Инструкция по применению
Орлистат-Озон Капсулы 120 мг 84 шт

Характеристики

Форма выпуска: Капсулы
Страна: Россия
Производитель: Озон
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Орлистат
Количество в упаковке: 1



Описание

Твердые желатиновые капсулы № 0. Корпус и крышечка капсулы синего цвета, непрозрачные. Содержимое капсул - белые или почти белые пеллеты.

Действующее вещество

Орлистат

Состав

На одну капсулу: Действующее вещество: Орлистат субстанция-пеллеты 50% - 240,00 мг, в пересчете на орлистат - 120,00 мг. Вспомогательные вещества субстанции-пеллет: целлюлоза микрокристаллическая - 98,64 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 10,08 мг, натрия лаурилсульфат - 6,24 мг, повидон - К30 - 5,04 мг. Капсулы твердые желатиновые № 0 Состав корпуса капсулы: краситель синий патентованный - 0,2786%, титана диоксид - 2,0%, желатин до 100%. Состав крышечки капсулы: краситель синий патентованный - 0,2786%, титана диоксид - 2,0%, желатин до 100%.

Форма выпуска

Капсулы

Фармакокинетика

Всасывание У добровольцев с нормальной массой тела и ожирением системное воздействие орлистата минимально. После однократного перорального приема препарата в дозе 360 мг неизмененный Орлистат в плазме не определяется, 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 (Распределение Объем распределения определить нельзя, поскольку Орлистат практически не всасывается и не имеет установленной системной фармакокинетики. 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 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 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 Р-лактонное кольцо и крайне слабо ингибируют липазу (соответственно, в 1000 и 2500 раз слабее, чем Орлистат). С учетом такой низкой ингибирующей активности и низких концентраций в плазме крови (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 выведения невсосавшегося орлистата является выведение через кишечник - около 97% принятой дозы, причем 83% - в виде неизмененного орлистата. Совокупное выведение почками всех субстанций, структурно связанных с орлистатом, составляет менее 2% принятой дозы. Время до полного выведения орлистата из организма (через кишечник и почками) составляет 3-5 дня. Соотношение путей выведения орлистата у добровольцев с нормальной и избыточной массой тела является одинаковым. 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 препарата. Суточное выведение жира через кишечник составляет 27% от приема с пищей при применении орлистата и 7% - при приеме плацебо.

Показания

Длительная терапия пациентов с ожирением (ИМТ ⩾ 30 кг/м2) или пациентов с избыточной массой тела (ИМТ >28 кг/м2), 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 низкокалорийной диетой у пациентов с сахарным диабетом 2 типа с избыточной массой тела или ожирением.

Способ применения и дозы

Длительная терапия пациентов с ожирением или пациентов с избыточной массой тела, имеющих ассоциированные с ожирением факторы риска, в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой: у взрослых и детей старше 12 лет рекомендованная доза препарата Орлистат составляет одну капсулу 120 мг с каждым основным приемом пищи (во время еды или не позднее чем через 1 ч после еды), запивая водой. В комбинации с гипогликемическими препаратами (метформин, производные сульфонилмочевины и/или инсулин) или умеренно гипокалорийной диетой у пациентов с сахарным диабетом 2 типа с избыточной массой тела или ожирением: у взрослых рекомендованная доза препарата Орлистат составляет одну капсулу 120 мг с каждым основным приемом пищи (во время еды или не позднее чем через 1 ч после еды), запивая водой. Если прием пищи пропускают или если пища не содержит жира, то прием препарата также можно пропустить. Препарат Орлистат 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 препарата свыше рекомендованной (120 мг 3 раза в сутки) не приводит к усилению его терапевтического эффекта. Применение у особых групп пациентов Эффективность и безопасность орлистата у пациентов с нарушением функции печени и/или почек, а также у пациентов пожилого и детского возраста (младше 12 лет) не исследовались.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к орлистату или любому из компонентов препарата, синдром хронической мальабсорбции, холестаз, период беременности и грудного вскармливания, детский возраст до 12 лет.

Применение при беременности и кормлении грудью

Доклинические исследования не выявили тератогенного и эмбриотоксического эффекта орлистата. Однако, в связи с отсутствием клинических данных о применении у беременных, Орлистат противопоказан при беременности. Поскольку неизвестно, проникает ли Орлистат в грудное молоко, его применение противопоказано в период грудного вскармливания.

