

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Орлистат, 60 мг, капсулы.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: орлистат.

Каждая капсула содержит орлистат субстанцию-пеллеты 50 %, эквивалентную 60 мг орлистата.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрий (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Капсулы.

Твердые желатиновые капсулы № 2.

Корпус капсулы светло-зеленого цвета, крышечка светло-голубого цвета, непрозрачные.

Содержимое капсул – белые или почти белые пеллеты.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Орлистат показан к применению для снижения избыточной массы тела у взрослых (в возрасте от 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 применения

Режим 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. 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). 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.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста (> 65 лет)

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

Пациенты с нарушением функции почек и печени

Действие орлистата у лиц с печеночной и/или почечной недостаточностью не изучалось.

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

Дети

Применение орлистата 60 мг противопоказано у детей в возрасте до 18 лет из-за недостаточности данных о безопасности и эффективности.

Способ применения

Внутрь, запивая водой, перед каждым основным приемом пищи, вместе с пищей или не позднее, чем через час после приема пищи.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к орлистату и/или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- синдром хронической мальабсорбции;
- холестаз;
- одновременное применение не прямых антикоагулянтов (варфарина);
- одновременное применение циклоsporина;
- одновременное применение ситаглиптина;
- беременность, период грудного вскармливания;
- детский возраст до 18 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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 желудочно-кишечного тракта (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, Е, К 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 применении орлистата наблюдались случаи ректального кровотечения. Если возникает это явление пациент должен проконсультироваться с врачом.

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 вируса иммунодефицита человека (ВИЧ-инфекции) и может негативно влиять на эффективность антиретровирусных препаратов для лечения ВИЧ-инфекции.

Вспомогательные вещества

Данный лекарственный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на одну капсулу, то есть, по сути, не содержит натрия.

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 международного нормализованного отношения (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 левотироксина может развиваться гипотиреоз и/или снижение эффективности контроля гипотиреоза. Это может быть обусловлено снижением всасывания солей йода и/или левотироксина.

Противоэпилептические лекарственные препараты

У пациентов, получавших одновременно с орлистатом противоэпилептические лекарственные препараты (например, вальпроевую кислоту, ламотриджин), были зарегистрированы случаи возникновения судорог, в развитии которых нельзя исключать 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 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

Доклинические исследования не выявили тератогенного и эмбриотоксического эффекта орлистата. Однако, в связи с отсутствием клинических данных о применении у беременных, орлистат противопоказан при беременности.

Лактация

Поскольку неизвестно, проникает ли орлистат в грудное молоко, он противопоказан в период грудного вскармливания.

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

Не выявлено какого-либо отрицательного влияния орлистата на способность управлять автотранспортными средствами и механизмами.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

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

Резюме нежелательных реакций

Частота побочных реакций приведена в виде следующей градации: *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* (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

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

Психические нарушения:

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 подкожных тканей: 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 МНО в плазме крови у пациентов, принимавших орлистат одновременно с непрямые 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

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

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:
<https://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

Симптомы

У лиц с нормальной массой тела и ожирением прием однократных доз орлистата (800 мг) и многократных (до 400 мг орлистата 3 раза в день на протяжении 15 дней) не вызывал

нежелательных явлений. Кроме того, у пациентов с ожирением прием орлистата в дозе 240 мг 3 раза в день на протяжении 6 месяцев не сопровождался усилением нежелательных явлений.

В большинстве сообщений о случаях передозировки орлистата говорилось об отсутствии нежелательных реакций, либо нежелательные реакции были подобны тем, которые наблюдались при применении орлистата в рекомендуемых дозах.

Лечение

В случае значительной передозировки орлистата рекомендуется наблюдение пациента на протяжении 24 часов. По данным доклинических и клинических исследований, системные эффекты, связанные с липазингибирующими свойствами орлистата, должны быть быстро обратимыми.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: препараты для лечения ожирения, кроме диетических продуктов; препараты для лечения ожирения периферического действия.

