Аллопуринол-Эгис



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]

Форма выпуска:

Таблетки круглые, плоские, белого или серовато-белого цвета, с фаской, с риской на одной стороне и с гравировкой "E351" - на другой, без или почти без запаха.

	1 таб.
аллопуринол	100 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал картофельный, повидон К25, магния стеарат, тальк, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А).

50 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Таблетки круглые, плоские, белого или серовато-белого цвета, с фаской, с риской на одной стороне и гравировкой "E352" - на другой, без или почти без запаха.

	1 таб.
аллопуринол	300 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный, желатин, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), целлюлоза микрокристаллическая.

30 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Аллопуринол является структурным аналогом гипоксантина. Аллопуринол, а также его главный активный метаболит оксипуринол, подавляют ксантиноксидазу - фермент, преобразующий гипоксантин в ксантин, а затем в мочевую кислоту. Аллопуринол снижает концентрацию мочевой кислоты в сыворотке крови и моче; таким образом он препятствует отложению кристаллов уратов в тканях и/или способствует их растворению. Уровни мочевой кислоты начинают снижаться с 4-го дня приема препарата, а максимальный эффект развивается примерно через 2 недели.

Аллопуринол можно сочетать со средствами, усиливающими экскрецию мочевой кислоты с мочой, особенно при наличии значительных подагрических отложений в суставах. Аллопуринол особенно эффективен для профилактики возникновения и рецидивирования отложений мочевой кислоты.

Фармакокинетика

Примерно 70-90% принятой дозы всасывается в желудочно-кишечном тракте. C_{max} достигается через 0.5-2 ч после приема внутрь. $T_{1/2}$ - от 1 до 3 ч.

Аллопуринол метаболизируется до оксипуринола, в основном, в печени. Оксипуринол также является ингибитором ксантиноксидазы. C_{max} оксипуринола в плазме крови достигается в течение 2-5 ч. Его $T_{1/2}$ равен 12-27 ч при нормальной функции почек. При нарушении функции ночек этот период удлиняется. Ни аллопуринол, ни оксипуринол не связываются с белками плазмы крови.

Примерно 10% суточной дозы аллопуринола выделяется путем клубочковой фильтрациив неизмененном виде, и примерно 70% выделяется в виде оксипуринола. Канальцевая реабсорбция может удлинить $T_{1/2}$. Остальная часть (20%) суточной дозы препарата выделяется в неизмененном виде с калом.

При почечной недостаточности клиренс аллопуринола и оксипуринола может в значительной степени снижаться, в связи с чем повышаются их уровни в плазме крови. Поэтому при почечной недостаточности требуется соответствующее снижение дозы.

У пожилых пациентов не наблюдается значительного возрастного изменения фармакокинетики аллопуринола при отсутствии снижения функции почек.

Показания к применению:

Заболевания, сопровождающиеся гиперурикемией (лечение и профилактика): подагра (первичная и вторичная), мочекаменная болезнь (с образованием уратов).

Гиперурикемия (первичная и вторичная), возникающая при заболеваниях, сопровождающихся усиленным распадом нуклеопротеидов и повышением содержания мочевой кислоты в крови, в т.ч. при различных гематобластозах (остром лейкозе, хроническом миелолейкозе, лимфосаркоме и др.), при цитостатической и лучевой терапии опухолей (в т.ч. у детей), псориазе, обширных травматических повреждениях, вследствие ферментных нарушений (синдром Леша-Нихена), а также при массивной терапии глюкортикостероидами, когда вследствие интенсивного распада тканей значительно повышается количество пуринов в крови. Мочекислая нефропатия с нарушением функции почек (почечная недостаточность). Рецидивирующие смешанные оксалатно-кальциевые почечные камни (при наличии урикозурии).

Относится к болезням:

- Гематомы
- Лейкоз
- Лимфома
- Миелома
- Мочекаменная болезнь
- Нефрит
- Опухоли
- Подагра
- Псориаз
- Травмы

Противопоказания:

Гиперчувствительность, тяжелая печеночная недостаточность, тяжелая почечная недостаточность, первичный (идиопатический) гемохроматоз (даже при наличии в семейном анамнезе), бессимптомная гиперурикемия, острый приступ подагры, беременность, период лактации

С осторожностью: хроническая почечная недостаточность, хроническая сердечная недостаточность, сахарный диабет, артериальная гипертензия. Детский возраст до 14 лет (назначают только во время цитостатической терапии лейкозов и др, злокачественных заболеваний, а также лечения ферментных нарушений).

Способ применения и дозы:

Внутрь. Препарат следует принимать после еды, запивая большим количеством воды. Суточный объем мочи должен быть более 2 л, а реакция мочи нейтральная или слабощелочная. Суточную дозу более 300 мг необходимо делить на несколько приемов.

Взрослым

Для снижения риска возможного побочного действия рекомендуется начинать курс с приема по 100 мг один раз в день. При необходимости суточную дозу можно постепенно повышать (при контроле уровня мочевой кислоты в

сыворотке крови с интервалом 1-3 недели) ступенями по 100 мг до достижения необходимого эффекта.

