Ксеналтен



Код АТХ:

- A08AB01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Орлистат

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru

Форма выпуска:

Капсулы № 1 с корпусом и крышечкой голубого цвета белого или почти белого цвета; содержимое капсул - гранулы.

	1 капс.
орлистат	120 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 59.6 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (натрия крахамала гликолят) 38.0 мг, натрия лаурилсульфат 10.0 мг, повидон 10.0 мг, тальк 2.4 мг.
Капсулы твердые желатиновые (титана диоксид, желатин, краситель синий патентованный). Средняя масса содержимого капсулы - 240 мг.

7 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
7 шт. - упаковки контурные ячейковые (12) - пачки картонные.
21 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.
21 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
21 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
21 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
21 шт. - упаковки контурные ячейковые (12) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Специфический ингибитор желудочно-кишечных липаз. Образует ковалентную связь с активным сериновым участком желудочной и панкреатической липаз в просвете желудка и тонкого кишечника. Инактивированный фермент теряет

способность расщеплять жиры пищи, поступающие в форме триглицеридов (ТГ). Нерасщепленные ТГ не всасываются, и возникающее вследствие этого уменьшение поступления калорий в организм приводит к уменьшению массы тела. Увеличивает концентрацию жира в каловых массах через 24–48 ч после приема. Обеспечивает эффективный контроль массы тела, уменьшение депо жира.

Для проявления активности не требуется системная абсорбция орлистата, в рекомендуемой терапевтической дозе (120 мг 3 раза/сут) он примерно на 30% ингибирует всасывание поступающих с пищей жиров.

Фармакокинетика

Абсорбция - низкая; через 8 часов после приема внутрь неизмененный орлистат в плазме не определяется (концентрация ниже 5 нг/мл).

Системная экспозиция орлистата минимальна. После приема внутрь 360 мг радиоактивно меченного ^{14}C-орлистата пик радиоактивности в плазме достигался примерно через 8 ч; концентрация неизмененного орлистата была близка к пределу определения (менее 5нг/мл). В терапевтических исследованиях, включавших мониторинг образцов плазмы пациентов, неизмененный орлистат определялся в плазме спорадически, а его концентрации были низкими (менее 10 нг/мл), без признаков накопления, что согласуется с минимальным всасыванием препарата.

In vitro орлистат более чем на 99% связывается с белками плазмы, в основном с липопротеинами и альбумином. Орлистат минимально проникает в эритроциты. Метаболизируется главным образом в стенке желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) с образованием фармакологически неактивных метаболитов M1 (гидролизованноечетырехчленное лактоновое кольцо) и M3 (M1 с отщепленным N-формиллейциновым остатком). В исследовании у пациентов с ожирением, принимавших внутрь ^{14}C-орлистат, на два метаболита — M1 и M3 приходилось около 42% общей радиоактивности плазмы. M1 и M3 имеют открытое бета-лактоновое кольцо и проявляют крайне слабую ингибирующую активность в отношении липаз (в сравнении с орлистатом слабее в 1000 и 2500 раз соответственно). Учитывая низкую активность и низкую концентрацию метаболитов в плазме (около 26 нг/мл и 108 нг/мл для M1 и M3 соответственно через 2-4 ч после приема орлистата в терапевтических дозах), эти метаболиты считаются фармакологически незначимыми. Основной метаболит M1 имеет короткий период полувыведения ($T_{1/2)}$ (около 3 ч), второй метаболит выводится медленнее ($T_{1/2}$ — 13.5 ч). У пациентов с ожирением равновесная концентрация (Css) метаболита M1 (но не M3) увеличивается пропорционально дозе орлистата. После однократного приема внутрь 360 мг ^{14}C-орлистата пациентами с нормальной массой тела и страдающими ожирением, выделение невсосавшегося орлистата через кишечник являлось основным путем выведения. Орлистат и его метаболиты M1 и M3 также подвергаются экскреции с желчью. Около 97% введенного радиоактивно меченного вещества выводилось с фекалиями, в т.ч. 83% — в неизмененном виде.

Совокупная почечная экскреция общей радиоактивности при приеме 360 мг ^{14}C-орлистата составила менее 2%. Время полной элиминации с фекалиями и мочой— 3-5 дней. Выведение орлистата оказалось сходным у пациентов с нормальной массой тела и с ожирением. На основании ограниченных данных $T_{1/2}$ абсорбированного орлистата колеблется в пределах 1-2 ч.

