

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Орлистат, 60 мг, капсулы.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: орлистат.

Каждая капсула содержит 120 мг орлистата, субстанция-пеллеты 50 %; 60 мг орлистата.

Полный список вспомогательных веществ см. в пункте 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Капсулы.

Твердые желатиновые капсулы № 3 с корпусом белого цвета и крышечкой голубого цвета.

Содержимое капсул – пеллеты белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

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

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

В дозе 60 мг (1 капсула) 3 раза в сутки с каждым основным приемом пищи в сочетании с умеренно гипокалорийной диетой с низким содержанием жира.

Максимальная суточная доза препарата составляет 180 мг (не более 3 капсул в сутки).

Орлистат следует принимать только в рекомендуемых дозах.

Длительность терапии не должна превышать 6 месяцев. Соблюдение диеты и режима физических нагрузок рекомендуется начинать до начала приема орлистата.

Если после 12 недель приема орлистата снижение массы тела не происходит (то есть снижение массы тела менее 5 % от исходного значения), пациенту необходимо проконсультироваться с врачом для решения вопроса о целесообразности дальнейшего продолжения терапии орлистатом.

Способ применения

Внутри 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.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к орлистату и/или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- синдром хронической мальабсорбции;
- холестаз;
- одновременное применение циклоспорина;
- одновременное применение непрямых антикоагулянтов (варфарина);
- одновременное применение ситаглиптина;
- беременность и период грудного вскармливания;
- дети и подростки в возрасте до 18 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Особые указания

Диета и физические упражнения являются неотъемлемой частью программы снижения массы тела. Рекомендуется начинать диетическую программу и физические упражнения 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/день потребление жира должно составлять не более 66 г/день). Следует придерживаться полученных рекомендаций по режиму питания и физической активности как во время, так и после прекращения приема препарата.

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

Соблюдение диеты с низким содержанием жира уменьшает вероятность возникновения нежелательных реакций со стороны ЖКТ.

Прием орлистата потенциально может ухудшать всасывание жирорастворимых витаминов (А, D, Е, К и бета-каротин). У подавляющего большинства пациентов, получавших

орлистат в ходе четырехлетних клинических исследований, концентрации витаминов А, D, E, K и бета-каротина были в пределах нормальных значений. С профилактической целью рекомендуется принимать поливитамины на ночь.

Поскольку потеря 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.

Снижение массы тела при лечении может сопровождаться снижением артериального давления и концентрации общего холестерина в плазме крови. Пациентам, принимающим гипотензивные или гиполипидемические препараты, следует проконсультироваться с врачом и в случае необходимости провести коррекцию дозы этих лекарственных препаратов.

В клинических исследованиях взаимодействия между пероральными контрацептивными препаратами и орлистатом не наблюдалось. Однако орлистат может опосредованно снижать биодоступность контрацептивов для приема внутрь, что может привести к развитию нежелательной беременности. Рекомендуется применять дополнительные методы контрацепции в случае развития острой диареи.

Пациентам, страдающим заболеваниями почек, необходимо проконсультироваться с врачом, так как возможно развитие гипероксалурии и нефропатии.

Пациентам, получающим лечение амиодароном, следует проконсультироваться с врачом перед началом терапии орлистатом.

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

При одновременном применении орлистата и левотироксина может развиваться гипотиреоз и/или снижение эффективности контроля гипотиреоза. Пациентам, принимающим левотироксин, следует проконсультироваться с врачом перед началом лечения, так как может возникнуть необходимость в приеме орлистата и левотироксина в разное время, а также, возможно, потребуется коррекция дозы левотироксина.

Пациентам, принимающим противоэпилептические лекарственные препараты, следует проконсультироваться с врачом перед началом лечения орлистатом, так как они должны находиться под наблюдением на предмет возможных изменений в частоте возникновения и степени тяжести судорог. В этих случаях можно рассмотреть возможность приема орлистата и противоэпилептических лекарственных препаратов в разное время.

