

Venta Bajo Receta
Industria Argentina

Fórmula

Cada cápsula contiene: orlistat 120,00 mg. Excipientes: almidón de maíz 18,75 mg; croscarmelosa sódica 8,75 mg; povidona K-30 7,50 mg; lactosa 92,50 mg; estearato de magnesio 2,50 mg.

Acción Terapéutica: agente antiobesidad de acción periférica.

Indicaciones: OLEOFIN está indicado para el tratamiento a largo plazo de pacientes obesos (IMC *≥ 30) o con severo sobrepeso (IMC *: ≥ 28 kg/m²) con factores de riesgo tales como diabetes tipo II, hiperlipidemia e hipertensión asociado con una dieta hipocalórica moderada. El tratamiento con orlistat de pacientes no diabéticos debe comenzarse únicamente si la dieta sola ha producido previamente un descenso de peso de por lo menos 2,5 kg en un período de 4 semanas consecutivas. El tratamiento con orlistat debe ser suspendido después de 12 semanas en los pacientes que no hayan perdido por lo menos 5% de su peso corporal respecto del peso al inicio del tratamiento.

* IMC = Índice de masa corporal = $\frac{\text{peso en kg}}{(\text{altura en m})^2}$

Acción Farmacológica: orlistat es un inhibidor potente, específico y de larga acción de las lipasas gastrointestinales. Su efecto terapéutico lo ejerce en la cavidad gástrica y en la luz del intestino delgado mediante la formación de un enlace covalente en el sitio activo de la serina de las lipasas gástrica y pancreática. La inactivación enzimática impide la hidrólisis de las grasas, en forma de triglicéridos, ácidos grasos libres y monoglicéridos absorbibles. Dado que los triglicéridos no digeridos no se absorben, el déficit calórico resultante tiene un efecto positivo para el control del peso. En consecuencia, no es necesaria la absorción del fármaco para que ejerza su actividad.

Farmacocinética

Absorción

Los estudios realizados en voluntarios de peso normal y con sobrepeso han puesto de manifiesto que el grado de absorción del orlistat y de sus metabolitos es mínimo (menor del 3%). A las 8 horas de administrarlo por vía oral, la concentración plasmática de fármaco intacto ya está indetectable (menos de 5 ng/ml).

Después de la administración de dosis terapéuticas, la detección plasmática de orlistat intacto fue, en general, esporádica y las concentraciones sumamente bajas (menor de 10 ng/ml ó 0,02 μmol), sin signos de acumulación y compatible con una absorción insignificante.

Distribución

El volumen de distribución de orlistat no ha podido determinarse, puesto que se absorbe en cantidad ínfima y no tiene una farmacocinética sistémica definida. In vitro, el orlistat se une en más del 99% a las proteínas plasmáticas (principalmente a las lipoproteínas y a la albúmina). La cantidad de orlistat presente en los eritrocitos es mínima.

Metabolismo

De acuerdo con los datos obtenidos en animales, es probable que el orlistat se metabolice

1

K).

En la mayoría de los pacientes tratados con orlistat en un plazo de hasta dos años en los estudios clínicos los niveles de vitaminas A, D, E y K y de betacaroteno permanecieron dentro de los valores normales. Con el fin de asegurar una adecuada nutrición, se debe aconsejar a los pacientes que sigan una dieta rica en frutas y verduras. Puede considerarse el empleo de un suplemento multivitamínico. Si se recomienda un suplemento multivitamínico, debe ser tomado por lo menos dos horas después de la ingestión de orlistat o a la hora de acostarse. Se ha observado un descenso de la concentración plasmática de ciclosporina A tras su coadministración con orlistat. Por ello, se recomienda vigilar con frecuencia mayor de la habitual las cifras plasmáticas de ciclosporina cuando se administre junto con OLEOFIN. Se recomienda un intervalo de tres horas entre la ingestión de ambas medicaciones (véase Interacciones).

Embarazo y Lactancia: en los estudios de reproducción realizados en animales no se detectaron riesgos para los fetos; si embargo, no se han llevado a cabo estudios controlados en la mujer embarazada. No obstante, dado que los resultados de los estudios en animales no siempre predicen la respuesta humana, OLEOFIN no debe utilizarse durante el embarazo. La secreción de orlistat en la leche humana no ha sido investigada. Por lo tanto, OLEOFIN no debe ser indicado durante la lactancia.

