NONAGRAS®

ORLISTAT 120 mg

Industria Paraguaya Cápsulas

V.A.: Oral

FORMULA:

Cada cápsula contiene:

Orlistat................................................................................................120 mg

Excipientes............................................................................................c.s.p.

ACCION TERAPEUTICA:

Tratamiento de la obesidad.

MECANISMO DE ACCION Y DATOS FARMACOCINETICOS:

Farmacocinética: Absorción: La exposición sistémica a Orlistat es mínima. Las concentraciones plasmáticas de Orlistat intacto son casi no detectables (< 5 ng/mL) después de la administración única de 360 mg de Orlistat. En general, después de un tratamiento prolongado a dosis terapéuticas, la detección de Orlistat intacto en plasma fue esporádico y las concentraciones fueron extremadamente bajas (< 10 ng/mL o 0,02 ng/mL) sin evidencia de acumulación, mostrando consistencia con una absorción insignificante. Distribución: El volumen de distribución no puede determinarse debido a que el fármaco se absorbe en forma mínima. In vitro, Orlistat está ligado en > 99% a las proteínas plasmáticas (lipoproteínas y albúmina fueron las principales proteínas de unión). Orlistat se fracciona en forma mínima dentro de los eritrocitos. Metabolismo: Es probable que el metabolismo de Orlistat se presente principalmente en forma pre-sistémica. Los dos metabolitos principales (M1 y M3) describen aproximadamente el 42% de la radioactividad total en plasma resultante de la fracción de minuto de la dosis que fue absorbida sistémicamente en los pacientes obesos. Estos dos metabolitos principales tienen una actividad inhibitoria de la lipasa muy débil (1000 y 2500 veces menos que Orlistat, respectivamente). En vista de esta baja actividad inhibitoria y los bajos niveles plasmáticos en dosis terapéuticas (promedio de 26 ng/mL y 108 ng/mL, respectivamente), se considera que estos metabolitos son farmacológicamente inactivos. Eliminación: Los estudios realizados en personas con peso normal u obesas han demostrado que la excreción fecal del fármaco no absorbido fue la principal vía de eliminación. Aproximadamente el 97% de la dosis administrada fue excretada en las heces y el 83% de esa fue Orlistat inalterado. La excreción renal acumulada de los materiales totales relacionados a Orlistat fue < 2% de la dosis administrada. El tiempo en alcanzar la excreción completa (fecal más urinaria) fue de 3-5 días. La eliminación de Orlistat parece ser similar entre los voluntarios de peso normal y los voluntarios obesos. Orlistat, M1 y M3 pueden excretarse por vía biliar. Farmacocinética en poblaciones especiales: Las concentraciones plasmáticas del Orlistat y sus metabolitos M1 y M3 fueron similares en pacientes pediátricos comparados con aquellos encontrados en los adultos al mismo nivel de dosificación. Las excreciones fecales diarias fueron 27% y 7% de la ingesta en la dieta en los grupos de Orlistat y placebo, respectivamente. Farmacodinamia: Orlistat es un potente inhibidor específico y reversible, de acción prolongada, de las lipasas gastrointestinales. Ejerce su actividad terapéutica en el lumen del estómago y el intestino delgado, formando una unión covalente con la serina, en el sitio activo de las lipasas gástricas y pancreáticas. La enzima inactivada es por lo tanto incapaz de hidrolizar a los triglicéridos de la dieta en ácidos grasos libres y monoglicéridos absorbibles. Debido a que los triglicéridos no hidrolizados no son absorbidos, el déficit calórico resultante tiene un efecto positivo sobre el control de peso.

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

Está indicado para el tratamiento en conjunción con un plan de alimentación hipocalórico de los pacientes obesos o pacientes con sobrepeso, incluidos los que presentan factores de riesgo asociados a la obesidad. Orlistat permite un control eficaz a largo plazo del peso (reducción, mantenimiento y prevención del aumento de peso). En pacientes con diabetes tipo 2 que tienen sobrepeso (IMC > 27 Kg/m2) o son obesos (IMC > 30 Kg/m2). El Orlistat, junto con un plan de alimentación hipocalórico, proporciona un control adicional de la glucemia cuando se utiliza en combinación con agentes antidiabéticos tales como metformina, sulfonilureas y/o insulina. El Orlistat no ha sido estudiado en pacientes pediátricos menores de 16 años de edad.

