

## ORLISTATE

### **AÇÃO TERAPÊUTICA**

Antiobesidade, redutor de peso.

### **PROPRIEDADES**

Este novo agente terapêutico está dirigido para o tratamento medicamentoso da obesidade e do excesso de peso, já que modifica a absorção das gorduras no intestino, sem suprimir o apetite.

Como se sabe, as gorduras que ingerimos são moléculas grandes que, para dissolver-se, necessitam ser rompidas e transformadas em moléculas menores por ação enzimática. O mecanismo de ação do orlistat é realizado sobre a enzima lipase, que é a que degrada e diminui as moléculas de gordura da alimentação. O orlistat é um inibidor potente, específico e de ampla ação sobre as lipases gastrintestinais. Seu efeito terapêutico é exercido na cavidade gástrica e na luz do intestino delgado mediante formação de uma ligação covalente no sítio ativo da serina das lipases gástrica e pancreática. A inativação enzimática impede a hidrólise das gorduras, em forma de triglicerídeos, para originar ácidos graxos livres e monoglicerídeos absorvíveis.

### **FARMACOCINÉTICA**

Não sofre praticamente absorção, após administração oral. 99% ligam-se às proteínas plasmáticas. Tem a sua biotransformação pela parede gastrintestinal, formando os metabólitos M1 e M3. Sob a forma intacta, quase 100% tem o fármaco eliminado nas fezes, onde seu tempo de excreção total é de 3 a 5 dias.

### **INDICAÇÕES**

Redução do peso e tratamento da obesidade em conjunto com dieta hipocalórica e exercícios.

### **PRECAUÇÕES**

Nos ensaios clínicos de longa duração realizados até o presente não foram registrados efeitos adversos graves ou riscos para a saúde. Pode haver aumento de probabilidade de reações gastrintestinais (ver Reações adversas) se o orlistat for tomado com dieta rica em gorduras (por exemplo: numa dieta de 2000 calorias/dia, >30% de conteúdo lipídico correspondem a >67 g de gorduras). A ingestão diária de gorduras deve ser distribuída entre as 3 principais refeições. Não foi estabelecida a inocuidade em mulheres grávidas. Nos estudos de reprodução animal, não foi observado nem efeito. Apesar disto, dado que os estudos em animais nem sempre são preditivos da resposta em seres humanos, não deve ser utilizado durante a gravidez a menos que o benefício esperado supere os possíveis

riscos. Dado que a eliminação do orlistat pelo leite materno não é conhecida, as mulheres lactantes não devem fazer uso do medicamento, salvo que o benefício esperado seja maior que os possíveis riscos.

### REAÇÕES ADVERSAS

Esteatorréia, deficiência de vitaminas lipossolúveis -caroteno, distúrbios gastrointestinais, incontinência fecal, flatulência, dor de cabeça, ansiedade, fadiga, irregularidade menstrual.

### CONTRA-INDICAÇÕES

Hipersensibilidade ao orlistat;  
Gravidez e amamentação;  
Síndrome de má-absorção;  
< 12 anos de idade.

### POSOLOGIA

Tomar 1cp de 120 mg 3 vezes/dia junto com cada refeição.

### INTERAÇÕES

Pravastatina: tem sua concentração plasmática aumentada em cerca de 30%;  
Vitaminas lipossolúveis: podem ter sua absorção reduzida;  
O fabricante recomenda que não seja administrado juntamente com acarbose;  
Os pacientes que recebem varfarina devem ser monitorados durante o tratamento com orlistat;  
Foi relatada a ocorrência de uma diminuição, em níveis subterapêuticos, da concentração de ciclosporina em pacientes transplantados que fazem uso do orlistat.

### SUPERDOSAGEM

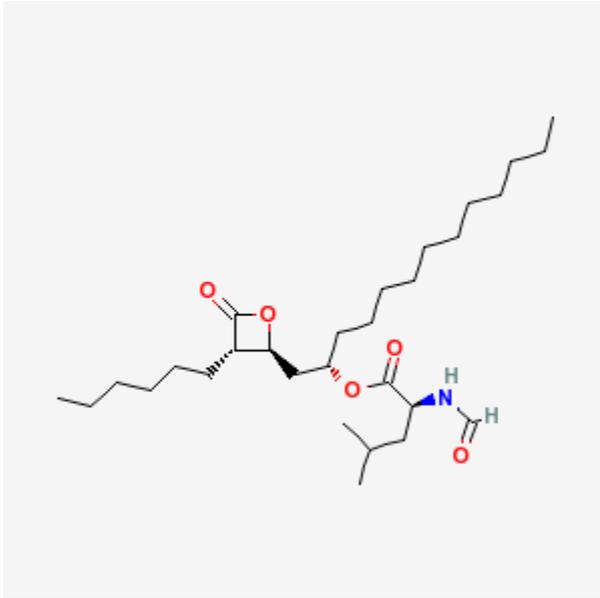
Não foi ainda estabelecida a superdosagem. Estudaram-se doses únicas de 800 mg e doses múltiplas de até 400 mg 3 vezes/dia durante quinze dias em indivíduos com peso normal e em obesos, sem que se obtivessem achados adversos significativos. Além disso, administraram-se doses de 240 miligramas 3 vezes/dia, durante 6 meses a pacientes obesos. As doses superiores à recomendada não melhoraram a eficácia do medicamento, porém podem exacerbar as reações gastrointestinais. Em caso de superdosagem, recomenda-se observar o paciente durante 24 horas.

Segundo estudos realizados em seres humanos e animais, qualquer efeito sistêmico atribuível às propriedades do orlistat em função de inibição das lipases deve ser rapidamente reversível.

### FÓRMULA MOLECULAR

$C_{29}H_{53}NO_5$

### FÓRMULA ESTRUTURAL



### PESO MOLECULAR

P.M.: 495,7

### SINÔNIMOS

Tetrahidrolipstatina; N-formil-L-leucina(S)-1-[(2S, 3S)-3-hexil-4-oxooxetan-2-ilmetil] dodecil éster.

### REFERÊNCIAS

1. Korolkovas, Andrejus, Dicionário Terapêutico Guanabara, Ed. 2004/2005, Guanabara Koogan, 13.3.
2. Martindale, the complete drug reference, 34<sup>a</sup> ed; 1724 – 2,3.
3. P.R. Vade 2002 - 2003 P.R. Vade-mécum.
4. <http://www.rxlist.com/cgi/generic/orlistat.htm>

Alcântara - Rua Yolanda Saad Abuzaid, 150, lojas 118/119. Telefone (21) 2601-1130

Centro / Zé Garoto - Rua Coronel Serrado, 1630, lojas 102/103. Telefone (21) 2605-1349



vendas@farmacam.com.br



whatsapp (21) 98493-7033



Facebook.com.br/farmacam



Instagram.com.br/farmacam