Показания к применению:

Лечение ожирения, в т.ч. уменьшение и поддержание массы тела, в сочетании с гипокалорийной диетой.

Орлистат также показан для уменьшения риска повторной прибавки массы тела после ее первоначального снижения.

Орлистат показан пациентам с ожирением при индексе массы тела (ИМТ)>30 кг/м^2 или >28 кг/м^2 при наличии других факторов риска (сахарный диабет, артериальная гипертензия, дислипидемия).

(Расчет ИМТ: ИМТ = М/Р^2, где М — масса тела, кг; Р — рост, м.)

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Ожирение
- Сахарный диабет

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к орлистату или другим компонентам препарата;

— синдром мальабсорбции;

— холестаз;

— одновременный прием с циклоспорином;

— беременность;

— кормление грудью;

— возраст до 18 лет.

С *осторожностью* при наличии гипероксалурии в анамнезе, нефролитиаза (кальциевые оксалатные камни).

Способ применения и дозы:

Внутрь, 120 мг (1 капсула) 3 раза/сут во время каждого приема пищи или не позднее чем через 1 ч после еды (если пища не содержит жира, то прием можно пропустить).

Побочное действие:

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующему: очень часто >1/10; часто > 1/100, < 1/10; иногда > 1/1000, <1/100; редко> 1/10 000, <1/1000; очень редко < 1/10 000, включая отдельные сообщения.

Со стороны ЖКТ: очень часто — маслянистые выделения из прямой кишки, выделение газов с некоторым количеством отделяемого, императивные позывы на дефекацию, стеаторея, учащение дефекации, жидкий стул, метеоризм, боли или дискомфорт в животе. Как правило, указанные побочные реакции являются слабовыраженными и транзиторными, возникают на ранних этапах лечения (в первые 3 месяца). Частота этих нежелательных реакций увеличивается при повышении содержания жира в питании. Больных следует информировать о возможности возникновения указанных побочных реакций и обучить, как устранять их путем лучшего соблюдения диеты, особенно в отношении количества содержащегося в ней жира. Часто - мягкий стул, боли или дискомфорт в прямой кишке, недержание кала, вздутие живота, поражение зубов, поражение десен.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень часто - инфекции верхних дыхательных путей; часто - инфекции нижних дыхательных путей.

Со стороны иммунной системы: редко - зуд, крапивница, сыпь, ангионевротический отек, бронхоспазм, анафилаксия.

Со стороны нервной системы: очень часто - головные боли.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко - повышение активности трансаминаз и щелочной фосфатазы, гепатит.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: часто - инфекции мочевыводящих путей.

Прочие: очень часто - грипп; часто - дисменорея, тревога, слабость.

Если любые из указанных в инструкции побочных действий усугубляются, или вы заметили любые другие побочные действия, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка:

Случаи передозировки не описаны.

Однократный прием 800 мг орлистата или его многократный прием в дозе до 400 мг 3 раза/сут в течение 15 дней людьми с нормальной массой тела и с ожирением не сопровождался значимыми побочными явлениями.

Если выявлена значительная передозировка орлистата, следует наблюдать за состоянием пациента в течение 24 ч. По данным исследований на животных и человеке, системные эффекты, связанные с липазингибирующими свойствами орлистата, должны быть быстро обратимыми.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Орлистат противопоказано применять в период беременности в связи с отсутствием достоверных клинических данных, подтверждающих безопасность его применения.

Не установлено, проникает ли орлистат в грудное молоко, в связи с чем применение препарата Ксеналтен в период грудного вскармливания не рекомендуется.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Орлистат не влияет на фармакокинетику этанола, дигоксина (назначенного в однократной дозе) и фенитоина (назначенного в однократной дозе 300 мг), на биодоступность нифедипина (таблетки пролонгированного высвобождения). Этанол не влияет на фармакодинамику (экскреция жиров с калом) и системную экспозицию орлистата.

При одновременном применении орлистата и циклоспорина уровень последнего в плазме понижается (орлистат и циклоспорин не должны приниматься одновременно; для уменьшения вероятности лекарственного взаимодействия циклоспорин следует принимать за 2 ч до или через 2 ч после приема орлистата).