Пациенты должны проконсультироваться с врачом до начала одновременного применения орлистата и антиретровирусных препаратов. Орлистат может уменьшать всасывание антиретровирусных препаратов для лечения ВИЧ-инфекции и может негативно влиять на эффективность антиретровирусных препаратов для лечения ВИЧ-инфекции.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Циклоспорин

В нескольких исследованиях по изучению лекарственного взаимодействия циклоспорина при его одновременном применении с орлистатом сообщалось об уменьшении концентрации циклоспорина в плазме крови. Потенциально это может привести к уменьшению иммунодепрессивной эффективности последнего. Одновременное применение орлистата и циклоспорина противопоказано.

Непрямые антикоагулянты

При одновременном применении варфарина или других антикоагулянтов для приема внутрь с орлистатом могут изменяться значения МНО. Одновременное применение орлистата и варфарина или других антикоагулянтов противопоказано (см. раздел 4.3).

Пероральные контрацептивные препараты

В специальных исследованиях лекарственных взаимодействий было показано отсутствие взаимодействия при одновременном приеме пероральных контрацептивных препаратов и орлистата. Однако орлистат может опосредованно снижать доступность пероральных контрацептивных препаратов и в некоторых случаях привести к наступлению нежелательной беременности. При тяжелой диарее рекомендуется использовать дополнительные методы контрацепции.

Левотироксин

При одновременном приеме орлистата и левотирокина может развиваться гипотиреоз и/или снижение эффективности контроля гипотиреоза. Это может быть обусловлено снижением всасывания солей йода и/или левотирокина.

Противоэпилептические лекарственные препараты

У пациентов, получавших одновременно с орлистатом противоэпилептические лекарственные препараты (например, вальпроовую кислоту, ламотриджин), были зарегистрированы случаи возникновения судорог, в развитии которых нельзя исключить причинно-следственную связь с лекарственным взаимодействием. Орлистат может уменьшать всасывание противоэпилептических лекарственных препаратов, приводя к развитию судорог.

Антиретровирусные препараты

Исходя из пострегистрационных и литературных данных, орлистат может уменьшать всасывание антиретровирусных препаратов для лечения инфекции, вызванной вирусом иммунодефицита человека (ВИЧ-инфекции), и негативно влиять на эффективность антиретровирусных препаратов, применяемых для лечения ВИЧ-инфекции.

Жирорастворимые витамины

Прием орлистата может потенциально ухудшить абсорбцию жирорастворимых витаминов (А, D, Е, К и бета-каротин).

Акарбоза

Учитывая отсутствие исследований, изучающих фармакокинетические взаимодействия, одновременное применение орлистата с акарбозой не рекомендуется.

Амиодарон

При одновременном применении с орлистатом отмечено уменьшение концентрации амиодарона в плазме крови после однократного приема. Клиническая значимость этого эффекта для пациентов, принимающих амиодарон, неясна. Возможна необходимость коррекции дозы амиодарона на фоне терапии орлистатом. Одновременное применение орлистата и амиодарона возможно только по рекомендации врача.

Антидепрессанты, нейролептики (включая литий) и бензодиазепины

Сообщалось о случаях снижения эффективности антидепрессантов, нейролептиков (включая литий) и бензодиазепинов, прием которых совпадал с началом лечения орлистатом у ранее хорошо контролируемых пациентов. Следовательно, лечение орлистатом следует начинать только после тщательной оценки его возможного влияния у этих пациентов.

Отсутствие взаимодействия

Орлистат не взаимодействует с амитриптилином, фенитоином, флуоксетином, сибутрамином, фентермином, аторвастатином, правастатином, фибратами, бигуанидами, дигоксином, нифедипином, лозартаном и этанолом.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Орлистат противопоказан при беременности в связи с отсутствием достоверных клинических данных, подтверждающих безопасность его применения.

Лактация

Не установлено, проникает ли орлистат в грудное молоко, в связи с чем применение орлистата в период грудного вскармливания противопоказано.

Фертильность

Исследования влияния орлистата на фертильность человека не проводилось.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

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

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

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

Возможные нежелательные реакции при применении орлистата распределены по системно-органным классам (СОК) с указанием частоты их возникновения согласно рекомендациям ВОЗ: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (исходя из имеющихся данных, частоту возникновения определить невозможно).

Ниже указана частота нежелательных реакций со стороны различных органов и систем.

