

# DIECAPS®

## Orlistat VIA ORAL Cápsulas

### FORMULA

#### DIECAPS 60

Cada cápsula contiene:

**Orlistat**.....60 mg

Excipientes.....c.s.

#### DIECAPS 120

Cada cápsula contiene:

**Orlistat**.....120 mg

Excipientes.....c.s.

### PROPIEDADES

**DIECAPS** es un inhibidor potente, específico, 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 con el sitio activo de la serina de las lipasas gástrica y pancreática. La inactivación enzimática impide la hidrólisis de las grasas, en forma de triglicérido, a ácidos grasos libres y monoglicéridos absorbibles. Y dado que los triglicéridos no digeridos no se absorben, el déficit calórico resultante tiene un efecto positivo para el control del peso. Así pues, no es necesaria la absorción sistémica del fármaco para que ejerza su actividad.

### FARMACOCINETICA

**Absorción:** Los estudios realizados en voluntarios de peso normal y en obesos han puesto de manifiesto que el grado de absorción del Orlistat es mínimo. A las 8 horas de administrado por vía oral, la concentración plasmática del fármaco intacto y no intacto era detectable (5 ng/mL). Tras la administración de dosis terapéuticas, la detección plasmática de Orlistat intacto fue, en general, esporádica y la concentración era sumamente baja (10 ng/mL), sin signos de acumulación y compatible con una absorción insignificante.

**Distribución:** El volumen de distribución del Orlistat no ha podido determinarse, puesto que se absorbe en cantidad mínima 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 a los datos obtenidos en animales, parece que el Orlistat se metaboliza sobre todo 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 (con el radical N-formil-leucina fragmentado), constituyen aproximadamente el 42% de la concentración plasmática total. M1 y M3 tienen un anillo de b-lactona abierto y su actividad inhibitoria de las lipasas es sumamente baja (1000 y 2500 veces menor que la del Orlistat, respectivamente). En vista de su reducida actividad inhibitoria y de las bajas concentraciones plasmáticas a dosis media: (26 ng/mL y 108 mg/mL, respectivamente), se considera que estos metabolitos carecen de importancia farmacológica.

**Eliminación:** Los estudios llevados a cabo en individuos con un peso normal y en obesos 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 Orlistat inalterado.

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

### INDICACIONES

**DIECAPS** está indicado para el tratamiento a largo plazo, junto con una dieta hipocalórica moderada, de pacientes obesos o con sobrepeso, incluidos los que presentan factores de riesgo asociados a la obesidad. **DIECAPS** permite un control eficaz a largo plazo del peso (reducción, mantenimiento y prevención del aumento de peso). El tratamiento con **DIECAPS** conduce a una mejoría de los factores de riesgo y los trastornos asociados a la obesidad, como hipercolesterolemia, diabetes mellitus no insulino dependiente, intolerancia a la glucosa, hiperinsulinemia e hipertensión, así como a una reducción de las grasas viscerales.

### POSOLOGIA Y MODO DE ADMINISTRACION

**Adultos:** La dosis de inicio recomendada con **DIECAPS** es de una cápsula de 60 mg tres veces al día (preferiblemente 30 minutos antes o con las comidas principales o aquellas que tengan contenido graso). La dosis de 60 mg también puede emplearse en paciente con mala tolerancia a la presentación de 120 mg. La dosis recomendada para el mantenimiento es de 120 mg con cada comida principal. Si no se toma o no contiene grasa una comida, puede omitirse la dosis de **DIECAPS**. Los beneficios terapéuticos de **DIECAPS** (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 aproximadamente el 30% de las calorías provenientes de las grasas. Se recomienda que la dieta sea rica en frutas y verduras. La cantidad ingerida diariamente de grasas, carbohidratos y proteínas debe distribuirse entre las tres comidas principales. Además de la dieta se recomienda un programa de ejercicios físicos y ambos deben continuarse cuando cese el tratamiento con **DIECAPS**. Con dosis superiores a 120 mg tres veces al día no se han obtenido mejores resultados. En ancianos no es necesario ajustar la dosis.

En las determinaciones de la grasa fecal, el efecto de **DIECAPS** se observa ya a las 24-48 horas de la administración. Tras la discontinuación de la terapia, el contenido de grasa fecal retorna generalmente a los niveles basales en 48-72 horas.

**En insuficiencia hepática o renal:** No es preciso ajustar dosis.

**Niños y adolescentes menores de 18 años:** Se ha establecido la eficacia y la seguridad en adolescentes de 12 a 16 años.

### CONTRAINDICACIONES

**DIECAPS** está contraindicado en pacientes con el síndrome de malabsorción crónica, así como en los que presenten hipersensibilidad conocidas al Orlistat o algún otro componente de la cápsula.

## PRECAUCIONES

En los amplios ensayos clínicos a largo plazo realizados hasta la fecha (3300 pacientes tratados con Orlistat hasta 2 años) no se han registrado efectos adversos graves o riesgos para la salud relacionados con el uso de Orlistat (ver efectos secundarios). Se debe aconsejar a los pacientes que sigan con las directrices dietéticas (ver posología). Puede aumentar la probabilidad de reacciones gastrointestinales (ver efectos secundarios) si se toma Orlistat con una dieta rica en grasas (por ejemplo en una dieta de 2000 calorías/día; 30% de las calorías de origen graso equivalente a 67 g de grasa. La ingesta diaria de grasas debe distribuirse entre las tres comidas principales. Si Orlistat se toma con una dieta muy rica en grasas, puede elevarse la probabilidad de reacciones gastrointestinales.

