

58/86

hdc

CYC



INTAORLI 60

Each hard gelatin capsule contains:
Orlistat.....60 mg
Approved colours used in capsule shells.
Dose: As directed by the Physician.
Store below 30°C, protected from light & moisture.
Specification: Manufacturer's own
Indication, administration, contraindication,
direction for use: See in the leaflet.
Mfg. Lic. No.:
Visa No.:

B. No. :
MFD : dd/mm/yy
EXP : dd/mm/yy

Manufactured by:
INTAS PHARMACEUTICALS
Camp Road, Selaqui, Dehradun, Uttarakhand - INDIA

Rx "Thuốc bán theo đơn"

Tên thuốc : **INTAORLI 60**
Viên nang gelatin cứng. Hộp 1 vỉ x 10 viên
Thành phần :
Mỗi viên chứa: Orlistat 60 mg
Chỉ định, cách dùng, chống chỉ định và các thông tin khác:
Xin xem trong phần hướng dẫn sử dụng.
GPSX, SĐK, Số lô SX, NSX, HD: Xem phần Mfg.Lic.No., Visa
No., Batch No., MFD, EXP trên vỏ hộp thuốc.
Nhà sx: **Intas Pharmaceuticals - Ấn Độ.**
Địa chỉ: Camp Road, Selaqui, Dehradun, Uttarakhand - Ấn Độ.
Nhà NK: Địa chỉ:
Bảo quản: Bảo quản dưới 30°C, tránh ánh sáng và ẩm.
Đọc kỹ hướng dẫn trước khi sử dụng.
Để thuốc xa tầm tay trẻ em.
Các thông tin khác xem trong tờ hướng dẫn sử dụng
kèm theo.

INTAS

INTAS

INTAS

INTAORLI 60

INTAS

ORLISTAT CAPSULES 60 mg
INTAORLI 60

1 Strip x 10 Capsules

Rx Prescription Medicine

Warning: To be sold by retail on the
prescription of a Registered Medical
Practitioner only.

KEEP OUT OF REACH OF CHILDREN
READ INSERT LEAFLET CAREFULLY
BEFORE USE

BỘ Y TẾ
CỤC QUẢN LÝ DƯỢC
ĐÃ PHÊ DUYỆT
Lần đầu: 04/3/2014

HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG

Thuốc này chỉ bán theo đơn của bác sĩ.
Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.
Muốn biết thêm thông tin chi tiết xin hỏi bác sĩ hoặc dược sĩ

INTAORLI 60

(viên nang Orlistat 60 mg)

THÀNH PHẦN: mỗi viên nang gelatin cứng có chứa:

Hoạt chất: Orlistat 60 mg

Tá dược: microcrystallin cellulose, natri starch glycolat, natri lauryl sulphat, talc tinh khiết, viên nang EHG màu xanh/xanh cò 1.

DƯỢC LỰC HỌC:

Orlistat là ức chế men lipases có hồi phục. Thuốc này tạo ra hoạt động trị liệu ở dạ dày và ruột non bằng cách tạo thành liên kết đồng hóa trị với phần còn lại serine có hoạt tính của men lipases tụy và dạ dày. Các enzym bất hoạt là không sẵn có để thủy phân chất béo trong chế độ ăn dưới dạng triglycerides thành acid béo tự do có thể hấp thu được và monoglycerides. Do triglycerides chưa tiêu hóa là không được hấp thu, dẫn đến việc thiếu hụt năng lượng này có tác dụng tốt để kiểm soát cân nặng. Việc hấp thu của thuốc vào hệ thống do đó là không cần thiết cho hoạt động của nó. Ở liều khuyến cáo điều trị 120 mg, 3 lần mỗi ngày, orlistat ức chế hấp thu chất béo trong chế độ ăn khoảng 30%.

DƯỢC ĐỘNG HỌC:

Hấp thu: phơi nhiễm hệ thống của orlistat là rất nhỏ. Sau khi uống liều 360 mg ¹⁴C-orlistat, hoạt động phóng xạ đạt đỉnh trong huyết tương vào khoảng 8 giờ, nồng độ trong huyết tương của orlistat phần nguyên vẹn là gần giới hạn của sự phát hiện (<5 ng/ml). Trong các nghiên cứu điều trị có theo dõi mẫu huyết tương, sự phát hiện của orlistat nguyên vẹn trong huyết tương hiếm gặp và nồng độ thấp (<10 ng/ml hoặc 0.02 µM), không có bằng chứng tích lũy và nhất quán với sự hấp thu tối thiểu.