POSOLOGIA:

Dosis y vía de administración: El Orlistat se administra normalmente una cápsula (120 mg) durante la comida, inmediatamente antes o hasta 1 hora después de ellas. Si no se toma, una comida, o si dicha comida no tiene grasas en su composición, puede omitirse la dosis. Debe interrumpirse el tratamiento con Orlistat si el paciente no pierde al menos el 5% de su peso corporal durante las primeras 12 semanas de tratamiento.

CONTRAINDICACIONES:

El Orlistat está contraindicado en los pacientes con síndrome de mala absorción crónica, colestasis y en pacientes con hipersensibilidad conocida a Orlistat o a algún otro componente de la fórmula, embarazo, lactancia y menores de 16 años.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Con el objeto de asegurar una adecuada nutrición, es imprescindible considerar el uso de un suplemento multivitamínico el cual se debe tomar como mínimo 2 horas después de la administración del Orlistat o al acostarse. A los pacientes se les debe aconsejar que se adhieran a los lineamientos de una dieta hipocalórica. Puede incrementarse la posibilidad de experimentar eventos gastrointestinales cuando se administra con una dieta alta en grasas (por ejemplo en una dieta de 2000 Kcal/día, >30% de calorías de grasa equivale a > 67g de grasa). La ingesta diaria de grasa debe distribuirse en las tres comidas principales. La pérdida de peso inducida por Orlistat se acompaña de un control metabólico mejorado en la diabetes tipo 2, lo cual puede permitir o requerir de la reducción en la dosis del medicamento hipoglicémico oral (por ejemplo sulfonilureas). Los parámetros de coagulación deben monitorearse en los pacientes bajo tratamiento concomitante de anticoagulantes orales. En un estudio farmacocinético, la administración oral de amiodarona durante el tratamiento con Orlistat demostró una reducción del 25 - 30% de la exposición sistémica a la amiodarona y desetilamiodarona. No se ha estudiado el efecto de comenzar el tratamiento del Orlistat en pacientes con terapia estable del amiodarona.

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Las reacciones adversas con Orlistat son en gran parte de naturaleza gastrointestinal y están relacionadas al efecto farmacológico del fármaco en la disminución del 30% de la absorción de la grasa ingerida. Los eventos comúnmente observados son manchas de grasa, flatulencia y secreción, urgencia fecal, heces con grasa/aceite, evacuación aceitosa, incremento en la defecación e incontinencia fecal. Entre mayor es la incidencia de estos incrementos mayor es el contenido de grasa de la dieta. El consumo de una dieta baja en grasa disminuirá la probabilidad de experimentar eventos adversos gastrointestinales y esto puede ayudar a los pacientes a monitorear y regular su ingesta de grasa. Estas reacciones adversas gastrointestinales generalmente son leves y transitorias. Se presentan tempranamente en el tratamiento (dentro de los 3 meses) y la mayoría de los pacientes experimentan únicamente un episodio. Los eventos adversos gastrointestinales debido al tratamiento que generalmente se presentaron entre los pacientes tratados con Orlistat fueron: Dolor/malestar abdominal, flatulencia, heces líquidas, heces blandas, dolor/malestar rectal, alteraciones dentales, alteraciones gingivales.

Rara vez se han observado otros eventos como: Infección del tracto respiratorio superior; infección del tracto respiratorio inferior; influenza; cefalea por irregularidades menstruales, ansiedad; fatiga; infección de vías urinarias.