**Embarazo y lactancia:** No se ha establecido la inocuidad de Orlistat en las mujeres embarazadas. En los estudios de reproducción animal no se han observado efectos embriotóxicos ni teratógenos asociados a Orlistat. Ahora bien, puesto que los estudios en animales no siempre son predictivos de la respuesta en humanos, no se debe utilizar Orlistat durante el embarazo, a menos que el beneficio esperado supere los posibles riesgos. Dado que se desconoce si Orlistat se excreta por la leche materna, las mujeres lactantes no deben tomarlo, salvo que el beneficio esperado sea mayor que los posibles riesgos.

## EFFECTOS SECUNDARIOS

La mayor parte de las reacciones adversas a Orlistat son gastrointestinales y están relacionadas con su efecto farmacológico de impedir la absorción de grasas ingeridas (ver farmacocinética). Las reacciones habitualmente observadas son manchas oleosas, aumento de la defecación e incontinencia fecal. La incidencia de estas reacciones crece a medida que aumenta el contenido en grasas de la dieta y, por consiguiente de las heces. Los pacientes deben recibir consejo acerca de la posibilidad de que se presenten efectos secundarios gastrointestinales y sobre la mejor forma de proceder, por ejemplo reforzar la dieta, sobretodo en el porcentaje de grasas contenidas. El consumo de una dieta baja en grasas disminuye la probabilidad de reacciones gastrointestinales, lo cual puede ayudar a los pacientes a vigilar y regular su ingesta de grasas. En los ensayos clínicos, estos efectos farmacológicos no se consideraron un impedimento para continuar con la terapia. Por lo general, estas reacciones adversas son leves y pasajeras. Las reacciones gastrointestinales se presentan al comienzo del tratamiento (en los 3 primeros meses), y la mayoría de los pacientes experimentan solamente un episodio. Sólo el 3% han sufrido más de dos episodios de cualquiera de las reacciones adversas.

## INTERACCIONES

No se producen interacciones con fármacos de uso frecuente como Digoxina, Fenitoína, Warfarina, Anticonceptivos Orales, Nifedipino GITS, Nifedipino Retard, Gliburida, Furosemida, Captopril y Atenolol, ni con alcohol. Sin embargo, el Orlistat incrementa la biodisponibilidad de la Pravastatina (aumento de las concentraciones plasmáticas en aproximadamente un 30%), así como su efecto hipolipemiante. En los ensayos clínicos se han utilizado concomitantemente muy diversos medicamentos, sin que se observaran interacciones adversas clínicamente significativas.

En los estudios de interacciones farmacocinéticas, el Orlistat inhibía la absorción de los suplementos orales de algunos nutrientes liposolubles, como el betacaroteno (alrededor de un tercio) y el acetato de vitamina E (alrededor de la mitad), pero no los de acetato de vitamina A, y tampoco reducía las concentraciones de vitamina K ingeridas con los alimentos. En los ensayos clínicos, disminuyeron las concentraciones de algunas vitaminas liposolubles y análogos. En la inmensa mayoría de los pacientes que siguieron el tratamiento hasta 2 años, las concentraciones de vitaminas permanecieron dentro de los niveles normales, sin que se detectaran secuelas clínicas. En los pacientes diabéticos, la pérdida de peso inducida por **DIECAPS** se acompaña de una mejoría del control metabólico, lo cual puede permitir o requerir una disminución de las dosis de hipoglucemiante oral (por ejemplo sulfonilureas).

## SOBREDOSIFICACION

En caso de sobredosis o ingestión accidental, consulte inmediatamente al centro de asistencia médica más cercano o consulte al Servicio de Información Toxicológica.

No se ha establecido aún la sobredosis de Orlistat. Se han estudiado dosis únicas de 800 mg de Orlistat y dosis múltiples de hasta 400 mg tres veces al día durante 15 días en individuos con peso normal y en obesos, sin que hubieran hallazgos adversos significativos. Además, se han administrado dosis de 240 mg tres veces al día durante 6 meses a pacientes obesos. Las dosis superiores a la recomendada de 120 mg tres veces al día no han mejorado apreciablemente la eficacia, pero sí pueden incrementar las reacciones gastrointestinales. En caso de sobredosis importante de Orlistat se recomienda observar al paciente durante 24 horas. Según los estudios realizados en humanos y animales, cualquier efecto sistémico atribuible a las propiedades de Orlistat para inhibir las lipasas debería ser rápidamente reversible.

## CONSERVACION

Este medicamento sólo podrá utilizarse hasta la fecha de caducidad, indicada con EXP en el envase. Tiras blister: consérvense a menos de 25°C y protéjense de la humedad.

## PRESENTACION

**DIECAPS 60:** Cajas conteniendo 30 y 90 cápsulas de 60 mg.

**DIECAPS 120:** Cajas conteniendo 30 y 90 cápsulas de 120 mg.

## PRODUCTO MEDICINAL.

### REQUIERE RECETA MÉDICA.

### MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.

### CONSERVAR EN LUGAR SECO, A TEMPERATURA NO MAYOR DE 30°C.

### PROTEGER DE LA LUZ.

Fabricado por:

**Laboratorios Rowe, S.R.L.**

Santo Domingo, Rep. Dominicana.

Reg. Ind. 17090.

Atención al cliente: 809-687-2701, Ext. 105



**Rowe**®