

## **LIPOCURA** GUAYAKI

### **Orlistat**

#### *Tratamiento de la obesidad*

- 120mg. Caja x 10 cáps.
- 120mg. Caja x 30 cáps.
- 120mg. Caja x 60 cáps.

### **FORMULA**

Cada cápsula contiene:

Orlistat ..... 120 mg  
Excipientes c.s.p ..... 1 cápsula

### **ACCION TERAPEUTICA**

Tratamiento de la obesidad.

### **PROPIEDADES**

El orlistat es un inhibidor de la lipasa gastrointestinal producido por el streptomyces toxytricini que se utiliza para el tratamiento de la obesidad y el mantenimiento del peso en conjunción con una dieta hipocalórica. El orlistat actúa a nivel local, impidiendo la absorción de las grasas de la dieta.

### **INDICACIONES**

Orlistat está indicado en el tratamiento de la obesidad exógena cuando están presentes otros factores de riesgo tales como: hipertensión arterial, diabetes o dislipidemias. El tratamiento con esta medicación se debe discontinuar si la pérdida de peso es menor del 5% después de las primeras doce semanas de uso o si el individuo aumenta de peso mientras está recibiendo el tratamiento.

### **CONTRAINDICACIONES**

Está contraindicado en pacientes con el síndrome de mala absorción crónica, colestasis, así como en los que presenten hipersensibilidad conocida al principio activo (orlistat).

### **REACCIONES ADVERSAS; EFECTOS COLATERALES**

La mayor parte de las reacciones adversas son gastrointestinales y están relacionadas con su mecanismo de acción al impedir la absorción de las grasas ingeridas. Las reacciones más frecuentes son: flatulencia con evacuación fecal, urgencia fecal, heces grasas u oleosas, evacuación oleosa, aumento de las deposiciones e incontinencia fecal. La incidencia de estas reacciones es mayor a medida que aumenta el contenido de grasas en la dieta. Se debe advertir a los pacientes sobre la posibilidad de que se presenten efectos secundarios gastrointestinales. El consumo de una dieta baja en grasas disminuye la probabilidad de reacciones digestivas, por lo cual los pacientes deben vigilar y regular su in-

gestión de grasas. Estas reacciones digestivas adversas son en general leves y pasajeras. Sobrevienen al principio del tratamiento (en los 3 primeros meses) y la mayoría de los pacientes experimenta solo un episodio. Otros efectos adversos gastrointestinales son: dolor y molestias abdominales, flatulencia, heces líquidas, heces blandas, dolor y molestias rectales, trastornos dentarios y trastornos gingivales. En los ensayos clínicos, algunos pacientes con diabetes tipo 2, experimentaron bajos niveles de glicemia durante el tratamiento.

### **INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS**

Durante los estudios farmacológicos realizados no se observaron interacciones con alcohol, digoxina, metformina, fenitoína, estatinas, warfarina, anticonceptivos orales ni con nifedipina. Se ha registrado disminución de la absorción de vitaminas D, E y betacaroteno coadministrados con Orlistat, pero se conservó dentro de los rangos de referencia de normalidad. Si se recomienda un suplemento vitamínico, éste debe ser tomado por lo menos dos horas antes de la administración de Orlistat o a la hora de acostarse. Se ha observado un descenso de la concentración plasmática de ciclosporina tras su coadministración con LIPOCURA. Por esto se recomienda vigilar con mayor frecuencia de lo habitual las cifras plasmáticas de ciclosporina cuando se administre junto con LIPOCURA. La administración oral de amiodarona durante el tratamiento con orlistat puso de manifiesto una reducción del 25-30% en los niveles sistémicos de amiodarona y la desetilamiodarona. Existe la posibilidad de que disminuya el efecto terapéutico de esta droga.