Reacciones adversas: la mayor parte de las reacciones adversas a orlistat son gastrointestinales y están relacionadas con la acción farmacológica de inhibir la absorción de las grasas ingeridas. Las reacciones habitualmente observadas son manchas oleosas (27%), flatulencia con descarga fecal (24%), urgencia fecal (22%), heces grasas u oleosas (20%), aumento de las deposiciones (11%) e incontinencia (8%).

La incidencia de estas reacciones crece a medida que aumenta el contenido en grasas de la dieta. También pueden presentarse dolor abdominal (20,5%) y heces acuosas (15,8%). Otros efectos adversos relacionados con el tratamiento que se manifestaron con una frecuencia mayor del 2% y con una incidencia igual o mayor del 1% respecto del placebo fueron:

Tracto gastrointestinal: dolor o malestar abdominal, flatulencia, heces líquidas, heces blandas, dolor o malestar rectal, trastornos dentales y gingivales.
Tracto respiratorio: infección del tracto respiratorio superior e inferior.
Sistema inmune: gripe.
Sistema nervioso central: cefalea.
Trastornos reproductivos: irregularidad en la menstruación.
Trastornos psiquiátricos: ansiedad.
Trastornos generales: fatiga.
Tracto urinario: infecciones urinarias.

Reacciones de hipersensibilidad: se han comunicado raros casos de hipersensibilidad. Los principales síntomas clínicos son: prurito, rash, urticaria, angioedema y anafilaxia. Los efectos adversos registrados en los pacientes con diabetes tipo II fueron similares a los comunicados en pacientes obesos o con sobrepeso. Los únicos efectos adversos descritos en este grupo de tratamiento que se presentaron con una frecuencia mayor del 2% y una diferencia igual o mayor del 1% respecto del placebo fueron hipoglucemia y sensación de tensión abdominal.

En los estudios clínicos estos efectos farmacológicos fueron generalmente leves y transitorios y no condujeron a la suspensión del tratamiento. Los efectos colaterales gastrointestinales se presentaron en los primeros tres meses de tratamiento y la mayoría de los pacientes experimentó solamente un episodio. Solamente 3% de los pacientes tuvo más de dos episodios de cualquiera de los mencionados anteriormente. Se debe informar a los pacientes sobre la posibilidad de que se presenten trastornos gastrointestinales y sobre la mejor forma de proceder, por ejemplo, ajustar la dieta, sobre todo en el porcentaje de grasas ingeridas. El consumo de una dieta baja en grasas reduce la probabilidad de que se manifiesten efectos adversos gastrointestinales. El conocimiento de estos valores

3

Laboratorios CASASCO S.A.I.C. - Boyacá 237 - Buenos Aires

3

Laboratorios CASASCO S.A.I.C. - Boyacá 237 - Buenos Aires

3

Información para el paciente:

Antes de usar este medicamento

El presente prospecto es para usted y debe leerlo detalladamente antes de comenzar el tratamiento con OLEOFIN, dado que la información que contiene es importante y está expresada en un lenguaje sencillo para su mejor comprensión.

Recuerde que este medicamento debe ser indicado por el médico.

OLEOFIN es un medicamento de *Venta Bajo Receta*, útil como tratamiento a largo plazo de la obesidad, así como también del sobrepeso cuando hay factores de riesgo asociados, tales como la elevación de la presión arterial y de las concentraciones de azúcar (diabetes tipo II) y colesterol en la sangre. Debe estar acompañado de una dieta levemente hipocalórica.

Uso apropiado del medicamento

Siga las indicaciones de su médico sobre el modo de tomar este medicamento, de lo contrario no obtendrá todos los beneficios posibles de OLEOFIN.

La dosis recomendada de OLEOFIN es una cápsula de 120 mg con cada una de las tres comidas principales del día.

Es decir, que usted tomará una cápsula con el desayuno, otra con el almuerzo y otra con la cena. Las cápsulas pueden tomarse durante el transcurso de una comida o hasta una hora después.

Si usted saltea una comida o si ésta no contiene, grasa (por ej.: una fruta o un yogurt descremado) puede omitir la dosis de OLEOFIN.

El tratamiento con OLEOFIN debe ir acompañado de una dieta equilibrada, que aporte menos del 30% del total de las calorías provenientes de las grasas. Esta dieta debe ser confeccionada por su médico o nutricionista.