Обычная поддерживающая доза 200-600 мг в день. В некоторых случаях может возникнуть необходимость повышения суточной дозы до 800 мг.

В пересчете на вес тела можно давать по 2-10 мг/кг в сут.

Онкологическим больным прием аллопуринола следует начинать за 1-2 дня до начала противоопухолевой терапии Препарат следует давать ежедневно в дозе 600-800 мг в течение 2-3 дней, после чего продолжать прием поддерживающей дозы, назначенной на основании уровня мочеой кислоты сыворотки крови.

Детям

При вторичной гиперурикемии, связанной со злокачественными заболеваниями системы крови и других органов, а также при некоторых нарушениях функций ферментов, обычная суточная доза составляет 10-20 мг/кг веса тела, в зависимости от размера опухоли, количества периферических бластных клеток или степени инфильтрации костного мозга.

Пожилым пациентам, а также при нарушении функции почек и печени

Пожилым пациентам следует всегда назначать наименьшую возможную клинически эффективную дозу; всегда следует учитывать возможность сниженной функции почек и/или печени.

В зависимости от степени нарушения функций почек и печени дозу следует снижать, поскольку при этих состояниях возрастает риск токсических эффектов препарата.

При почечной недостаточности дозу следует снижать, она не должна превышать 100 мг в сут. при клиренсе ниже 20 мл/мин. Можно также давать очередные дозы по 100 мг препарата не ежедневно, а с более длительным интервалом. Настоятельно рекомендуется следить за уровнем аллопуринола плазмы крови. Этот уровень не должен превышать 100 мкмоль/л (15.2 мг/л).

Аллопуринол и его метаболиты выводятся при гемодиализе. В случае проведения гемодиализа 2-3 раза в неделю рекомендуется однократное введение 300-400 мг препарата сразу после гемодиализа, а в дни, когда гемодиализ не проводится, препарат вводить не следует.

Побочное действие:

Побочные эффекты обычно редки. Их частота повышается при нарушении функций почек и/или печени.

Кожа и реакции гиперчувствительности: это наиболее частые явления. Они могут возникнуть в любое время на протяжении курса лечения. Эти реакции могут проявляться в виде зуда, макулопапулярной сыпи, иногда шелушения или зуда, а в редких случаях - в виде эксфолиативных изменений. При возникновении таких реакций аллопуринол следует немедленно отменить. Если кожные реакции слабые, после их исчезновения аллопуринол можно вновь назначить в малых дозах (5 мг/кг веса тела), которые можно затем постепенно повышать. При рецидиве кожных реакций аллопуринол следует отменить немедленно и навсегда.

В редких случаях наблюдаются кожные реакции, связанные с эксфолиацией, лихорадкой, лимфаденопатией, артралгией и/или эозинофилией, напоминающие синдром Стивенса-Джонсона или Лайелла. Сопутствующий васкулит и тканевая реакция могут иметь различные проявления, в т.ч. гепатит, почечную недостаточность, а в редких случаях – эпилептические судороги. В этих случаях аллопуринол следует отменить немедленно и навсегда.

Обычно такие реакции встречаются у пациентов с нарушениями функций почек и/или печени.

Для устранения симптомов можно вводить кортикостероиды.

В очень редких случаях возможен анафилактический шок.

Суставы и костно-мышечная система: начало приема аллопуринола может спровоцировать острый приступ подагры.

Со стороны пищеварительной системы: редко - тошнота и рвота (их можно избежать, принимая препарат после еды), боль в животе, диарея. В некоторых случаях возможны нарушения функций печени (повышение уровнен щелочной фосфатазы и трансаминаз сыворотки крови). Гепатит может развиться при отсутствии других симптомов общей гиперчувствительности.

Со стороны системы кроветворения: в некоторых случаях наблюдались тромбоцитопения, агранулоцитоз и апластическая анемия, особенно часто у пациентов с почечными и/или печеночными заболеваниями.

Прочие: алопеция, головная боль, сонливость, астения, головокружение, невропатия, катаракта, нарушения зрения - однако связь этих побочных эффектов с приемом препарата ***Аллопуринол-ЭГИС*** не была доказана.