При одновременном применении варфарина или других непрямых антикоагулянтов с орлистатом может снижаться уровень протромбина и изменяться значение показателя международного нормализованного отношения (МНО), поэтому необходим контроль МНО.

Орлистат уменьшает всасывание бетакаротена, содержащегося в пищевых добавках, на 30% и ингибирует всасывание витамина Е (в форме токоферола ацетата) приблизительно на 60%.

Увеличивает биодоступность и гиполипидемический эффект правастатина, повышая его концентрацию в плазме на 30%.

При одновременном приеме с орлистатом снижается всасывание витаминов A, D, E и K. Если рекомендованы поливитамины, их следует принимать не менее чем через 2 ч после приема препарата Ксеналтен или перед сном.

Снижение массы тела может улучшить обмен веществ у больных сахарным диабетом, вследствие чего необходимо уменьшить дозу пероральных гипоглекимических лекарственных средств.

Не рекомендуется одновременное применение с акарбозой в связи с отсутствием данных о фармакокинетических взаимодействиях.

При одновременном применении с орлистатом отмечено уменьшение уровня амиодарона в плазме после однократного приема. Одновременное применение орлистата и амиодарона возможно только по рекомендации врача.

Орлистат может опосредованно снижать биодоступность пероральных контрацептивов, что может привести к развитию нежелательной беременности. Рекомендуется использовать дополнительные виды контрацепции в случае развития острой диареи.

Клинически значимые взаимодействия с дигоксином, амитриптилином, фенитоином, флуоксетином, сибутрамином, аторвастатином, правастатином, нифедипином, лозартаном, глибенкламидом, фуросемидом, каптоприлом, атенололом, и этанолом не отмечены.

Особые указания и меры предосторожности:

В период лечения необходимо соблюдать сбалансированную, низкокалорийную диету, содержащую не более 30% калоража в виде жиров и обогащенную фруктами и овощами (возможно дополнительное назначение поливитаминов для компенсации уменьшения всасывания жирорастворимых витаминов).

Перед назначением орлистата следует исключить органическую причину ожирения, например гипотиреоз.

Вероятность развития побочных явлений со стороны ЖКТ увеличивается при высоком содержании в пище жиров (более 30% суточной калорийности). Суточный прием жиров, углеводов и белков должен быть распределен между тремя основными приемами пищи. Поскольку орлистат уменьшает всасывание некоторых жирорастворимых витаминов, для обеспечения адекватного их поступления в организм пациенты должны принимать поливитаминные препараты, содержащие жирорастворимые витамины. Кроме того, содержание витамина D и бетакаротена у пациентов с ожирением может быть ниже, чем у людей, не страдающих ожирением. Поливитамины следует принимать за 2 ч до или через 2 ч после приема орлистата, например перед сном. Прием орлистата в дозах, превышающих 120 мг 3 раза/сут, не обеспечивает дополнительного эффекта.

В случае, если одновременного приема орлистата с циклоспорином избежать невозможно, необходим постоянный мониторинг содержания циклоспорина в плазме.

У пациентов, не получавших профилактически витаминные добавки, при двух и более последовательных визитах к врачу на протяжении первого и второго годов лечения орлистатом было зафиксировано понижение уровня витаминов в плазме.

У некоторых пациентов на фоне орлистата может увеличиваться содержание оксалатов в моче.

Как и для других препаратов для уменьшения массы тела, у некоторых групп пациентов (например, с нервной

анорексией или булимией) существует вероятность злоупотребления орлистатом.

Поскольку абсорбция витамина K при приеме орлистата может уменьшаться, у пациентов, получающих орлистат на фоне длительного постоянного приема варфарина, следует контролировать параметры свертывания крови.

Индукция орлистатом потери массы тела может сочетаться с улучшением метаболического контроля сахарного диабета, что потребует уменьшения доз пероральных гипогликемических средств (производных сульфонилмочевины, метформина и др.) или инсулина.

Если после 12 недель терапии препаратом Ксеналтен снижение массы тела составило менее 5% от первоначальной, необходима консультация врача для решения вопроса о необходимости продолжения лечения орлистатом.

Лечение не должно продолжаться более 2 лет.

Ксеналтен не предназначен для применения в детской практике.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не оказывает влияния на способность к управлению транспортными средствами и обслуживанию движущихся механизмов.

Применение в детском возрасте

Ксеналтен не предназначен для применения в детской практике.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ksenalten