Asimismo, la cantidad ingerida diariamente de grasa debe distribuirse entre las tres comidas principales del día.

Tenga en cuenta que si aumenta el contenido de grasa de su dieta, existen mayores probabilidades de que se produzcan efectos adversos gastrointestinales (ver Reacciones adversas). Además, si aumenta excesivamente las calorías ingeridas, puede anularse el efecto adelgazante de la medicación.

Olvido de una o más dosis

Si alguna vez olvida tomar su medicamento, tómelo tan pronto como se acuerde, siempre que sea antes de pasada una hora desde la última comida, y continúe luego a las horas habituales. No debe tomar una dosis doble.

Si ha olvidado tomar varias dosis informe a su médico y siga sus consejos.

No cambie la dosis prescrita, salvo que se lo indique su médico.

Forma y vía de administración

Las cápsulas de OLEOFIN deben tomarse enteras, sin masticar, acompañadas de agua.

Duración del tratamiento

OLEOFIN es un fármaco adecuado para su tratamiento a largo plazo; en todos los casos debe seguir las instrucciones de su médico.

Modo de conservación

No tome las cápsulas después de la fecha de vencimiento indicada en el envase.

Los blisters deben conservarse a temperatura inferior a 25°C.

Efectos indeseables

La mayoría de las reacciones adversas relacionadas con la ingesta de OLEOFIN se deben a su

5

principalmente en la pared gastrointestinal. Según un estudio realizado en pacientes obesos, de la fracción ínfima de la dosis absorbida sistémicamente, dos metabolitos principales, el M1 (anillo de lactona de 4 eslabones hidrolizado) y el M3 (M1 con el radical N-formil-leucina fragmentado), constituyen aproximadamente el 42% de la concentración plasmática total.

M1 y M3 tienen un anillo de β-lactona abierto y su actividad inhibidora sobre las lipasas es sumamente baja (1.000 y 2.500 veces menor que la de orlistat, respectivamente). Dada su reducida actividad inhibitoria y las bajas concentraciones plasmáticas a dosis terapéuticas (media: 26 ng/ml y 108 ng/ml, respectivamente), se considera que estos metabolitos carecen de importancia farmacológica.

Eliminación

Los estudios llevados a cabo en individuos con un peso normal y con sobrepeso han demostrado que la vía principal de eliminación es la excreción fecal del fármaco no absorbido. Aproximadamente el 97% de la dosis administrada se excreta con las heces, siendo el 83% de esta cantidad como orlistat inalterado.

La excreción renal acumulada de todos los compuestos relacionados con orlistat fue menor del 2% de la dosis administrada. El tiempo hasta la excreción completa (fecal más urinaria) fue de 3-5 días. La eliminación de orlistat parece ser similar en los voluntarios con un peso normal y con sobrepeso. Tanto el orlistat como el M1 y el M3 se excretan por vía biliar.

Posología y Modo de administración

Adultos

La dosis recomendada de OLEOFIN es de una cápsula de 120 mg con cada comida principal (desayuno, almuerzo y cena), tomada inmediatamente antes, durante el transcurso de la misma o hasta una hora después. Si la comida no se ingiere o no contiene grasa, ej.: colación tipo yogurt descremado o fruta) puede omitirse la dosis de OLEOFIN.

Los beneficios terapéuticos (incluidos el control de peso y la mejoría de los factores de riesgo) se mantienen con la administración a largo plazo.

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

Con dosis superiores a 120 mg tres veces al día no se han obtenido mejores resultados. En las determinaciones de la grasa fecal, el efecto de OLEOFIN se observa ya a las 24-48 horas posteriores a la administración. Tras la discontinuación de la terapia, el contenido de grasa fecal retorna generalmente a los niveles basales en el espacio de 48-72 horas.

Dado que no existe experiencia sobre la utilización de Orlistat por períodos mayores de dos años, la duración del tratamiento con orlistat no debe exceder ese lapso.

Insuficiencia hepática o renal: No es preciso ajustar la dosis.

Niños y adolescentes menores de 18 años: No se ha establecido la inocuidad y la eficacia en los niños y los adolescentes menores de 18 años.

Contraindicaciones: OLEOFIN está contraindicado en pacientes con síndrome de malabsorción crónica o con colestasis, así como en aquellos con hipersensibilidad conocida al orlistat o algún otro componente del producto. También está contraindicado en mujeres durante el amamantamiento.

