

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Орлистат

Регистрационный номер: ЛП-003030

Торговое наименование: Орлистат

Международное непатентованное наименование: орлистат

Лекарственная форма: капсулы

Состав

1 капсула содержит:

Орлистат, субстанция-пеллеты 50 % – 120 мг

Действующее вещество: орлистат – 60 мг;

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмал натрия (натрия крахмала гликолят), натрия лаурилсульфат, повидон К30;

Капсулы твердые желатиновые: [корпус капсулы: титана диоксид, желатин; крышечка капсулы: титана диоксид, краситель синий патентованный, краситель бриллиантовый черный, желатин].

Описание

Твердые желатиновые капсулы № 3 с корпусом белого цвета и крышечкой голубого цвета. Содержимое капсул – пеллеты белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Ингибитор липаз желудочно-кишечного тракта.

Код АТХ: A08AB01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Орлистат является мощным специфическим ингибитором желудочно-кишечных липаз длительного действия. Он проявляет свою терапевтическую активность в просвете желудка и тонкой кишки, образуя ковалентную связь с активным сериновым участком желудочных и панкреатических липаз. Инактивированный фермент теряет способность гидролизировать пищевые жиры (триглицериды) в абсорбируемые свободные жирные кислоты и моноглицериды. Нерасщепленные триглицериды не всасываются, что приводит к уменьшению количества калорий, усвоенных организмом, и к снижению массы тела. Терапевтическое

действие препарата осуществляется без всасывания в системный кровоток.

Наряду со снижением массы тела при длительном приеме орлистата в дозе 60 мг отмечается уменьшение таких показателей, как окружность талии, концентрация общего холестерина и уровень холестерина липопротеидов низкой плотности (ХС ЛПНП). После 6 месяцев терапии орлистатом в дозе 60 мг средний уровень холестерина снижается в среднем на 2,4 %, холестерина ЛПНП – на 3,5 %. Окружность талии через полгода приема препарата уменьшается в среднем на 4,5 см.

Фармакокинетика

Абсорбция

Всасывание орлистата минимально.

Выведение

Около 97 % вводимой дозы орлистата выводится через кишечник, из них 83 % – в неизменном виде.

Выведение орлистата и его метаболитов почками составляет менее 2 % принятой дозы. Орлистат полностью выводится через 3–5 дней. Выведение орлистата как у добровольцев с нормальной массой тела, так и у пациентов с ожирением аналогично.

Показания к применению

Снижение избыточной массы тела у взрослых (в возрасте старше 18 лет) с индексом массы тела (ИМТ) ≥ 28 кг/м² при применении только в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой, заключающейся в употреблении не более 30 % суточной калорийности рациона в виде жиров.

Противопоказания

- гиперчувствительность к орлистату и/или к любому из вспомогательных веществ в составе препарата;
- синдром хронической мальабсорбции;
- холестаза;
- одновременное применение с непрямыми антикоагулянтами (варфарином) или другими пероральными антикоагулянтами;
- одновременное применение с циклоспорином;
- период беременности и грудного вскармливания;
- возраст до 18 лет.

Если у вас есть одно из перечисленных заболеваний/состояний или факторов риска, перед применением препарата необходимо проконсультироваться с врачом.

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

В связи с отсутствием клинических данных по эффективности и безопасности применения орлистата у беременных его применение во время беременности противопоказано.

Период грудного вскармливания

В связи с тем, что данные о проникновении орлистата в грудное молоко отсутствуют, его применение в период грудного вскармливания противопоказано.

Способ применения и дозы

Внутрь, в дозе 60 мг (по 1 капсуле) 3 раза в сутки с каждым основным приемом пищи в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой с низким содержанием жира. Капсулу следует принимать непосредственно перед приемом пищи, во время приема или не позже чем через 1 час после приема пищи, запивая водой.

Если прием пищи пропущен или пища не содержит жира, прием орлистата может быть пропущен.