Phân phối: orlistat gắn kết >99% với proteins huyết tương (lipoproteins và albumin là các protein gắn kết chủ yếu). Orlistat gắn kết tối thiểu vào hồng cầu.

Chuyển hóa: chuyển hóa của orlistat xuất hiện chủ yếu ở dạ dày ruột. Hai chất huyền hóa M (vòng lactone 4 thành phần được thủy phân) và M₂ (M₁ với N-formyl leucine moiety được chia tách), chiếm khoảng 42% tổng số hoạt động phóng xạ trong huyết tương.

M₁ và M₂ có một vòng beta-lactone mở và có tác dụng ức chế lipase rất yếu (tương ứng ít hơn 1000 và 2500 lần so với orlistat). Do tác dụng ức chế thấp và nồng độ thấp trong huyết tương ở liều điều trị, những chất chuyển hóa này được xem là không quan trọng về dược lý.

Chất chuyển hóa đầu tiên M₁ có thời gian bán hủy ngắn (khoảng 3 giờ) trong khi chất chuyển hóa thứ hai M₂ không còn ở tốc độ chậm hơn (thời gian bán hủy khoảng 13.5 giờ). Ở những bệnh nhân béo phì, nồng độ ở trạng thái ổn định trong huyết tương của M₁, nhưng không phải M₂, gia tăng tỉ lệ theo liều của orlistat.

Thải trừ: sau khi dùng liều đơn 360 mg ¹⁴C-orlistat trên cả người cân nặng bình thường và người béo phì, sự thải trừ qua phân của thuốc không được hấp thu được tìm thấy là đường thải trừ chính. Orlistat và các chất chuyển hóa của nó M₁ và M₂ cũng được thải trừ qua đường mật. Khoảng 97% của hoạt động phóng xạ được đưa vào được bài tiết qua phân; 83% trong số đó được tìm thấy là orlistat dưới dạng không đổi. Sự bài tiết qua thận tích lũy của tổng hoạt động phóng xạ là <2% của liều 360 mg ¹⁴C-Orlistat. Thời gian để đạt thải trừ hoàn toàn (qua phân cộng với qua nước tiểu) là 3 tới 5 ngày. Hướng hướng này của orlistat tỏ ra là tương tự giữa người có cân nặng bình thường và người béo phì. Dựa trên các dữ liệu, thời gian bán hủy của orlistat được hấp thu là vào khoảng 1 đến 2 giờ.

Dẫn số đặc biệt: Do thuốc này được hấp thu tối thiểu, các nghiên cứu trên các dẫn số đặc biệt (người cao tuổi, trẻ em, chủng tộc khác nhau, bệnh nhân bị suy thận hoặc suy gan) đã không được thực hiện.

CHỈ ĐỊNH:

Orlistat được chỉ định trong điều trị béo phì bao gồm giảm cân và duy trì cân nặng khi dùng kết hợp với chế độ ăn giảm calori. Orlistat cũng được chỉ định trong làm giảm nguy cơ tăng cân lại sau khi đã giảm cân trước đó. Nó cũng được chỉ định đối với bệnh nhân béo phì có các yếu tố nguy cơ khác (như tăng huyết áp, tiểu đường, rối loạn lipid máu).

LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG:

Orlistat 60 mg 3 lần mỗi ngày dùng kèm với bữa ăn như là một liệu pháp hỗ trợ với chế độ ăn kiêng và tập luyện.

Bệnh nhân nên được khuyến dùng bổ sung đa vitamin có chứa các vitamin tan trong chất béo để đảm bảo dinh dưỡng đầy đủ bởi vì orlistat đã cho thấy làm giảm hấp thu của một số vitamin tan trong chất béo và beta-caroten. Thêm vào đó, nồng độ của vitamin D và beta-caroten có thể thấp ở những người béo phì so với những người không bị béo phì.

Việc bổ sung nên được thực hiện một lần mỗi ngày, tối thiểu 2 giờ trước hoặc sau khi dùng orlistat, ví dụ như khi đi ngủ.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH:

Orlistat được chống chỉ định ở những bệnh nhân có hội chứng kém hấp thu mãn tính hoặc ở mật và ở những bệnh nhân được biết tăng mẫn cảm với orlistat hoặc bất kỳ thành phần nào của thuốc.

TÁC DỤNG NGOẠI Ý:

Các tác dụng ngoại ý thường gặp là đốm dầu mỡ, đầy hơi, đi tiêu khẩn cấp, phản nhiễm mỡ, sự bài tiết chất dầu, tăng đi tiêu, đi tiêu không tự chủ.