Побочные действия

Частота возникновения нежелательных реакций представлена следующим образом: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, Инфекционные и паразитарные заболевания: очень часто - грипп. Нарушения со стороны обмена веществ и питания: очень часто - гипогликемия (у пациентов с сахарным диабетом 2 типа). Нарушения психики: часто - тревога. Нарушения со стороны нервной системы: очень часто - головная боль. Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень часто - инфекции верхних дыхательных путей, часто - инфекции нижних дыхательных путей. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: очень часто - маслянистые выделения из прямой кишки, отхождение газов с некоторым количеством отделяемого, императивные позывы на дефекацию, стеаторея, учащение дефекации, жидкий стул, метеоризм, боли и дискомфорт в животе. Как правило, указанные нежелательные реакции являются слабовыраженными и транзиторными, возникают в первые три месяца. Частота этих нежелательных реакций увеличивается при повышении содержания жира в питании. Пациентов следует информировать о возможности возникновения указанных нежелательных реакций и обучить, как устранять их путем лучшего соблюдения диеты, особенно в отношении количества содержащегося в ней жира. Часто - вздутие живота, "мягкий" стул, боли и дискомфорт в прямой кишке, недержание кала, поражение зубов, поражение десен. Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: часто- инфекции мочевыводящих путей. Нарушения со стороны половых органов и молочной железы: часто - нерегулярные менструации. Общие расстройства и нарушения в месте введения: часто - 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 >2% и инцидентностью ≥ 1% по сравнению с плацебо (которые могли возникать в результате улучшения компенсации углеводного обмена), и часто - вздутие живота. В четырехлетием клиническом исследовании общий профиль безопасности не отличался от такового, полученного в одно- и двухлетних исследованиях. При этом общая частота возникновения нежелательных явлений со стороны желудочно-

кишечного тракта ежегодно уменьшалась на протяжении четырехлетнего периода приема орлистата. Постмаркетинговое наблюдение Перечисленные ниже нежелательные явления выявлены при спонтанных пострегистрационных сообщениях, частота неизвестна. Нарушения со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности (зуд, крапивница, сыпь, ангионевротический отек, бронхоспазм, анафилаксия). Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: ректальное кровотечение, дивертикулит, панкреатит. Нарушения со стороны нервной системы: при одновременном приеме орлистата и противоэпилептических препаратов наблюдались случаи развития судорог (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными средствами"). Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: холелитиаз, случаи поражения печени, приводящие к ее трансплантации или летальному исходу. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: буллезная сыпь. Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: гипероксалатурия, оксалатная нефропатия, которая иногда может приводить к развитию почечной недостаточности. Лабораторные данные: очень редко - повышение активности трансаминаз и щелочной фосфатазы, снижение протромбина, увеличение международного нормализованного отношения (МНО) при одновременном применении с антикоагулянтами. Зарегистрированы случаи развития гипероксалурии.

Передозировка

В клинических исследованиях у лиц с нормальной массой тела и ожирением прием орлистата однократно в дозе 800 мг или многократный прием орлистата по 400 мг 3 раза в сутки в течение 15 дней не сопровождался развитием существенных нежелательных явлений. Кроме того, у пациентов с ожирением прием орлистата в дозе 240 мг 3 раза в сутки в течение 6 мес не сопровождался 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 ористата в терапевтических дозах. В случае значительной передозировки препарата рекомендуется наблюдение пациента на протяжении 24 ч. По данным доклинических и клинических исследований, системные эффекты, связанные с липазоингибирующими свойствами орлистата, должны быть быстро обратимыми.

