Инструкция по применению
Листата таблетки 120 мг 80 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: ИЗВАРИНО ФАРМА
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Орлистат
Количество в упаковке: 80
Дозировка действующего вещества: 120 мг

Описание

Таблетки овальной, двояковыпуклой формы, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета с перламутровым эффектом, с риской на одной стороне и символом "f" - с другой. На поперечном срезе - ядро белого или почти белого цвета.

Действующее вещество

Орлистат

Состав

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой содержит: Состав ядра таблетки: Активное вещество: орлистат - 120,0 мг, Вспомогательные вещества: натрия лаурилсульфат - 12,0 мг, акации камедь - 210,0 мг, маннитол - 580,0 мг, коповидон - 20,0 мг, кросповидон - 50,0 мг, магния стеарат - 8,0 мг. Состав оболочки таблетки: Опадрай II голубой (85F205040) - 34,0 мг (поливиниловый спирт - 40,0%, титана диоксид - 22,48%, макрогол 3350 - 20,20%, тальк - 14,80%, лак алюминиевый голубой - 2,28%, краситель железа оксид желтый - 0,24%). Опадрай серебристый (63F97546) - 6,0 мг (поливиниловый спирт - 47,03%, тальк - 27,00%, макрогол 3350 - 13,27%, перламутровый пигмент- 10,00%, полисорбат-80- 2,70%).

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание. У добровольцев с нормальной массой тела и ожирением системное воздействие орлистата минимально. После однократного приема внутрь в дозе 360 мг неизмененный орлистат в плазме крови не определяется что означает что его концентрации находятся ниже предела количественного определения (менее 5 нг/мл). В целом после приема терапевтических доз выявить неизмененный орлистат в плазме крови удавалось лишь в редких случаях при этом концентрации его были крайне малы (менее 10 нг/мл или 002 мкмоль). Признаки кумуляции отсутствуют что подтверждает что всасывание орлистата минимально. Распределение. Объем распределения определить нельзя поскольку орлистат очень плохо всасывается. In vitro орлистат более чем на 99% связывается с белками плазмы крови (в основном с липопротеинами и альбумином). В минимальных количествах орлистат может проникать в эритроциты. Метаболизм. Метаболизм орлистата осуществляется главным образом в стенке кишечника. У пациентов с ожирением примерно 42% от той минимальной фракции орлистата 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. У лиц с нормальной и избыточной массой тела основным путем выведения является выведение не всосавшегося орлистата через кишечник. Через кишечник выводится около 97% принятой дозы причем 83% - в виде неизмененного орлистата. Совокупная почечная экскреция всех субстанций структурно связанных с орлистатом составляет менее 2% принятой дозы. Время до полного выведения орлистата из организма (через кишечник и почками) 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 Концентрации орлистата и его метаболитов (M1 и M3) в плазме крови у детей не отличаются от таковых у взрослых при сравнении одинаковых доз орлистата. Суточная экскреция жира с калом составляет 27% от приема с пищей при терапии орлистатом.

Показания

Длительная терапия пациентов с ожирением при индексе массы тела (ИМТ) не менее 30 кг/м2 или пациентов с избыточной массой тела при ИМТ не менее 28 кг/м2 в том числе имеющих ассоциированные с ожирением факторы риска в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой. В комбинации с гипогликемическими препаратами (метформин производные сульфонилмочевины и/или инсулин) и/или умеренно гипокалорийной диетой у пациентов с сахарным диабетом 2 типа с избыточной массой тела или ожирением.

Способ применения и дозы

Внутрь запивая водой. Лечение пациентов с ожирением при ИМТ не менее 30 кг/м2 или пациентов с избыточной массой тела при ИМТ не менее 28 кг/ м2 в том числе имеющих ассоциированные с ожирением факторы риска в сочетании с умеренно низкокалорийной диетой Взрослые и дети старше 12 лет Рекомендованная доза препарата Листата - 1 таблетка (120 мг) с каждым основным приемом пищи (во время еды или не позднее чем через 1 час после еды). В комбинации с гипогликемическими препаратами (метформин производные сулъфонилмочевины и/или инсулин) и/или умеренно гипокалорийной диетой у пациентов с сахарным диабетом 2 типа с избыточной массой тела или ожирением Взрослые Рекомендуемая доза препарата Листата 1 таблетка (120 мг) с каждым основным приемом пищи (во время еды или не позднее чем через 1 час после еды). Если прием пищи пропускают или если пища не содержит жира то прием препарата Листата также можно пропустить. Препарат Листата 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 между 3 основными приемами пищи. Увеличение дозы препарата Листата свыше рекомендованной (120 мг 3 раза в день) не приводит к усилению его терапевтического эффекта. Эффективность и безопасность препарата Листата у пациентов с нарушением функции печени и/или почек а также у пациентов пожилого возраста и детей до 12 лет не исследовались.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к орлистату или любым другим компонентам препарата, синдром хронической мальабсорбции, холестаз, беременность период грудного вскармливания, детский возраст до 12 лет.

Применение при беременности и кормлении грудью

Исследования на животных не показали прямого или косвенного вредного воздействия приема орлистата в отношении беременности, развития эмбриона/плода, родов или постнатального развития. Клинические данные о применении орлистата во время беременности отсутствуют, поэтому применение препарата Листата Мини во время беременности противопоказано. В связи с тем, что данные о проникновении орлистата в грудное молоко отсутствуют, применение препарата Листата Мини в период грудного вскармливания противопоказано.