Các tác dụng ngoại ý ít gặp đã được quan sát thấy là tiêu chảy nhiễm trùng, đau/khó chịu trực tràng, rối loạn răng, rối loạn lợi, nôn, nhiễm trùng đường hô hấp dưới, đau ở đầu chi dưới, viêm khớp, đau cơ, rối loạn khớp, viêm dây chằng. Đau đầu, chóng mặt, mệt mỏi, rối loạn giấc ngủ, nổi ban, kinh nguyệt không đều, viêm âm đạo, nhiễm trùng đường niệu, lo lắng, trầm cảm, viêm tai, phù.

Khả năng gây ung thư, đột biến gen và suy giảm chức năng sinh sản:

Các nghiên cứu về khả năng gây ung thư ở chuột cống và chuột nhắt không cho thấy tiềm năng gây ung thư của orlistat ở liều tương ứng lên tới 100 mg/kg/ngày 1500 mg/kg/ngày. Đối với chuột nhắt và chuột cống, những liều này là gấp 38 và 46 lần liều hàng ngày ở người. Orlistat không gây đột biến gen hay độc tính đối với gen. Khi đưa vào cho chuột cống ở liều 400 mg/kg/ngày trong nghiên cứu về sinh sản, orlistat không quan sát thấy tác dụng ngoại ý. Đây là liều gấp 12 lần liều hàng ngày ở người.

Phụ nữ có thai: tác động gây quái thai và phụ nữ có thai loại B:

Các nghiên cứu về tác động gây quái thai được thực hiện trên chuột cống và thỏ ở liều lên tới 800 mg/kg/ngày. Không có nghiên cứu nào cho thấy độc tính đối với phôi thai hay gây quái thai. Đây là liều tương ứng gấp 23 và 47 lần liều hàng ngày ở người.

Phụ nữ cho con bú: Người ta không biết liệu orlistat có bài tiết trong sữa mẹ hay không. Do đó, orlistat không nên sử dụng cho phụ nữ có thai.

Trẻ em: Độ an toàn và hiệu quả của orlistat ở bệnh nhân trẻ em chưa được thiết lập.

Người cao tuổi: Các nghiên cứu lâm sàng của orlistat đã không bao gồm đủ số lượng các bệnh nhân 65 tuổi hoặc hơn để xác định xem liệu họ có đáp ứng khác với bệnh nhân trẻ tuổi hơn hay không.

Hãy thông báo đến bác sĩ của bạn các tác dụng không mong muốn gặp phải có liên quan đến sử dụng thuốc.

CẢNH BÁO:

Các nguyên nhân thực thể của béo phì (ví dụ nhược giáp) cần được loại trừ trước khi kê đơn orlistat

THẬN TRỌNG:

Nói chung

Các bệnh nhân nên được khuyến tuân thủ với các hướng dẫn chế độ ăn. Các biến cố đường tiêu hóa có thể gia tăng khi dùng orlistat với chế độ ăn nhiều chất béo (>30% tổng số calo hàng ngày từ chất béo). Nếu orlistat được dùng với bữa ăn rất nhiều chất béo, có khả năng tác động trên đường tiêu hóa gia tăng.

Bệnh nhân nên được khuyến dùng bổ sung đa vitamin có chứa các vitamin tan trong chất béo để đảm bảo dinh dưỡng đầy đủ bởi vì orlistat đã cho thấy làm giảm hấp thu của một số vitamin tan trong chất béo và beta-caroten. Thêm vào đó, nồng độ của vitamin D và beta-caroten có thể thấp ở những người béo phì so với những người không bị béo phì.

Việc bổ sung nên được thực hiện một lần mỗi ngày, tối thiểu 2 giờ trước hoặc sau khi dùng orlistat, ví dụ như khi đi ngủ.

Một số bệnh nhân có thể phát triển tăng nồng độ oxalate trong nước tiểu sau khi được điều trị với orlistat. Cần thận trọng khi kê đơn orlistat cho những bệnh nhân có tiền sử bị tăng oxalate trong nước tiểu hoặc bị sỏi thận calci oxalate.

Việc làm giảm cân bởi orlistat có thể đồng thời làm cải thiện kiểm soát chuyển hóa ở bệnh nhân tiểu đường, do đó có thể cần giảm liều của thuốc hạ đường huyết uống (ví dụ sulfonylureas, metformin) hoặc insulin.