En pacientes diabéticos tipo 2 la notificación de reacciones adversas fue comparable a la descrita en pacientes con sobrepeso y obesos. Las únicas reacciones adversas relacionadas con el tratamiento que ocurrieron con una frecuencia >2% y con una incidencia >1% sobre el placebo fueron hipoglucemia (que podría ser el resultado de una mejora en el control de la glucemia) y distención abdominal. La pérdida de peso inducida por Orlistat se acompaña por un control metabólico mejorado en la diabetes tipo 2 la cual podría conducir a una reducción en la dosis de los medicamentos hipoglicemiantes. Se han reportado casos muy raros de erupción bulosa, incremento en los niveles de transaminasas y de fosfatasa alcalina, y casos excepcionales de hepatitis que pueden ser graves. Se han reportado disminución de niveles de protrombina, incremento de INR (Proporción Internacional Normalizada) y desbalance en el tratamiento con anticoagulantes, resultantes del cambio en parámetros hemostáticos en pacientes tratados concomitantemente con Orlistat y anticoagulantes.

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

No se han observado interacciones específicas entre medicamentos como amitriptilina, atorvastatina, biguanidas, digoxina, fibratos, fluoxetina, losartán, fenitoína, anticonceptivos orales, fentermina, pravastatina, metformina, warfarina, nifedipina, nifedipina de liberación lenta, sibutramina o alcohol. Sin embargo, cuando la warfarina y otros anticoagulantes se administran en combinación con Orlistat, los valores de la proporción internacional normalizada (INR) deben monitorearse. Se ha observado un decremento en la absorción de la vitamina D, E y beta-caroteno cuando se administran conjuntamente con Orlistat pero los niveles séricos de dichas vitaminas permanecieron dentro de los límites normales. Si se recomienda un suplemento multivitamínico, debe tomarse al menos 2 horas después de la administración de Orlistat a la hora de dormir. También se ha observado una reducción en los niveles plasmáticos de la ciclosporina cuando se administra conjuntamente con el Orlistat por lo que se recomienda monitorear más frecuentemente los niveles plasmáticos de ciclosporina. No se ha estudiado el efecto del tratamiento con Orlistat en pacientes con terapia estable de amiodarona. Es posible que se reduzca el efecto terapéutico de la amiodarona.

SOBREDOSIFICACION:

Se han estudiado las dosis únicas de 800 mg de Orlistat y las dosis múltiples de hasta 400 mg cada 8 horas, durante 15 días, en pacientes con peso normal y en pacientes obesos, sin hallazgos adversos significativos. Asimismo, las dosis de 240 mg cada 8 horas se administraron a pacientes obesos durante 6 meses, sin un incremento significativo de los hallazgos adversos. Los casos de sobredosis por Orlistat recibidos durante el periodo post-marketing, no reportaron efectos adversos o bien, efectos adversos similares a aquellos que se pueden presentar con la dosis recomendada. Si se presenta una sobredosis significativa de Orlistat, se recomienda que el paciente sea observado durante 24 horas. En base a los estudios realizados en animales y en humanos, cualquier efecto sistémico atribuible a las propiedades de Orlistat de inhibición de la lipasa, deben ser rápidamente reversibles.

En caso de sobredosis o ingestión accidental, consultar

En Paraguay, al Servicio de Toxicología del Hospital de EMERGENCIAS MEDICAS Tel.: 220-418 o el 204-800 (int. 011).

En Uruguay, consultar al Centro de Información y Asesoramiento Toxicológico. Teléf. 1722.

RESTRICCIONES DE USO:

Uso profesional.

CONSERVACION:

Almacenar a temperatura entre 15° y 30°C

PRESENTACIONES:

Envase conteniendo 30/60 cápsulas.

Este medicamento debe ser usado únicamente por prescripción médica y no podrá repetirse sin nueva indicación del facultativo.

En caso de uso de este medicamento sin prescripción médica, la ocurrencia de efectos adversos e indeseables, será de exclusiva responsabilidad de quien lo consuma.

Si ud. es deportista y está sometido a control de doping, no consuma este producto sin consultar con su médico.

Paraguay: QUIMFA S.A. D.T.: Q.F. Laura Ramírez Reg. Prof. Nº 4142 | Venta Bajo Receta. Uruguay: Importador y Representante NOVOPHAR S.A. Juncal 1355/504 |Montevideo | D.T.: Q.F. Sigrid Mathisson Ley 15.443 Venta Bajo Receta Profesional

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS