку препарат очень плохо всасывается. In vitro орлистат более чем на 99% связывается с белками плазмы (в основном, с липопротеинами и альбумином). В минимальных количествах орлистат может проникать в эритроциты.;Метаболизм;Судя по данным, полученным в эксперименте на животных, метаболизм орлистата осуществляется главным образом в стенке кишечника. В исследовании у лиц с ожирением установлено, что примерно 42% от той минимальной фракции препарата, которая подвергается системному всасыванию, приходится на два основных метаболита - M1 (четырехчленное гидролизированное лактоновое кольцо) и M3 (M1 с отщепленным остатком N-формиллейцина).;Молекулы M1 и M3 имеют открытое b-лактонное кольцо и крайне слабо ингибируют липазу (соответственно, в 1000 и 2500 раз слабее, чем орлистат). С учетом такой низкой ингибирующей активности и низких плазменных концентраций (в среднем, 26 нг/мл и 108 нг/мл, соответственно) после приема терапевтических доз, эти метаболиты рассматриваются как фармакологически неактивные.;Выведение;Исследования у лиц с нормальной и избыточной массой тела показали, что основным путем элиминации является выведение невсосавшегося препарата с калом. С калом выводилось около 97% принятой дозы препарата, причем 83% - в виде неизмененного орлистата.;Совокупная почечная экскреция всех субстанций, структурно связанных с орлистатом, составляет менее 2% принятой дозы. Время до полной элиминации препарата из организма (с калом и мочой) равняется 3-5 дням. Соотношение путей выведения орлистата у добровольцев с нормальной и избыточной массой тела оказалось одинаковым. Как орлистат, так и метаболиты M1 и M3, могут подвергаться экскреции с желчью.;Фармакокинетика в особых клинических группах;Плазменные концентрации орлистата и его метаболитов (M1 и M3) у детей не отличаются от таковых у взрослых при сравнении одинаковых доз препарата. Суточная экскреция жира с калом составила 27% от приема с пищей при терапии орлистатом и 7% - при приеме плацебо.

Показания

— длительная терапия больных ожирением или пациентов с избыточной массой тела, в т.ч. имеющих ассоциированные с ожирением факторы риска, в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой; — в комбинации с гипогликемическими препаратами (метформин, производные сульфонилмочевины и/или инсулин) или умеренно гипокалорийной диетой у больных сахарным диабетом 2 типа с избыточной массой тела или ожирением.

Способ применения и дозы

Длительная терапия больных ожирением или пациентов с избыточной массой тела, в том числе имеющих ассоциированные с ожирением факторы риска, в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой у взрослых и детей старше 12 лет рекомендованная доза орлистата составляет одну капсулу в 120 мг с каждым основным приемом пищи (во время еды или не позднее чем через час после еды).;В комбинации с гипогликемическими препаратами (метформин, производные сульфонилмочевины и/или инсулин) или умеренно гипокалорийной диетой у больных сахарным диабетом 2 типа с избыточной массой тела или ожирением: у взрослых рекомендованная доза орлистата составляет одну капсулу в 120 мг с каждым основным приемом пищи (во время еды или не позднее чем через час после еды).; Если прием пищи пропускают или если пища не содержит жира, то прием препарата Ксеникал также можно пропустить.;Препарат следует принимать в сочетании со сбалансированной, умеренно гипокалорийной диетой, содержащей не более 30% калоража в виде жиров. Суточное потребление жиров, углеводов и белков необходимо распределять на три основные приема.;Увеличение дозы орлистата свыше рекомендованной (120 мг 3 раза/сут) не приводит к усилению его терапевтического эффекта.;Эффективность и безопасность препарата Ксеникал у пациентов с нарушением функции печени и/или почек, а также у пациентов пожилого и детского возраста (младше 12 лет) не исследовались.

Противопоказания

— синдром хронической мальабсорбции; — холестаз; — повышенная чувствительность к препарату или любым другим компонентам, содержащимся в капсуле.

Применение при беременности и кормлении грудью

Препарат категории B.;В исследованиях репродуктивной токсичности на животных тератогенного и эмбриотоксического эффекта препарата не наблюдалось. В отсутствие тератогенного эффекта у животных ожидать подобного эффекта у человека не следует. Однако из-за отсутствия клинических данных Ксеникал не следует назначать беременным.;Выведение орлистата с грудным молоком не изучалось, поэтому его не следует принимать во время кормления грудью.