Precauciones y Advertencias: en los ensayos clínicos realizados hasta la fecha no se han registrado efectos adversos graves o riesgos para la salud relacionados con el uso de orlistat. Se debe aconsejar a los pacientes que sigan las directivas dietéticas indicadas por el médico. Cuando orlistat se toma con una comida rica en grasas (por ej. en una dieta de 2.000 calorías/día más del 30% de calorías de origen graso equivalen a más de 67 g de grasa) puede aumentar la probabilidad de efectos adversos gastrointestinales (véase Reacciones adversas). La ingesta diaria de grasa debe distribuirse entre las tres comidas principales.

El tratamiento con orlistat puede empeorar la absorción de las vitaminas liposolubles (A, D, E y

2

Precauciones y Advertencias: en los ensayos clínicos realizados hasta la fecha no se han registrado efectos adversos graves o riesgos para la salud relacionados con el uso de orlistat. Se debe aconsejar a los pacientes que sigan las directivas dietéticas indicadas por el médico. Cuando orlistat se toma con una comida rica en grasas (por ej. en una dieta de 2.000 calorías/día más del 30% de calorías de origen graso equivalen a más de 67 g de grasa) puede aumentar la probabilidad de efectos adversos gastrointestinales (véase Reacciones adversas). La ingesta diaria de grasa debe distribuirse entre las tres comidas principales.

El tratamiento con orlistat puede empeorar la absorción de las vitaminas liposolubles (A, D, E y

2

puede ayudar al paciente a controlar y regular su ingesta de grasas. Se han registrado muy raros casos de erupción bullosa, aumentos en transaminasas y fosfatasa alcalina y excepcionalmente hepatitis, que puede ser severa.

Interacciones medicamentosas: durante la administración simultánea de orlistat se ha observado disminución de la absorción de vitamina D, E y betacaroteno. Cuando está indicado, los suplementos multivitamínicos deben ser tomados por lo menos dos horas después de la administración de OLEOFIN o antes de acostarse.

En un estudio realizado en voluntarios sanos se demostró que, según el intervalo entre la ingestión de las dos medicaciones, la administración simultánea con orlistat reduce los niveles séricos de ciclosporina en un 25-33% (destacada variabilidad interindividual).

En un paciente con trasplante cardíaco la coadministración de orlistat y ciclosporina A condujo a una reducción en las concentraciones plasmáticas de ciclosporinas A mayor de la mitad y el ABC de ciclosporina en tres cuartos. Por lo tanto, cuando OLEOFIN se administra simultáneamente con ciclosporina A, los niveles plasmáticos de esta última deben ser monitoreados con mayor frecuencia.

Dado que no se han llevado a cabo estudios de interacción farmacocinética o farmacodinámica, no se recomienda la administración simultánea de orlistat con acarbosa, tiazolidinedionas (glitazonas), gulinidas o fármacos anorexígenos.

Cuando se administran anticoagulantes en combinación con orlistat (dosis alta o tratamiento prolongado), deben monitorearse los valores RIN, Relación Normalizada Internacional (resultados del test de Quick).

En los estudios efectuados con orlistat no se han observado interacciones con medicaciones comúnmente prescritas tales como digoxina, fibratos, fenitoína, anticonceptivos orales, warfarina, pravastatina, metformina, nifedipina, glibeclamida, furosemida, captopril, atenolol o alcohol.

Sobredosificación: dosis superiores a la recomendada de 120 mg, tres veces por día, no incrementan apreciablemente el efecto terapéutico y pueden intensificar las reacciones adversas gastrointestinales.

No se ha descrito aún la sobredosis de OLEOFIN. Se han estudiado dosis únicas de 800 mg de OLEOFIN y dosis múltiples de hasta 400 mg tres veces al día durante 15 días en individuos con peso normal y con sobrepeso, sin que registraran hallazgos adversos significativos. Además, se han administrado dosis de 240 mg tres veces al día durante 6 meses a pacientes con sobrepeso.

En caso de sobredosis importante de OLEOFIN, se recomienda observar al paciente durante 24 horas. Según los estudios realizados con seres humanos y en animales, cualquier efecto sistémico atribuible a las propiedades de orlistat para inhibir las lipasas debería ser rápidamente reversible.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777.

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666/2247.

Opativamente otros Centros de Intoxicaciones.

Presentación: envases con 30 y 60 cápsulas.

Fecha de última revisión: julio de 2007

Forma de conservación:

- Conservar en lugar fresco y seco; temperatura ambiente hasta 30°C.

- Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Luis M. Radici – Farmacéutico.

MEDICAMENTO AUTORIZADO POR EL MINISTERIO DE SALUD. Certificado N° 54.522.

4

Presentación: envases con 30 y 60 cápsulas.

Fecha de última revisión: julio de 2007

Forma de conservación:

- Conservar en lugar fresco y seco; temperatura ambiente hasta 30°C.

- Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Luis M. Radici – Farmacéutico.

MEDICAMENTO AUTORIZADO POR EL MINISTERIO DE SALUD. Certificado N° 54.522.

4

acción local en el tubo digestivo. Por lo general, consisten en necesidad urgente de defecar, flatulencia con la defecación y heces grasas u oleosas. Estos efectos suelen ser leves y de aparición temprana en el tratamiento y desaparecen poco tiempo después. Hay que recordar que existe mayor probabilidad de que estos efectos adversos ocurran cuando se ingieren comidas de alto contenido graso.

Interacciones

Antes de empezar el tratamiento con OLEOFIN debe informar a su médico si está tomando otros medicamentos (incluidos los de venta libre). Esto es importante porque el tratamiento con más de un fármaco al mismo tiempo puede aumentar o disminuir su efecto.

OLEOFIN no influye en la mayoría de los medicamentos frecuentemente prescritos. Sin embargo, la pérdida de peso tiene numerosos efectos beneficiosos, como el mejor control de la presión arterial y de las concentraciones de azúcar y colesterol en la sangre, por lo que si usted recibe alguna medicación para estos trastornos, puede que sea necesario una disminución de la dosis de la misma.

En estos casos siempre debe consultar antes con su médico.

OLEOFIN debe acompañarse de una alimentación bien equilibrada, rica en frutas y verduras, ya que puede disminuir ligeramente la absorción de los suplementos de algunos nutrientes solubles en grasa, sobre todo de betacaroteno y vitamina E, pero siempre dentro del rango de normalidad. Si su dieta no es adecuadamente equilibrada es recomendable la ingesta de un complejo polivitamínico.

Recordatorio

Este medicamento es para Ud., sólo un médico puede prescribirsele. No se lo recomiende a otras personas.

Precauciones a tomar durante el tiempo en el que se utiliza OLEOFIN

Informe a su médico antes de comenzar el tratamiento con OLEOFIN si usted padece un síndrome de malabsorción crónica, es alérgico a otros medicamentos, alimentos u colorantes o está tomando otros fármacos, incluidos los de venta libre.

Este medicamento puede causar cambios sin importancia médica en la evacuación intestinal, como heces grasas u oleosas, debido a la eliminación de grasas sin digerir con la materia fecal. La probabilidad que esto ocurra puede aumentar si se toma OLEOFIN con una dieta rica en grasas.

Contraindicaciones: si es alérgico al orlistat o a algún otro componente de las cápsulas, no debe tomar OLEOFIN. Asimismo, no debe recibir OLEOFIN si su médico le ha diagnosticado una absorción deficiente de nutrientes (síndrome de malabsorción crónica) o una colestasis.

No se recomienda el empleo de OLEOFIN durante el embarazo o la lactancia.

Efectos sobre la capacidad para conducir vehículos o utilizar máquinas

OLEOFIN no afecta la capacidad para conducir vehículos o utilizar máquinas.

Medidas en caso de sobredosificación

Si usted toma más cápsulas de las prescritas, o si otra persona inadvertidamente toma su medicamento, comuníquese a su médico.

Ante cualquier duda, consulte con su médico y/o farmacéutico.

Advertencias: este medicamento no debe ser utilizado después de la fecha de vencimiento señalada en el envase.

Presentación: envases con 30 y 60 cápsulas.

Efectos sobre la capacidad para conducir vehículos o utilizar máquinas
OLEOFIN no afecta la capacidad para conducir vehículos o utilizar máquinas.

Medidas en caso de sobredosificación

Si usted toma más cápsulas de las prescritas, o si otra persona inadvertidamente toma su medicamento, comuníquese a su médico.

Ante cualquier duda, consulte con su médico y/o farmacéutico.

Advertencias: este medicamento no debe ser utilizado después de la fecha de vencimiento señalada en el envase.

Presentación: envases con 30 y 60 cápsulas.

E-1164-01 | D0864 | Act. 07/2008

6

8

7