Максимальная суточная доза препарата составляет 180 мг (не более 3 капсул в сутки). Препарат следует принимать только в рекомендуемых дозах.

Курс терапии не должен превышать 6 мес. Если после 12 недель приема орлистата снижение массы тела не происходит (не более 5 % от первоначальной массы тела), следует проконсультироваться с врачом для решения вопроса о целесообразности дальнейшего применения.

Применение препарата у особых клинических групп пациентов

Пациенты пожилого возраста (> 65 лет)

Есть ограниченные данные о применении орлистата у людей пожилого возраста. Однако, учитывая, что всасывание орлистата минимально, коррекция дозы орлистата у данной группы пациентов не требуется.

Пациенты с печеночной и почечной недостаточностью

Действие орлистата у пациентов с печеночной и/или почечной недостаточностью не изучалось. Однако, учитывая, что всасывание орлистата минимально, коррекция дозы препарата у пациентов с печеночной и/или почечной недостаточностью не требуется.

Дети и подростки до 18 лет

Применение орлистата противопоказано у детей и подростков до 18 лет из-за недостаточности данных о безопасности и эффективности.

Применяйте препарат только согласно тому показанию, тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции.

Побочное действие

Нежелательные реакции при приеме орлистата, как правило, наблюдаются со стороны желудочно-кишечного тракта и обусловлены его фармакологическим действием.

Выявленные в клинических исследованиях (продолжительностью от 18 до 24 месяцев) нежелательные реакции со стороны желудочно-кишечного тракта в целом являлись слабо выраженными и транзиторными. Они, как правило, возникали в начале терапии (в течение первых 2 месяцев), и у большинства пациентов развился только 1 эпизод. Соблюдение диеты с низким содержанием жира уменьшает вероятность возникновения таких реакций.

Возможные нежелательные реакции распределены по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения, согласно рекомендациям ВОЗ: очень часто ($> 1/10$ случаев), часто (от $> 1/100$ до $< 1/10$ случаев), частота неизвестна (невозможно установить на основании имеющихся данных).

Нарушения, зарегистрированные в ходе клинических исследований орлистата

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Очень часто: маслянистые выделения из прямой кишки, жирные маслянистые испражнения, мягкий стул, отхождение газов с некоторым количеством отделяемого, императивные позывы на дефекацию, стеаторея, метеоризм;

Часто: боль в животе, недержание кала, жидкий стул, учащение дефекации.

Нарушения психики

Часто: чувство тревоги*.

Нежелательные реакции в пострегистрационном периоде применения орлистата

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: реакция гиперчувствительности (кожный зуд, кожная сыпь, крапивница, ангионевротический отек, бронхоспазм, анафилаксия).

Нарушения психики

Часто: чувство тревоги*.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Частота неизвестна: незначительное кровотечение из прямой кишки, дивертикулит, панкреатит.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Частота неизвестна: желчнокаменная болезнь, гепатит (в том числе серьезные случаи, требующие трансплантации или приводящие к летальному исходу).

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки

Частота неизвестна: буллезная сыпь.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Частота неизвестна: оксалатная нефропатия, которая может привести к почечной недостаточности.

Лабораторные и инструментальные данные

Частота неизвестна: снижение концентрации протромбина и увеличение показателя международного нормализованного отношения (МНО) у пациентов, принимавших орлистат совместно с непрямыми антикоагулянтами; повышение активности «печеночных» трансаминаз и щелочной фосфатазы.

*Вполне вероятно, что лечение орлистатом может привести к развитию чувства тревоги и ожидания первичных или вторичных нежелательных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта.