Взаимодействие с другими препаратами

Не выявлено взаимодействия с амитриптилином, аторвастатином, бигуанидами, дигоксином, фибратами, флуоксетином, лозартаном, фенитоином, фентермином, правастатином, нифедипином ГИТС (гастроинтестинальная терапевтическая система) и нифедипином с медленным высвобождением, сибутрамином или этанолом (на основании исследований взаимодействий между лекарственными средствами). При одновременном приеме орлистата и варфарина или других пероральных антикоагулянтов может наблюдаться снижение концентрации протромбина и повышение МНО, что приводит к изменению гемостатических показателей, поэтому необходимо следить за показателями МНО при сопутствующей терапии варфарином или другими пероральными антикоагулянтами. При одновременном приеме с орлистатом отмечалось уменьшение всасывания жирорастворимых витаминов D, E и бета-каротина. Если рекомендованы поливитамины, их следует принимать не менее чем через 2 ч после приема препарата или перед сном. При одновременном приеме орлистата и циклоспорина отмечалось снижение концентрации циклоспорина в плазме крови, что может привести к снижению иммуносупрессивной эффективности циклоспорина. Таким образом, одновременное применение орлистата и циклоспорина не рекомендуется. Тем не менее, если такое сопутствующее применение является необходимым, рекомендуется. При пероральном применении 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 в частоте и/или тяжести судорожного синдрома. В отдельных случаях Орлистат может непрямым путем снижать биодоступность пероральных контрацептивов. В случае тяжелой диареи рекомендуется применение дополнительного метода контрацепции. При одновременном приеме с левотироксином натрия, в связи с уменьшением всасывания неорганического йода и /или левотироксина натрия, может развиться гипотиреоз и/или снижение контроля гипотиреоза. Отмечались случаи снижения эффективности антиретровирусных препаратов для лечения ВИЧ (вируса иммунодефицита человека), антидепрессантов и нейролептиков (включая препараты лития), совпадающие с началом применения орлистата у ранее компенсированных пациентов.

Особые указания

Применение препарата Орлистат должно быть прекращено, если после 12 недель терапии масса тела снизилась менее чем на 5% по сравнению с начальной массой тела. Клинические исследования выявили меньшее снижение массы тела у пациентов с сахарным диабетом 2 типа, получающих Орлистат, по сравнению с пациентами без сахарного диабета, получающими Орлистат. Препарат Орлистат эффективен в плане длительного контроля массы тела (снижение массы тела, поддержание ее на соответствующем уровне и предотвращение повторного прибавления массы тела). Лечение препаратом 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)≥ 28 кг/м2) или ожирением (ИМТ ≥30 кг/м2), препарат в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой дает дополнительное улучшение компенсации углеводного обмена. В клинических исследованиях у большинства пациентов концентрации витаминов A, D, E, K и бета-каротина в ходе 4-х лет терапии орлистатом оставались в пределах нормы. Для обеспечения адекватного поступления всех питательных веществ можно назначить поливитамины. Пациент должен находиться на сбалансированной, умеренно гипокалорийной диете, содержащей не более 30% калоража в виде жиров. Рекомендуется питание, богатое фруктами и овощами. Суточное потребление жиров, углеводов и белков необходимо распределить на 3 основных приема. Вероятность побочных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта может увеличиваться, если препарат принимают на фоне питания, богатого жирами (например, 2000 ккал/сутки, из них более 30% в виде жиров, что равняется примерно 67 г жира). У пациентов с сахарным диабетом 2 типа уменьшение массы тела при лечении препаратом сопровождается улучшением компенсации углеводного обмена, что может позволить или потребовать снижения дозы гипогликемических препаратов (например, производных сульфонилмочевины). При применении орлистата наблюдались случаи ректального кровотечения. При появлении тяжелых и/или стойких симптомов кровотечения необходимо провести дополнительное обследование. Необходимо мониторировать коагуляционные параметры (например, МНО) при сопутствующей терапии пероральными антикоагулянтами. В случае развития тяжелой диареи при применении орлистата, женщинам, использующим пероральные контрацептивы, необходимо применять дополнительные меры контрацепции При применении орлистата отмечались редкие случаи развития гипотиреоза и/или нарушения его контроля. Механизм развития

данного явления неизвестен, но может быть обусловлен снижением всасывания неорганического йода и/или левотироксина натрия. Орлистат потенциально способен снижать всасывание антиретровирусных препаратов для лечения ВИЧ и снижать эффективность антиретровирусной терапии. Перед началом терапии орлистатом необходимо тщательно оценить соотношение пользы/риска у таких пациентов. При применении орлистата возможно развитие оксалатной нефропатии, которая иногда может приводить к развитию почечной недостаточности. Увеличение риска отмечается у пациентов с хронической почечной недостаточностью и/или дегидратацией.Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:Не выявлено какого-либо отрицательного влияния орлистата на способность управлять транспортными средствами и механизмами.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.