Побочные действия

Данные клинических исследований;Для описания частоты побочных реакций используются следующие категории: очень часто (≥1/10), часто (≥1 /100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10000, <1/1000) и очень редко (<1/10000), включая отдельные случаи.;Побочные реакции на орлистат возникали главным образом со стороны ЖКТ и были обусловлены фармакологическим действием препарата, препятствующего всасыванию жиров пищи. Очень часто отмечались такие явления, как маслянистые выделения из прямой кишки, выделение газов с некоторым количеством отделяемого, императивные позывы на дефекацию, стеаторея, учащение дефекации, жидкий стул, метеоризм, боли или дискомфорт в животе.;Их частота увеличивается при повышении содержания жира в питании. Больных следует информировать о возможности возникновения побочных реакций со стороны ЖКТ и обучить, как устранять их путем лучшего соблюдения диеты, особенно в отношении количества содержащегося в ней жира. Применение диеты с низким содержанием жира уменьшает вероятность побочных действий со стороны ЖКТ и тем самым помогает пациентам контролировать и регулировать потребление жиров.;Как правило, указанные побочные реакции являются слабо выраженными и транзиторными. Они возникали на ранних этапах лечения (в первые 3 месяца), причем у большинства больных было не более одного эпизода таких реакций.;При лечении препаратом Ксеникал часто возникают следующие нежелательные явления со стороны ЖКТ: «мягкий» стул, боли или дискомфорт в прямой кишке, недержание кала, вздутие живота, поражение зубов, поражение десен.;Отмечались также очень часто: головные боли, инфекции верхних дыхательных путей, грипп; часто: инфекции нижних дыхательных путей, инфекции мочевыводящих путей, дисменорея, тревога, слабость.;У больных с сахарным диабетом 2 типа характер и частота нежелательных явлений были сопоставимы с таковыми у лиц без сахарного диабета с избыточной массой тела и ожирением. Единственными новыми побочными явлениями у пациентов с сахарным диабетом 2 типа были гипогликемические состояния, возникавшие с частотой >2% и инцидентностью ≥1% по сравнению с плацебо (которые могли возникать в

результате улучшения компенсации углеводного обмена), и часто - вздутие живота.;В 4-х летнем клиническом исследовании общий профиль безопасности не отличался от такового, полученного в 1- и 2-летних исследованиях. При этом общая частота возникновения нежелательных явлений со стороны желудочно-кишечного тракта ежегодно уменьшалась на протяжении 4-х летнего периода приема препарата.; Постмаркетинговое наблюдение;Описаны редкие случаи аллергических реакций, главными клиническими симптомами которых были зуд, сыпь, крапивница, ангионевротический отек, бронхоспазм и анафилаксия.;Описаны очень редкие случаи буллезной сыпи, повышения активности трансаминаз и щелочной фосфатазы, а также отдельные, возможно серьезные, случаи развития гепатита (причинно-следственная связь с приемом препарата Ксеникал; или патофизиологические механизмы развития не установлены).;При одновременном назначении препарата Ксеникали антикоагулянтов зарегистрированы случаи снижения протромбина, увеличение значений международного нормализованного отношения (МНО) и несбалансированной терапии антикоагулянтами, что приводило к изменению гемостатических параметров.;Зарегистрированы случаи ректального кровотечения, дивертикулита, панкреатита, холелитиаза и оксалатной нефропатии (частота возникновения не известна).;При одновременном приеме орлистата и противоэпилептических препаратов наблюдались случаи развития судорог (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

Передозировка

В клинических исследованиях у лиц с нормальной массой тела и больных ожирением прием разовых доз 800 мг или многократный прием препарата по 400 мг 3 раза/сут в течение 15 дней не сопровождался появлением существенных нежелательных явлений. Кроме того, у больных ожирением есть опыт применения орлистата по 240 мг 3 раза/сут в течение 6 мес, что не сопровождалось достоверным увеличением частоты нежелательных явлений.;В случаях передозировки препарата Ксеникал сообщалось либо об отсутствии нежелательных явлений, либо нежелательные явления не отличались от тех, которые наблюдаются при приеме препарата в терапевтических дозах.;В случае выраженной передозировки препарата Ксеникал рекомендуется наблюдать пациента в течение 24 ч.. По данным исследований у человека и животных, любые системные эффекты, которые можно было бы связать с липазоингибирующими свойствами орлистата, должны быть быстро обратимы.

