Аллопуринол



Код АТХ:

- M04AA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Аллопуринол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Средство, нарушающее синтез мочевой кислоты. Является структурным аналогом гипоксантина. Ингибирует фермент ксантиноксидазу, который участвует в превращении гипоксантина в ксантин и ксантина в мочевую кислоту. Этим обусловлено уменьшение концентрации мочевой кислоты и ее солей в жидких средах организма и моче, что способствует растворению имеющихся уратных отложений и предотвращает их образование в тканях и почках. При приеме аллопуринола повышается выделение с мочой гипоксантина и ксантина.

Фармакокинетика

После приема внутрь почти полностью (на 90%) абсорбируется из ЖКТ. Метаболизируется с образованием аллоксантина, который сохраняет способность достаточно длительно ингибировать ксантиноксидазу. C_{max} аллопуринола в плазме крови достигается в среднем через 1.5 ч, аллоксантина - через 4.5 ч после однократного приема.

$T_{1/2}$ аллопуринола составляет 1-2 ч, аллоксантина - около 15 ч. Около 20% принятой дозы выводится через кишечник, остальная часть - почками.

Показания к применению:

Лечение и профилактика подагры и гиперурикемии различного генеза (в т.ч. в сочетании с нефролитиазом, почечной недостаточностью, уратной нефропатией). Рецидивирующие смешанные оксалатно-кальциевые почечные камни при наличии гиперурикозурии. Повышенное образование уратов вследствие ферментных нарушений. Профилактика острой нефропатии при цитостатической и лучевой терапии опухолей и лейкозов, а также при полном лечебном голодании.

Относится к болезням:

- Лейкоз
- Нефрит
- Нефролитиаз
- Опухоли
- Подагра

Противопоказания:

Выраженные нарушения функции печени и/или почек, беременность, лактация, повышенная чувствительность к аллопуринолу.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально, под контролем концентрации уратов и мочевой кислоты в крови и в моче. Взрослым при приеме внутрь - 100-900 мг/сут, в зависимости от тяжести течения заболевания. Частота приема 2-4 раза/сут после еды. Детям в возрасте до 15 лет - 10-20 мг/кг/сут или 100-400 мг/сут.

Максимальные дозы: при нарушениях функции почек (в т.ч. обусловленных уратной нефропатией) - 100 мг/сут. Увеличение дозы возможно в тех случаях, когда на фоне проводимой терапии сохраняется повышенная концентрация уратов в крови и моче.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: в единичных случаях - артериальная гипертензия, брадикардия.

Со стороны пищеварительной системы: возможны диспептические явления (в т.ч. тошнота, рвота), диарея, транзиторное повышение активности трансаминаз в сыворотке крови; редко - гепатит; в единичных случаях - стоматит, нарушения функции печени (преходящее повышение активности трансаминаз и ЩФ), стеаторея.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: в единичных случаях - слабость, повышенная утомляемость, головная боль, головокружение, атаксия, сонливость, депрессия, кома, парезы, парестезии, судороги, невропатии, нарушения зрения, катаракта, изменения сосочка зрительного нерва, нарушения вкусовых ощущений.

Со стороны системы кроветворения: в отдельных случаях - тромбоцитопения, агранулоцитоз и апластическая анемия, лейкопения (наиболее вероятны у больных с нарушениями функции почек).

Со стороны мочевыделительной системы: редко - интерстициальный нефрит; в единичных случаях - отеки, уремия, гематурия.

Со стороны эндокринной системы: в единичных случаях - бесплодие, импотенция, гинекомастия, сахарный диабет.

Со стороны обмена веществ: в единичных случаях - гиперлипидемия.

Аллергические реакции: кожная сыпь, гиперемия, зуд; в отдельных случаях - ангиоиммунобластная лимфаденопатия, артралгия, повышение температуры, эозинофилия, лихорадка, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

Дерматологические реакции: в единичных случаях - фурункулез, алопеция, обесцвечивание волос.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении аллопуринол усиливает действие кумариновых антикоагулянтов, аденина арабинозида, а также гипогликемических препаратов (особенно при нарушениях функции почек).

Урикозурические средства и салицилаты в высоких дозах снижают активность аллопуринола.

При одновременном применении аллопуринола и цитостатиков чаще проявляется миелотоксическое действие, чем при раздельном применении.

При одновременном применении аллопуринола и азатиоприна или меркаптопурина наблюдается кумуляция последних в организме, т.к. в связи с ингибированием аллопуринолом активности ксантиноксидазы, необходимой для биотрансформации лекарственных средств, замедляется их метаболизм и элиминация.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять аллопуринол при нарушениях функции печени и/или почек (в обоих случаях необходимо снижение дозы), гипофункции щитовидной железы. В начальный период курса терапии аллопуринолом необходимо систематическое проведение оценки показателей функции печени.

В период лечения аллопуринолом суточное количество потребляемой жидкости должно быть не менее 2 л (под контролем диуреза).

В начале курса лечения подагры может возникнуть обострение заболевания. Для профилактики можно применять НПВС или колхицин (по 0.5 мг 3 раза/сут). Следует учитывать, что при адекватной терапии аллопуринолом возможно растворение крупных уратных камней в почечной лоханке и последующее их попадание в мочеточник.

Асимптоматическая гиперурикемия не является показанием к применению аллопуринола.

У детей применяют только при злокачественных новообразованиях (особенно лейкозах), а также при некоторых ферментных нарушениях (синдром Леша-Нихена).

Для коррекции гиперурикемии у пациентов с опухолевыми заболеваниями аллопуринол рекомендуется применять перед началом лечения цитостатиками. В таких случаях следует применять минимальную эффективную дозу. Кроме того, с целью уменьшения риска отложения ксантинов в мочевыводящих путях необходимо принять меры для поддержания оптимального диуреза и ощелачивания мочи. При одновременном применении аллопуринола и цитостатиков необходим более частый контроль картины периферической крови.

В период приема аллопуринола не допускается употребление алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

С осторожностью применять у пациентов, деятельность которых требует высокой концентрации внимания и быстрых психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказание: выраженные нарушения функции почек. С осторожностью следует применять аллопуринол при нарушениях функции почек (необходимо снижение дозы).

При нарушениях функции печени

Противопоказание: выраженные нарушения функции печени. С осторожностью следует применять аллопуринол при нарушениях функции печени (необходимо снижение дозы).

Применение в детском возрасте

У детей применяют только при злокачественных новообразованиях (особенно лейкозах), а также при некоторых ферментных нарушениях (синдром Леша-Нихена).

Режим дозирования устанавливается индивидуально, под контролем концентрации уратов и мочевой кислоты в крови и в моче: детям в возрасте до 15 лет - 10-20 мг/кг/сут или 100-400 мг/сут.

Источник: http://drugs.thead.ru/Allopurinol