# Инструкция по применению
# Листата таблетки 120 мг 30 шт

## Характеристики




Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Россия
Производитель: ИЗВАРИНО ФАРМА
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Орлистат
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 120 мг
Срок годности: 24

## Действующее вещество

Орлистат

## Состав

1 таблетка содержит:активное вещество: орлистат 120 мгвспомогательные вещества: натрия лаурилсульфат — 12 мг; акации камедь — 210 мг; лудифлэш (маннитол — 84–92%, кросповидон — 4–6%, поливинилацетат — 3,5–6%, повидон — 0,25–0,6%) — 580 мг; коповидон — 20 мг; кросповидон — 50 мг; магния стеарат — 8 мг оболочка пленочная: Опадрай II голубой (85F205040) (поливиниловый спирт — 40%, титана диоксид — 22,48%, макрогол 3350 — 20,2%, тальк — 14,8%, лак алюминиевый голубой — 2,28%, краситель железа оксид желтый — 0,24%) — 34 мг; Опадрай серебристый (63F97546) (поливиниловый спирт — 47,03%, тальк — 27%, макрогол 3350 — 13,27%, перламутровый пигмент — 10%, полисорбат 80 — 2,7%) — 6 мг

## Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

**Фармакокинетика**

Всасывание. У добровольцев с нормальной массой тела и ожирением системное воздействие орлистата минимально. После однократного приема внутрь дозы 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 0,02 мкмоль). Признаки кумуляции отсутствуют, что подтверждает, что всасывание орлистата минимально.Распределение. Vd 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 минимальной фракции орлистата, которая подвергается системному всасыванию, приходится на два основных метаболита — M1 (четырехчленное гидролизированное лактонное кольцо) и M3 (M1 с отщепленным остатком N-формиллейцина).Молекулы M1 и M3 имеют открытое β-лактонное кольцо и крайне слабо ингибируют липазу (слабее, чем орлистат, в 1000 и 2500 раз соответственно). С учетом такой низкой ингибирующей активности и низких плазменных концентраций (в среднем 26 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 невсосавшегося 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.Особые группы пациентовДети. 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 ИМТ не менее 30 кг/м2 или пациентов с избыточной массой тела при ИМТ не менее 28 кг/м2, 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) и/или умеренно гипокалорийной диетой у пациентов с сахарным диабетом типа 2 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 т.ч. имеющих ассоциированные с ожирением факторы риска, в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой: взрослым и детям старше 12 лет — рекомендованная доза препарата Листата — 1 табл. (120 мг) с каждым основным приемом пищи (во время еды или не позднее чем через 1 ч после еды).В комбинации с гипогликемическими препаратами (метформин, производные сульфонилмочевины и/или инсулин) и/или умеренно гипокалорийной диетой у пациентов с сахарным диабетом типа 2 с избыточной массой тела или ожирением: взрослым — рекомендуемая доза препарата Листата — 1 табл. (120 мг) с каждым основным приемом пищи (во время еды или не позднее чем через 1 ч после еды).Если прием пищи пропускают или пища не содержит жир, 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.Особые группы пациентовЭффективность 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;беременность;период грудного вскармливания; дети до 12 лет.

**Применение при беременности и кормлении грудью**

В исследованиях репродуктивной токсичности на животных тератогенный и эмбриотоксический эффект орлистата не наблюдался. В отсутствие тератогенного эффекта у животных подобный эффект у человека не ожидается. Поскольку отсутствуют клинические данные о применении орлистата во время беременности, применение препарата Листата у беременных женщин противопоказано.В связи с тем, что отсутствуют данные о выделении орлистата с грудным молоком, применение препарата Листата в период грудного вскармливания противопоказано.

**Побочные действия**

Данные клинических исследованийПобочные 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 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 мес), причем у большинства пациентов было не более одного эпизода таких реакций.Со стороны ЖКТ: часто — «мягкий» стул, боль или дискомфорт в прямой кишке, недержание кала, вздутие живота, поражение зубов, поражение десен.Другие нежелательные реакции: 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 типа 2 характер и частота нежелательных явлений были сопоставимы с таковыми у лиц без сахарного диабета с избыточной массой тела и ожирением. Единственными дополнительными побочными явлениями у пациентов с сахарным диабетом типа 2 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 наблюдениеОписаны 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 ЩФ, 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 МНО и несбалансированной терапии антикоагулянтами, что приводило к изменению гемостатических параметров. Зарегистрированы случаи ректального кровотечения, дивертикулита, панкреатита, холелитиаза и оксалатной нефропатии (частота возникновения неизвестна).При одновременном приеме орлистата и противоэпилептических препаратов наблюдались случаи развития судорог (см. «Взаимодействие»).

**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 взаимодействие 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 ЛС). 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 неясна. Добавление орлистата к длительной терапии амиодароном возможно приведет к снижению терапевтического эффекта амиодарона (исследования не проводились).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 типа 2, нарушение толерантности к глюкозе, гиперинсулинемию, артериальную гипертензию, и уменьшению количества висцерального жира.При применении в комбинации с такими гипогликемическими препаратами, как метформин, производные сульфонилмочевины и/или инсулин, у пациентов с сахарным диабетом типа 2 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 типа 2 уменьшение массы тела при лечении препаратом Листата сопровождается улучшением компенсации углеводного обмена, что может позволить или потребовать снижение дозы гипогликемических препаратов (например производные сульфонилмочевины).Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. Препарат Листата не влияет на способность управлять транспортными средствами и механизмами. Пациенты с сахарным диабетом типа 2, 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.

**Условия хранения**

В защищенном от солнца помещении