



## XENICAL 120 MG 84 CAPSULAS

### [COMPOSICION](#)

### [ACCION Y MECANISMO](#)

### [FARMACOCINETICA](#)

### [INDICACIONES](#)

### [POSOLOGIA](#)

### [CONTRAINDICACIONES.](#)

### [PRECAUCIONES](#)

### [INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS](#)

### [EFECTOS ADVERSOS](#)

### [ADVERTENCIAS ESPECIALES](#)

### [INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO](#)

### [EMBARAZO](#)

### [MADRES LACTANTES](#)

### [USO EN NIÑOS](#)

### [USO EN ANCIANOS](#)

#### COMPOSICION POR UNIDAD

ORLISTAT	120,00	MILIGRAMOS
----------	--------	------------

#### ACCION Y MECANISMO

Antiobesidad. Orlistat es un inhibidor reversible (aunque muy lento), potente y específico de las lipasas gastrointestinales. Esto conduce a una reducción de las grasas contenidas en los alimentos de alrededor del 30%. Las lipasas son responsables de la hidrólisis de los triglicéridos, que constituyen la forma mayoritaria de la grasa presente en los alimentos. No precisa de absorción gastrointestinal para ejercer la acción. Actúa en el lumen gástrico e intestinal formando un enlace covalente con el resto serina de las lipasas, inactivándolas para la hidrólisis de triglicéridos. Los triglicéridos no absorbidos contribuyen a un menor aporte calórico de la dieta y, por tanto a la reducción de peso. Reducir aproximadamente un 30% la absorción de grasa, que equivale a una reducción de aproximadamente 200-300 kcal/día en una dieta normal de 2000 kcal/día.

#### FARMACOCINETICA

Vía oral:

- Absorción: Los estudios realizados han demostrado una absorción oral de orlistat mínima. Las concentraciones plasmáticas no eran detectables (< 5 ng/ml) a las 8 h de la administración oral.
- Distribución: El volumen de distribución no ha podido determinarse, puesto que la cantidad absorbida del medicamento es mínima. En estudios "in vitro", el orlistat se une en > 99% a las proteínas plasmáticas. La cantidad en eritrocitos fue mínima.
- Eliminación: Es probable que el orlistat se metabolice principalmente en la pared gastrointestinal. Según un estudio con pacientes obesos, de la fracción mínima absorbida sistémicamente, dos metabolitos principales, M1 (hidrolización del anillo de lactona en posición 4) y M3 (M1 con el radical N-formil leucina eliminado), representan aproximadamente el 42 % de la concentración plasmática total. M1 y M3 poseen una actividad inhibitora de lipasa extremadamente baja junto con mínimos niveles plasmáticos a dosis terapéuticas, por lo que se considera que carecen de importancia farmacológica.

La vía principal de eliminación ha sido la excreción fecal del medicamento no absorbido según los estudios llevados a cabo. Aproximadamente el 97% de la dosis administrada se excreta en las heces (83% de forma inalterada). La excreción renal acumulada de todos los compuestos relacionados con orlistat fue < 2% de la dosis administrada. El tiempo de excreción completa fue de 3-5 días. Tanto el orlistat como el M1 y M3 se excretan por vía biliar.

## INDICACIONES

- [Obesidad]: tratamiento de pacientes obesos con un índice de masa corporal (ICM)  $> \text{ó} = 30 \text{ kg/m}^2$  o pacientes con sobrepeso (ICM  $> \text{ó} = 28 \text{ kg/m}^2$ ) con factores de riesgo asociados, junto con una dieta hipocalórica moderada.

Se iniciará tratamiento con orlistat únicamente si la dieta por sí sola ha producido previamente una pérdida de peso de al menos 2,5 kg durante un periodo de 4 semanas consecutivas. El tratamiento con orlistat se deberá interrumpir si los pacientes no han perdido al menos el 5% del peso corporal determinado al inicio del tratamiento después de 12 semanas.

## POSOLOGIA

- [Obesidad]:

- Adultos, oral: 120 mg, inmediatamente antes, durante o hasta 1 h después de cada comida principal (dosis superiores de 120 mg 3 veces al día no han mostrado beneficio adicional). Si una comida no se toma o no contiene grasa, omitir la dosis. El efecto de orlistat se traduce en aumento de la grasa fecal, apreciándose a las 24-48 h de la administración. No exceder los 2 años de tratamiento (falta de estudios).

El paciente deberá seguir una dieta nutricionalmente equilibrada, moderadamente hipocalórica, con aproximadamente el 30% de las calorías provenientes de las grasas. Se recomienda que la dieta sea rica en frutas y verduras. La ingesta diaria de grasa, carbohidratos y proteínas debe distribuirse entre las tres comidas principales.