Взаимодействие с другими препаратами

Не выявлено взаимодействия с амитриптилином, аторвастатином, бигуанидами, дигоксином, фибратами, флуоксетином, лозартаном, фенитоином, пероральными контрацептивами, фентермином, правастатином, варфарином, нифедипином ГИТС (гастро-интестинальная терапевтическая система) и нифедипином с медленным высвобождением, сибутрамином или алкоголем (на основании исследований взаимодействий между лекарственными средствами). Однако необходимо следить за показателями МНО при сопутствующей терапии варфарином или другими пероральными антикоагулянтами.;При одновременном приеме с препаратом Ксеникал отмечалось уменьшение всасывания витаминов D, E и бетакаротена. Если рекомендованы поливитамины, их следует принимать не менее чем через 2 часа после приема препарата Ксеникал или перед сном.;При одновременном приеме препарата Ксеникал и циклоспорина отмечалось снижение плазменных концентраций циклоспорина, поэтому рекомендуется более частое определение концентраций циклоспорина в плазме при одновременном приеме циклоспорина и препарата Ксеникал.;При пероральном назначении амиодарона во время терапии препаратом Ксеникал отмечалось снижение системной экспозиции амиодарона и дезэтиламиодарона (на 25-30%), однако в связи со сложной фармакокинетикой амиодарона, клиническая значимость этого явления не ясна. Добавление препарата Ксеникал к длительной терапии амиодароном возможно приведет к снижению терапевтического эффекта амиодарона (исследований не проводилось).;Следует избегать одновременного приема препарата Ксеникал и акарбозы, из-за отсутствия данных фармакокинетических исследований.;При одновременном приеме орлистата и противоэпилептических препаратов наблюдались случаи развития судорог. Причинно-следственная связь между развитием судорог и терапией орлистатом не установлена. Тем не менее, следует мониторировать состояние пациентов на предмет возможных изменений в частоте и/или тяжести судорожного синдрома.

Особые указания

Ксеникал эффективен в плане длительного контроля массы тела (снижение массы тела и ее поддержание на новом уровне, предотвращение повторной прибавки массы тела). Лечение препаратом Ксеникал приводит к улучшению профиля факторов риска и заболеваний, сопутствующих ожирению, включая гиперхолестеринемию, сахарный диабет 2 типа, нарушение толерантности к глюкозе, гиперинсулинемию, артериальную гипертензию, и к уменьшению количества висцерального жира.;При использовании в комбинации с такими гипогликемическими препаратами, как метформин, производные сульфонилмочевины и/или инсулин у больных сахарным диабетом 2 типа с избыточной массой тела (индекс массы тела (ИМТ) ≥28 кг/м2) или ожирением (ИМТ ≥30 кг/м2), Ксеникал в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой дает дополнительное улучшение компенсации углеводного обмена.;В клинических исследованиях у большинства больных концентрации витаминов A, D, E, K и бетакаротена в ходе четырех лет терапии орлистатом оставались в пределах нормы. Для обеспечения адекватного поступления всех питательных веществ можно назначить поливитамины.;Пациент должен получать сбалансированную, умеренно гипокалорийную диету, содержащую не более 30% калоража в виде жиров. Рекомендуется питание, богатое фруктами и овощами. Суточное потребление жиров, углеводов и белков необходимо распределять на три основные приема.;Вероятность побочных реакций со стороны ЖКТ может увеличиваться, если Ксеникал принимают на фоне питания, богатого жирами (например, 2000 ккал/сутки, из них более 30% в виде жиров, что равняется примерно 67 г жира). Суточное потребление жиров должно быть распределено на три основных приема. Если Ксеникал принимают с пищей, очень богатой жиром, вероятность желудочно-кишечных реакций увеличивается.;У больных сахарным диабетом 2 типа уменьшение массы тела при лечении препаратом Ксеникал сопровождается улучшением компенсации углеводного обмена, что может позволить или потребовать снижения дозы гипогликемических препаратов (например, производных сульфонилмочевины).

Условия хранения

В сухом месте