Если у Вас отмечаются нежелательные реакции, указанные в инструкции, или они усугубляются, или Вы заметили любые другие нежелательные реакции, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Прием разовой дозы 800 мг или прием орлистата в дозе 400 мг 3 раза в сутки в течение 15 дней как у пациентов с нормальной массой тела, так и у пациентов с ожирением не сопровождался существенными нежелательными реакциями. Кроме того, у пациентов с ожирением есть опыт применения орлистата по 240 мг 3 раза в сутки в течение 6 месяцев, что не сопровождалось достоверным увеличением частоты нежелательных реакций.

В случаях передозировки орлистата либо сообщалось об отсутствии нежелательных реакций, либо нежелательные реакции не отличались от тех, которые наблюдаются при приеме препарата в терапевтических дозах.

В случае передозировки необходима консультация врача. В случаях выраженной передозировки рекомендуется наблюдать за пациентом в течение 24 часов. По данным доклинических и клинических исследований, системные эффекты, связанные с липазаингибирующими свойствами орлистата, должны быть быстро обратимы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Если вы применяете нижеперечисленные или другие лекарственные препараты (в том числе безрецептурные), перед применением орлистата проконсультируйтесь с врачом.

При одновременном применении орлистата и циклоспорина возможно снижение концентрации циклоспорина в плазме крови, в связи с чем необходимо мониторировать содержание циклоспорина в плазме крови. Одновременное применение орлистата и циклоспорина противопоказано.

При одновременном применении орлистата с амиодароном отмечено уменьшение концентрации амиодарона в плазме крови после однократного применения, однако в связи со сложной фармакокинетикой амиодарона клиническая значимость этого явления неясна. Одновременное применение орлистата и амиодарона возможно только по рекомендации врача.

Лекарственное взаимодействие орлистата с варфарином не выявлено, однако при одновременном приеме орлистата и варфарина или других антикоагулянтов может наблюдаться снижение концентрации протромбина и повышение МНО, что приводит к изменению гемостатических показателей. Одновременное применение орлистата и варфарина или других пероральных антикоагулянтов противопоказано.

Орлистат может уменьшать абсорбцию жирорастворимых витаминов А, D, Е, К и бета-каротина. Если показан прием поливитаминов, то их следует принимать не ранее чем через 2 часа после приема орлистата или перед сном.

Орлистат может снижать всасывание противосудорожных препаратов, что может привести к возникновению судорог.

С учетом отсутствия исследований фармакокинетического взаимодействия совместное применение орлистата и акарбозы не рекомендуется.

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 развиваться гипотиреоз и/или снижение контроля гипотиреоза.

Не выявлено лекарственного взаимодействия с амитриптилином, аторвастатином, бигуанидами, дигоксином, фибратами, флуоксетином, лозартаном, фенитоином, пероральными контрацептивами, фентермином, правастатином, нифедипином, сибутрамином, этанолом.

По литературным данным и данным пострегистрационного наблюдения, орлистат может снижать всасывание антиретровирусных препаратов, применяемых для лечения ВИЧ-инфекции, что может негативно влиять на их эффективность.

Отмечались случаи снижения эффективности антидепрессантов, нейролептиков (включая препараты лития) и бензодиазепинов, совпадающие с началом применения орлистата у ранее компенсированных пациентов.

Особые указания

Диета и физические упражнения являются неотъемлемой частью программы снижения массы тела. Диетическую программу и физические упражнения рекомендуется начинать до начала терапии орлистатом. Во время приема орлистата необходимо придерживаться дробного сбалансированного умеренно гипокалорийного питания с содержанием жира не более 30 % от суточной калорийности рациона (например, при рационе 2000 ккал/сутки потребление жира должно составлять 66 г/сутки). Следует придерживаться полученных рекомендаций по режиму питания и физической активности как во время, так и после прекращения приема орлистата.

Применение орлистата приводит к увеличению количества жиров в кале уже спустя 24–48 ч после начала приема. После прекращения применения орлистата содержание жира в кале обычно возвращается к исходному в течение 48–72 ч.

Соблюдение диеты с низким содержанием жира уменьшает вероятность возникновения нежелательных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта.