Передозировка:

Наиболее частые симптомы передозировки: тошнота, рвота, понос

Лечение: Специфический антидот не известен. Передозировку можно лечить введением жидкости и обеспечением адекватного отделения мочи для ускорения выведения аллопуринола и его метаболитов почками. При наличии клинических показаний следует провести гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Свойство аллопуринола вызывать патологию плода человека не выявлено. Однако, достаточных достоверных исследований о применении препарата во время беременности и кормления грудью у человека проведено не было. Поэтому беременным женщинам принимать этот препарат можно только по назначению врача и только при отсутствии терапевтической альтернативы, когда заболевание представляет больший риск для плода и матери, чем аллопуринол Так как аллопуринол и оксипуринол выделяются в грудное молоко, в период лактации следует воздержаться от назначения препарата, либо решить вопрос о прекращении грудного вскармливания во время лечения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Следует соблюдать осторожность при комбинации со следующими средствами:

— 6-меркаптопурин или азатиоприн - угнетая метаболизм этих препаратов, аллопуринол повышает их токсичность; поэтому дозы 6-меркаптопурина и азатиоприна следует уменьшать до 1/4-1/3 нормального уровня;

— видарабин (арабинозид аденина) - удлиняется период полувыведения этого препарата;

— цитостатические препараты (циклофосфамид, доксорубицин, блеомицин, прокарбазин, мехлорэтамин) - повышается риск поражения кроветворных органов;

— хлорпропамид - при нарушении функции почек повышается риск длительной гипогликемии;

— препараты, усиливающие выделение мочевой кислоты с мочой, сульфинпиразон, пробенецид или высокие дозы салицилатов, т.к. они повышают экскрецию оксипуринола и, таким образом, могут снизить терапевтический эффект аллопуринола;

— теофиллин и аминофиллин, поскольку обнаружено подавление их метаболизма аллопуринолом, предположительно опосредованное угнетением фермента ксантиноксидазы;

— циклоспорин - возможно повышение его концентрации в плазме крови и токсичности;

— производные кумарина - в некоторых случаях возможно снижение их антикоагулянтного эффекта;

— ампициллин и амоксициллин - возможно повышение риска кожных реакций.

Особые указания и меры предосторожности:

Прием Аллопуринола следует немедленно прекратить при появлении любых признаков реакции гиперчувствительности.

Аллопуринол показан не во всех случаях гиперурикемии, протекающей без клинических проявлений.

Детям нельзя назначать Аллопуринол, за исключением случаев вторичной гиперурикемии, связанной со злокачественными опухолями системы крови и другой локализации, а также некоторых нарушений функций ферментов.

На протяжении курса лечения следует обеспечить обильный прием жидкости. Суточный объем мочи должен составлять не менее 2 литров с нейтральным или слабощелочным pH.

При наличии факторов, предрасполагающих к снижению почечной функции (пожилой возраст, введение диуретиков, лечение гипертензии или сердечной недостаточности ингибиторами АПФ) применение Аллопуринола требует тщательного медицинского наблюдения.

В начале терапии рекомендуется наблюдение за функцией печени.

Начало приема Аллопуринола может спровоцировать острый приступ подагры. Для предупреждения этого приступа

рекомендуется сочетать Аллопуринол с нестероидным противовоспалительным препаратом или ежедневным приемом колхицина в дозе 0.5-1 мг на протяжении не менее 1 месяца начального периода терапии.

Если во время приема Аллопуринола возникнет приступ подагры, прием препарата следует продолжать в тех же дозах, а для лечения приступа следует применять нестероидный противовоспалительный препарат или колхицин.

При очень высоком уровне мочевой кислоты (злокачественные новообразования и их лечение, синдром Леша-Найхена) введение Аллопуринола может вызывать отложение ксантина в тканях. Риск этого эффекта можно снизить приемом достаточного количества жидкости. При нарушениях кроветворения рекомендуется регулярный контроль формулы крови. Каждая таблетка 100 мг содержит 5% мг лактозы, которую следует учитывать при составлении диеты пациенту с непереносимостью лактозы. Таблетки по 300 мг не содержат лактозы.

Способность вождения транспортных средств. В отдельных случаях препарат может вызывать побочные эффекты в виде сонливости, головокружения и снижения способности концентрировать внимание. Поэтому степень ограничения или запрета на вождение транспорта и работу с механизмами врач должен определять для каждого пациента индивидуально.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелой почечной недостаточности.

При наличии факторов, предрасполагающих к снижению почечной функции (пожилой возраст, введение диуретиков, лечение гипертензии или сердечной недостаточности ингибиторами АПФ) применение Аллопуринола требует тщательного медицинского наблюдения.

При нарушении функций почек дозу препарата следует снизить, поскольку возрастает риск токсических эффектов препарата.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности.

При нарушении функций печени дозу препарата следует снизить, поскольку возрастает риск токсических эффектов препарата.

Применение в пожилом возрасте

Пожилым пациентам следует всегда назначать наименьшую возможную клинически эффективную дозу; всегда следует учитывать возможность сниженной функции почек и/или печени.

В пожилом возрасте применение Аллопуринола требует тщательного медицинского наблюдения.

Применение в детском возрасте

Детям до 14 лет нельзя назначать Аллопуринол, за исключением случаев цитостатической терапии лейкозов и др, злокачественных заболеваний, а также лечения ферментных нарушений.

Условия хранения:

Таблетки 100 мг: Хранить при температуре ниже 30°C. Таблетки 300 мг: Хранить при температуре ниже 25°C. Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения **-** 5 лет. Препарат нельзя использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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