Код АТХ: A08AB01

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Орлистат - специфический ингибитор желудочно-кишечных липаз длительного действия. Действует в просвете желудка и тонкого кишечника, образуя ковалентную связь с активным сериновым участком желудочной и панкреатической липаз. Инактивированный фермент не способен расщеплять жиры пищи, поступающие в виде триглицеридов, до абсорбируемых свободных жирных кислот и моноглицеридов. Нерасщепленные триглицериды не всасываются, в связи с чем уменьшается поступление калорий в организм, что приводит к уменьшению массы тела. Терапевтическое действие препарата осуществляется без всасывания в системный кровоток. Увеличивает концентрацию жира в каловых массах через 24–48 ч после приема. Обеспечивает эффективный контроль массы тела, уменьшение депо жира.

У взрослых людей с индексом массы тела (ИМТ) ≥ 28 кг/м² орлистат в дозе 60 мг три раза в день эффективен в сочетании с гипокалорийной диетой с низким содержанием жиров. При этом основная потеря массы тела происходит в течение первых 6 месяцев лечения.

Снижение массы тела, обусловленное применением орлистата в дозе 60 мг три раза в день, сопровождается и другим благоприятным действием: снижением концентрации общего холестерина, холестерина липопротеинов низкой плотности (ЛПНП), а также уменьшением окружности талии.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Абсорбция – низкая. Спустя 8 часов после приема внутрь терапевтической дозы неизмененный орлистат в плазме крови практически не определяется (концентрация < 5 нг/мл). Признаки кумуляции отсутствуют, что согласуется с минимальным всасыванием препарата.

Распределение

Объем распределения не может быть установлен, поскольку орлистат практически не всасывается и не имеет установленной системной фармакокинетики. Орлистат более чем на

99 % связывается с белками плазмы крови *in vitro* (в основном с липопротеинами и альбумином). Орлистат в минимальных количествах может проникать в эритроциты.

Биотрансформация

Метаболизм орлистата осуществляется, главным образом, в стенке кишечника с образованием фармакологически неактивных метаболитов: М1 (четырёхчленное гидролизованное лактоновое кольцо) и М3 (М1 с отщепленным остатком N-формиллейцина).

Элиминация

Основным путем выведения является выведение через кишечник – примерно 97 % принятой дозы, из них 83 % в виде неизмененного орлистата. Суммарное выведение почками всех метаболитов орлистата составляет < 2 % от принятой дозы орлистата. Время полного выведения (через кишечник и почками) – 3–5 дней. Соотношение путей выведения орлистата у лиц с нормальной массой тела и ожирением оказалось сходным. Орлистат и метаболиты могут также выводиться с желчью.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Состав субстанции-пеллет:

Целлюлоза микрокристаллическая
Карбоксиметилкрахмал натрия
Натрия лаурилсульфат
Повидон-К30

Состав корпуса капсулы:

Индигокармин
Краситель железа оксид желтый
Титана диоксид
Желатин

Состав крышечки капсулы:

Индигокармин
Титана диоксид
Желатин

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

По 7, 10 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 21, 30, 40, 42, 50, 80, 84 или 100 капсул в банку из полиэтилентерефталата или банку полипропиленовую, укупоренную крышкой полиэтиленовой с контролем первого вскрытия, с системой «нажать-повернуть» или без нее или крышкой полипропиленовой с контролем первого вскрытия, с системой «нажать-повернуть» или без нее.

Допускается свободное пространство в банке заполнять ватой медицинской гигроскопической.

На банку наклеивают этикетку.

1, 2, 3, 4, 5, 6, 8, 10 или 12 контурных ячейковых упаковок или одну банку вместе с инструкцией по медицинскому применению (листок-вкладыш) помещают в картонную упаковку (пачку).

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия

ООО «Атолл»

445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия

ООО «Озон Фарм»

445043, Самарская обл., г.о. Тольятти, тер. ОЭЗ ППТ, магистраль 3-я, зд. 11, стр. 1.

Тел.: +79874599993, +79874599994

E-mail: ozonpharm@ozon-pharm.ru

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННЫХ УДОСТОВЕРЕНИЙ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска без рецепта.

Общая характеристика лекарственного препарата Орлистат доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) <https://eec.eaeunion.org/>.