### **MECANISMO DE ACCION Y FARMACOCINETICA**

El Orlistat modifica la absorción de las grasas en el intestino sin suprimir el apetito. Como se sabe, las grasas que ingerimos son moléculas grandes que para disolverse necesitan ser rotas y transformadas en moléculas más pequeñas por acción enzimática. El mecanismo de acción del orlistat se realiza sobre la enzima lipasa, que es la que degrada y reduce las moléculas de grasa de la alimentación. El 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 medi-

ante la formación de un enlace covalente en el sitio activo de la serina de la lipasa gástrica y pancreática. La inactivación enzimática impide la hidrólisis de las grasas, en forma de triglicéridos a ácidos grasos libres y monoglicéridos absorbibles. Por acción del orlistat sobre las lipasas, más del 30% de las grasas ingeridas con las comidas atraviesan el tubo digestivo sin ser digeridas ni absorbidas. De este modo el organismo no puede transformar estas calorías excesivas en tejidos adiposos de depósito. Así pues, no es necesaria la absorción sistémica del fármaco para que ejerza su actividad. La absorción digestiva de este agente es muy baja luego de su administración por vía oral y a las 8 horas no se detecta en el plasma (<5 mg/mL). El volumen de distribución y la farmacocinética son difíciles de determinar; se ha detectado una elevada ligadura proteica (>99%), principalmente con las lipoproteínas plasmáticas. Su biotransformación metabólica se realiza en la pared gastrointestinal; se han identificado dos metabolitos principales: M1 y M3, que casi están desprovistos (1.000 a 2.500 veces menos potentes que el orlistat) de acción inhibitoria sobre las lipasas. La principal vía de eliminación del fármaco es la excreción fecal (97% de la dosis administrada) y la mayor parte (83%) lo hace sin modificación. La excreción renal del fármaco y sus metabolitos es mínima (<2% de la dosis administrada).

### **PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS**

Insuficiencia renal o hepática: no es necesario ajustar dosis. La mayoría de los pacientes que han seguido hasta 2 años completos de tratamiento han presentado niveles de vitamina A, D, E, y K y de betacaroteno dentro de límites normales. Con objeto de garantizar una nutrición adecuada, puede considerarse el empleo de un suplemento multivitamínico. Se debe recomendar a los pacientes que sigan las normas dietéticas. La posibilidad de experimentar acontecimientos digestivos (ver efectos adversos) puede aumentar cuando orlistat se toma con una dieta rica en grasas (p. ej., en una dieta de 2.000 calorías/día, >30% de las calorías procedentes de las grasas equivale a >67g de grasa). El aporte diario de grasa debe distribuirse entre las tres comidas principales. Si Orlistat se toma con una comida muy rica en grasas, pueden aumentar las posibilidades de efec-

tos gastrointestinales. La pérdida de peso inducida por orlistat se acompaña de una mejoría del control metabólico en los diabéticos de tipo II, lo que permitirá o exigirá reducir la dosis de antidiabéticos orales (p. ej., sulfonilureas). Se ha observado un descenso de la concentración plasmática de ciclosporina tras su coadministración con orlistat. Por ello, se recomienda vigilar con mayor frecuencia de la habitual las cifras plasmáticas de ciclosporina cuando se administre junto con orlistat. Debe vigilarse estrechamente las pruebas de coagulación en los pacientes que reciban tratamiento simultáneo con anticoagulantes orales.

#### **POSOLOGIA Y MODO DE USO**

LIPOCURA se administra por vía oral: 1 cápsula (120 mg) con cada comida principal. Se puede ingerir inmediatamente antes, con la comida o hasta una hora después. Si el alimento no contiene grasa, puede omitirse la toma de LIPOCURA. El resultado terapéutico se observa y se mantiene con la administración a largo plazo. El tratamiento debe acompañarse con una dieta hipocalórica (30% de calorías proveniente de las grasas) y rica en frutas y verduras.

#### **SOBREDOSIS**

Los casos de sobredosis se recomienda observar al paciente durante 24 horas. Según los estudios realizados en seres humanos y animales, cualquier efecto sistémico atribuible a las propiedades de orlistat para inhibir las lipasas debería ser rápidamente reversible. Ante la eventualidad de una sobredosis concurrir al Hospital más cercano o comunicarse al Centro de Toxicología de Emergencias Médicas.

Teléfono: 220.418/9.

#### **PRESENTACIONES**

Caja conteniendo 10 cápsulas.

Caja conteniendo 30 cápsulas.

Caja conteniendo 60 cápsulas.