- Pacientes especiales: no se ha estudiado el efecto de orlistat en pacientes con trastornos hepáticos y/o renales, niños ni ancianos.

## CONTRAINDICACIONES.

Contraindicado en hipersensibilidad conocida al orlistat o a algún otro de los componentes de la cápsula, así como en síndrome de malabsorción crónica y colestasis.

## PRECAUCIONES

- Diabetes: En ensayos clínicos, la disminución de peso por tratamiento con orlistat fué menor en pacientes con diabetes tipo II que en pacientes no diabéticos. Se recomienda monitorización estrecha del tratamiento antidiabético cuando se administre orlistat.

- Vitaminas liposolubles: el tratamiento con orlistat puede alterar potencialmente la absorción de vitaminas liposolubles (A, D, E, K). Se aconseja dieta rica en frutas y verduras y, si se considerará la conveniencia de administrar suplemento polivitamínico, tomar por lo menos 2 h después de la administración de orlistat o a la hora de acostarse.

## INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

- Fibratos, acarbose, biguanidas, anoréxicos: no se recomienda la administración concomitante con orlistat debido a ausencia de estudios sobre interacciones farmacocinéticas.

- Vitaminas y beta-caroteno: el orlistat puede alterar potencialmente la absorción de vitaminas liposolubles, no obstante, en la mayoría de pacientes en ensayos clínicos que siguieron tratamiento con orlistat durante hasta 2 años, los niveles de vitaminas A, D, E y K y beta-caroteno permanecieron dentro de los valores normales.

- Digoxina, fenitoína, anticonceptivos orales, nifedipino GTS, nifedipino de lenta liberación, alcohol: no se han observado interacciones.

## EFFECTOS ADVERSOS

Las reacciones adversas al orlistat son principalmente de naturaleza gastrointestinal. Durante el primer año de tratamiento las reacciones comúnmente observadas fueron manchas oleosas procedentes del recto (27%), flatulencia con descarga fecal (24%), urgencia fecal (22%), heces grasas/oleosas (20%), evacuación oleosa (12%), aumento de la defecación (11%) e incontinencia fecal (8%). La incidencia de efectos adversos se redujo con el uso prolongado de orlistat. Otras reacciones adversas observadas con una frecuencia > 2% de los pacientes y una incidencia > ó = 1% superior a la de los que recibieron placebo fueron:.

- Sistema gastrointestinal: dolor o molestias abdominales, flatulencia, heces líquidas, heces blandas, dolor o molestias rectales, alteraciones en los dientes y las encías.
- Sistema respiratorio: infección de las vías respiratorias altas y bajas.
- Mecanismos de resistencia: gripe.
- Sistema nervioso central: cefalea.
- Trastornos reproductivos: irregularidad menstrual.
- Trastornos psiquiátricos: ansiedad.
- Generales: fatiga.
- Sistema urinario: infección de las vías urinarias.

## ADVERTENCIAS ESPECIALES

Se debe aconsejar a los pacientes que sigan las recomendaciones dietéticas que les sean dadas. Si orlistat se toma con una dieta rica en grasas (p. ej, en una dieta de 2000 Kcal/día, > 30% de las calorías provenientes de grasas equivale a > 67 g de grasa), puede aumentar la posibilidad de reacciones adversas gastrointestinales. La ingesta diaria de grasa debe distribuirse entre las tres comidas principales.

## INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO

No se ha presentado sobredosis con orlistat. Se han estudiado en individuos con peso normal y obesos dosis únicas de 800 mg y múltiples de hasta 400 mg tres veces al día durante 15 días, sin registrar efectos adversos significativos. Además, se han administrado dosis de 240 mg tres veces al día durante 6 meses a pacientes obesos.

En caso de sobredosis importante de orlistat, se recomienda vigilancia del paciente durante 24 h. Según estudios con humanos y animales, cualquier efecto sistémico atribuible a la capacidad del orlistat de inhibir las lipasas debe ser rápidamente reversible.

## EMBARAZO

Los estudios con animales de experimentación no han registrado efectos teratógenos. No hay estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas que permitan evaluar el potencial del fármaco para provocar malformaciones fetales o toxicidad fetal, no obstante, no se prevén malformaciones en el ser humano. El uso de este medicamento sólo se acepta en caso de ausencia de alternativas terapéuticas más seguras.

## MADRES LACTANTES

Se ignora si el orlistat se excreta con la leche materna y sus posibles consecuencias en el recién nacido. Se recomienda interrumpir la lactancia materna o suspender la administración de éste medicamento.

## USO EN NIÑOS

No existe suficiente experiencia clínica en este grupo de edad. Uso no recomendado.

## USO EN ANCIANOS

No existe suficiente experiencia clínica en este grupo de edad. Uso no recomendado.