Tiềm năng sử dụng không đúng: Cũng như đối với các thuốc giảm cân khác, có tiềm năng sử dụng orlistat không đúng ở



những nhóm bệnh nhân không phù hợp (ví dụ những bệnh nhân biếng ăn thần kinh hay chứng cuồng ăn).

Thông tin đối với bệnh nhân: các bệnh nhân cần đọc thông tin dành cho bệnh nhân trước khi bắt đầu điều trị với orlistat và mỗi lần được kê đơn tiếp tục.

TƯƠNG TÁC THUỐC:

Việc sử dụng rượu với orlistat không làm thay đổi dược động học của rượu cũng như dược động học của orlistat (thải trừ chất béo qua phân) hoặc hấp thu hệ thống của orlistat. Cũng như đối với nifedipin, những bệnh nhân dùng orlistat 120 mg 3 lần mỗi ngày trong 6 ngày không làm ảnh hưởng đến khả dụng sinh học của nifedipin.

Ở những bệnh nhân dùng orlistat 120 mg 3 lần mỗi ngày trong 6, 7 và 23 ngày tương ứng đối với digoxin, phenytoin và thuốc tránh thai đường uống không gây ra bất kỳ thay đổi nào về dược động học của liều đơn của những thuốc này.

Không có các nghiên cứu về tương tác thuốc được thực hiện với orlistat và cyclosporin. Do sự thay đổi về hấp thu cyclosporin đã được báo cáo với việc dùng các chế độ ăn khác nhau, cần thận trọng khi dùng đồng thời orlistat với chế độ ăn kiêng ở những người đang dùng liệu pháp cyclosporin. Một nghiên cứu về tương tác dược động học cho thấy giảm hấp thu 30% beta-caroten bổ sung khi dùng đồng thời với orlistat, orlistat ức chế hấp thu của vitamin E acetate bổ sung khoảng 80%. Tác động của orlistat lên hấp thu của vitamin D, vitamin A, và dẫn xuất vitamin K bổ sung là không được biết.

Ở những bệnh nhân dùng orlistat 80 mg 3 lần mỗi ngày trong 5 ngày, orlistat không làm thay đổi dược động học hay dược lực học (làm giảm đường huyết) của glyburide. Ở những người tăng cholesterol máu dùng orlistat 120 mg 3 lần mỗi ngày trong 10 ngày, tác động của orlistat là cộng hưởng với tác động làm giảm lipid của pravastatin. Sự gia tăng nhỏ (khoảng 30%) nồng độ pravastatin trong huyết tương đã được quan sát thấy khi dùng đồng thời với orlistat.

Việc sử dụng 120 mg 3 lần mỗi ngày trong 16 ngày không gây ra bất kỳ thay đổi nào về dược động học của warfarin (cả 2 dạng đồng phân R- và S) hay dược lực học (thời gian prothrombin và yếu tố VII trong huyết thanh). Mặc dù undercarboxylated osteocalcin, một chỉ điểm của tình trạng dinh dưỡng vitamin K, là không thay đổi khi dùng orlistat, nồng độ vitamin K có xu hướng giảm ở những người dùng orlistat. Do đó, hấp thu vitamin K có thể bị giảm với orlistat, những bệnh nhân đang dùng liều ổn định warfarin mà được kê đơn orlistat nên được theo dõi chặt chẽ sự thay đổi các thông số và đông máu.

QUÁ LIỀU:

Liều đơn 800 mg orlistat và đa liều lên đến 400 mg 3 lần mỗi ngày trong 15 ngày đã được nghiên cứu ở những người cân nặng bình thường hoặc béo phì mà không thấy các tác dụng ngoại ý đáng kể.

Khuyến cáo nên theo dõi bệnh nhân trong 24 giờ. Dựa trên các nghiên cứu trên người và động vật, tác động hệ thống của đặc tính ức chế men lipase của orlistat nên được phục hồi nhanh chóng.

ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN:

Bảo quản dưới 30°C, tránh ánh sáng và ẩm ướt.

HẠN DÙNG:

24 tháng kể từ ngày sản xuất.

TIÊU CHUẨN:

Tiêu chuẩn nhà sản xuất.

TRÌNH BÀY:

Hộp 1vi x 10 viên nang và 1 tờ hướng dẫn sử dụng.

Sản xuất bởi:

INTAS PHARMACEUTICALS

Camp Road, Selaqui, Dehradun, Uttarakhand – Ấn Độ



PHÓ CỤC TRƯỞNG
Nguyễn Văn Thanh