Побочные действия

Данные клинических исследований Побочные действия препарата систематизированы относительно каждой из систем органов в зависимости от частоты встречаемости с использованием следующей классификации: очень часто (более 1 /10), часто (более 1/100 менее 1/10), нечасто (более 1/1000 менее 1/100), редко (более 1/10000 менее 1/1000), очень редко включая единичные сообщения (менее 1 /10000). Побочные реакции при применении орлистата возникали главным образом со стороны желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) и были обусловлены фармакологическим действием орлистата 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 боль или дискомфорт в животе. Их частота увеличивается при повышении содержания жира в пище. Пациентов следует информировать о возможности возникновения побочных реакций со стороны ЖКТ и обучить как устранять их соблюдением 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 возникают на ранних этапах лечения (в первые 3 месяца) причем у большинства пациентов было не более одного эпизода таких реакций. При лечении орлистатом часто возникают следующие нежелательные явления со стороны ЖКТ: "мягкий" стул боль или дискомфорт в прямой кишке недержание кала вздутие живота поражение зубов поражение десен. Отмечались также очень часто: головная боль инфекции верхних дыхательных путей грипп, часто: инфекции нижних дыхательных путей инфекции мочевыводящих путей дисменорея тревога слабость. У пациентов 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 более 2% и инцидентностью не менее 1% по сравнению с плацебо (которые могли возникать в результате улучшения компенсации углеводного обмена) и часто - вздутие живота. В 4-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 ЖКТ ежегодно уменьшалась на протяжении 4-летнего периода приема препарата. Постмаркетинговое наблюдение Описаны редкие случаи аллергических реакций главными клиническими проявлениями которых были кожная сыпь зуд 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 орлистата или патофизиологические механизмы развития не установлены). При одновременном применении орлистата с антикоагулянтами непрямого действия 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

У лиц с нормальной массой тела и пациентов с ожирением прием разовых доз 800 мг или многократный прием орлистата по 400 мг 3 раза в сутки в течение 15 дней не сопровождался появлением существенных нежелательных явлений. Кроме того у пациентов с ожирением есть опыт применения орлистата по 240 мг 3 раза в сутки в течение 6 мес что не сопровождалось достоверным увеличением частоты нежелательных явлений. В случаях передозировки орлистата сообщалось либо об отсутствии нежелательных явлений либо нежелательные явления не отличались от тех которые наблюдаются при приеме орлистата в терапевтических дозах. В случае выраженной передозировки орлистата 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 орлистата 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 этанолом (на основании исследований взаимодействий между лекарственными средствами). Однако необходимо следить за показателями МНО при одновременной терапии варфарином или другими антикоагулянтами непрямого действия. При одновременном приеме с орлистатом отмечалось уменьшение всасывания витаминов D E и бета-каротина. Если рекомендованы поливитамины их следует принимать не менее чем через 2 ч после приема орлистата или перед сном. При одновременном приеме орлистата и циклоспорина отмечалось снижение концентрации циклоспорина в плазме крови поэтому рекомендуется более частое определение концентрации циклоспорина в плазме крови при одновременном приеме циклоспорина и орлистата. При приеме внутрь амиодарона во время терапии орлистатом отмечалось снижение системной экспозиции амиодарона и дезэтиламиодарона (на 25- 30%) однако в связи со сложной фармакокинетикой амиодарона клиническая значимость этого явления не ясна. Добавление орлистата к длительной терапии амиодароном возможно приведет к снижению терапевтического эффекта амиодарона (исследований не проводилось). Следует избегать одновременного приема орлистата 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 частоты и/или тяжести судорожного синдрома.

Особые указания

Препарат Листата эффективен в плане длительного контроля массы тела (снижение массы тела и ее поддержание предотвращение повторной прибавки массы тела). Лечение препаратом Листата 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 применении в комбинации с такими гипогликемическими препаратами как метформин производные сульфонилмочевины и/или инсулин у пациентов с сахарным диабетом 2 типа с избыточной массой тела (ИМТ не менее 28 кг/м2) или ожирением (ИМТ не менее 30 кг/м2) препарат Листата в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой способствует дополнительному улучшению компенсации углеводного обмена. В клинических исследованиях у большинства пациентов концентрации витаминов A D E K и бета-каротина в ходе четырех лет терапии орлистатом оставались в пределах нормы. Для обеспечения адекватного поступления всех минеральных веществ можно применять 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 основных приема. Вероятность побочных реакций со стороны ЖКТ может увеличиваться если препарат Листата принимают на фоне питания богатого жирами (например 2000 ккал/сут из них более 30% в виде жиров что равняется примерно 67 г жира). Если препарат Листата принимают с пищей очень богатой жиром вероятность желудочно-кишечных реакций увеличивается. У пациентов с сахарным диабетом 2 типа уменьшение массы тела при лечении препаратом Листата сопровождается улучшением компенсации углеводного обмена что может позволить или потребовать снижения дозы гипогликемических препаратов (например производных сульфонилмочевины). Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.: Препарат Листата не влияет на способность управлять транспортными средствами и механизмами. Пациенты с сахарным диабетом 2 типа применяющие препарат Листата в комбинации с гипогликемическими препаратами должны соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и механизмами в связи с возможным развитием гипогликемии сопровождающейся головокружением нарушением зрения.

Срок хранения после открытия

2 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

При температуре не выше 25°С в оригинальной упаковке (контурная ячейковая упаковка в пачке). Хранить в недоступном для детей месте.