Прием орлистата потенциально может ухудшать абсорбцию жирорастворимых витаминов (А, D, Е, К и бета-каротина). У подавляющего большинства пациентов, получающих орлистат в ходе четырехлетнего клинического исследования, концентрации витаминов А, D, Е, К и бета-каротина были в пределах нормальных значений. С профилактической целью рекомендуется принимать поливитамины на ночь.

При применении орлистата наблюдались случаи кровотечений из прямой кишки. При появлении кровотечений пациент должен проконсультироваться с врачом.

Поскольку снижение массы тела обычно сопровождается улучшением показателей углеводного обмена, пациенты с сахарным диабетом 2 типа перед началом терапии орлистатом должны проконсультироваться с врачом и в случае необходимости скорректировать дозу гипогликемических препаратов.

В клинических исследованиях взаимодействия между пероральными контрацептивами и орлистатом не наблюдалось. Однако орлистат может опосредованно снижать биодоступность пероральных контрацептивов, что может привести к развитию нежелательной беременности. Рекомендуется использовать методы дополнительной контрацепции в случае развития острой диареи.

Пациентам с заболеваниями почек необходимо проконсультироваться с врачом, так как возможно развитие гипероксалурии и нефропатии. Риск почечной недостаточности на фоне приема орлистата увеличивается у пациентов с ранее существовавшим заболеванием почек и/или дефицитом объема циркулирующей крови.

Пациентам, получающим терапию амиодароном, до начала приема орлистата необходимо проконсультироваться с врачом, поскольку возможны изменения показателей МНО.

При совместном применении орлистата и левотироксина натрия может развиваться гипотиреоз и/или снижение контроля гипотиреоза. Пациентам, принимающим левотироксин натрия, следует проконсультироваться с врачом перед началом терапии орлистатом, т. к. может возникнуть необходимость в приеме орлистата и левотироксина натрия в разное время, а также, возможно, потребуется коррекция дозы левотироксина натрия.

Пациентам, принимающим противоэпилептические препараты, следует проконсультироваться с врачом перед началом лечения орлистатом, т. к. они должны находиться под наблюдением в отношении возможных изменений частоты возникновения и степени выраженности судорог. В

этих случаях следует рассмотреть возможность приема орлистата и противоэпилептических препаратов в разное время.

Пациенты должны проконсультироваться с врачом перед началом применения орлистата одновременно с антиретровирусными препаратами, применяемыми для лечения ВИЧ-инфекции. Орлистат может уменьшать всасывание антиретровирусных препаратов и негативно влиять на их эффективность.

Пациентам следует прекратить прием орлистата и обратиться к врачу в случае появления таких симптомов, как желтушное окрашивание склер или кожи, зуд, потемнение мочи и потеря аппетита.

Снижение массы тела может привести к улучшению показателей артериального давления и концентрации холестерина в крови, в связи с чем пациенты, принимающие гипотензивные (снижающие артериальное давление) или гиполипидемические (снижающие содержание холестерина в крови) препараты, должны проконсультироваться с врачом перед началом приема орлистата, так как может возникнуть необходимость коррекции дозы этих препаратов.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Орлистат не оказывает влияния на способность управлять транспортными средствами, механизмами.

Форма выпуска

Капсулы, 60 мг.

По 7 или 21 капсуле в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2, 3, 4 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Производитель

АО «АЛИУМ», Россия.

Московская обл., г.о. Серпухов, рп. Оболенск, тер. Квартал Б, д. 34;

Московская обл., г.о. Серпухов, рп. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2.

**Владелец регистрационного удостоверения/ организация, принимающая претензии
потребителя**

АО «АЛИУМ», Россия.

142279, Московская обл., г. Серпухов, рп. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2.

Тел.: (4967) 36-01-07.

aliumpharm.ru

Директор по регуляторике и исследованиям

Г.У. Сетдекова

Версия 0_3