В ходе клинических исследований по изучению применения орлистата в дозе 60 мг продолжительностью от 18 до 24 месяцев были установлены нежелательные реакции со стороны ЖКТ, которые в целом были легкими и обратимыми. Обычно они проявлялись в начале лечения. Соблюдение диеты с низким содержанием жира уменьшает вероятность возникновения таких реакций.

Нарушения психики:

часто – тревожность.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:

очень часто – маслянистые выделения из прямой кишки, отхождение газов с некоторым количеством отделяемого, императивные позывы на дефекацию, стеаторея, метеоризм;
часто – боль в животе, недержание кала, жидкий стул, учащение дефекации.

Выявленные нежелательные реакции со стороны ЖКТ были в целом легкой степени и транзиторные. Они, как правило, возникали в начале терапии (в течение первых 3 месяцев); у большинства пациентов развивался только один эпизод.

Пострегистрационные исследования

В ходе пострегистрационного применения орлистата были отмечены нижеперечисленные нежелательные реакции, частота развития которых определена как «частота неизвестна».

Нарушения со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, включая кожный зуд, кожную сыпь, крапивницу, ангионевротический отек, бронхоспазм и анафилаксию.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: незначительное кровотечение из

прямой кишки, дивертикулит, панкреатит.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: желчнокаменная болезнь, гепатит (в том числе серьезные случаи, требующие трансплантации печени или приводящие к летальному исходу), повышение активности «печеночных» трансаминаз и щелочной фосфатазы в плазме крови.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки: буллезная сыпь.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: оксалатная нефропатия может привести к развитию почечной недостаточности.

Лабораторные и инструментальные данные: снижение концентрации протромбина и увеличение показателя международного нормализованного отношения (МНО) в плазме крови у пациентов, принимавших орлистат одновременно с непрямыми антикоагулянтами.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

«Горячая линия» Росздравнадзора: +7 800 550 99 03

e-mail: info@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <https://roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

При применении орлистата в дозе 800 мг однократно и в дозе до 400 мг 3 раза в день ежедневно в течение 15 дней как у лиц с нормальной массой тела, так и у пациентов с ожирением, значительных нежелательных реакций не выявлено. При применении орлистата в дозе 240 мг 3 раза в день в течение 6 месяцев увеличения частоты дозозависимых нежелательных реакций не отмечено.

В большинстве сообщений о случаях передозировки орлистата в пострегистрационный период указания на нежелательные реакции либо отсутствуют, либо они аналогичны тем, которые могут быть после приема рекомендованных доз препарата.

В случае передозировки необходима консультация врача. При значительной передозировке орлистата рекомендуется наблюдение за пациентом на протяжении 24 часов. По данным доклинических и клинических исследований системные эффекты, связанные с ингибированием липазы, как правило, быстро обратимы.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: ингибитор липаз желудочно-кишечного тракта.

Код АТХ: A08AB01

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

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 возможность гидролизировать пищевые жиры (триглицериды) в absorbируемые 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. По результатам клинических исследований орлистат, принимаемый ежедневно в дозе 60 мг 3 раза в день, блокирует абсорбцию примерно 25 % жиров, входящих в дневной рацион.

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 липопротеинов низкой плотности (ЛПНП) в плазме крови. После 6 месяцев терапии орлистатом в дозе 60 мг средняя концентрация общего холестерина в плазме крови снижается в среднем на 2,4 %, холестерина ЛПНП – на 3,5 %. Окружность талии через полгода приема препарата уменьшается в среднем на 4,5 см.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Всасывание орлистата минимально.

Элиминация

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.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Вспомогательные вещества

Целлюлоза микрокристаллическая

Карбоксиметилкрахмал натрия (натрия крахмала гликолят)

Натрия лаурилсульфат

Повидон К30

Корпус капсулы

Титана диоксид

Желатин

Крышечка капсулы

Титана диоксид

Краситель синий патентованный

Краситель бриллиантовый черный

Желатин

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 7 или 21 капсуле в контурной ячейковой упаковке 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.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия

АО «АЛИУМ»

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

Телефон: +7 (495) 646-28-68.

e-mail: info@binnopharmgroup.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия

АО «АЛИУМ»

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

Телефон: +7 (495) 646-28-68.

e-mail: info@binnopharmgroup.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Орлистат доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» (<http://eec.eaeunion.org>).