

Состав и форма выпуска

Таблетки, в упаковке 30 штук.

1 таблетка содержит 500 мг *активного вещества* Пробенецид.

Дополнительные вещества: кукурузный крахмал, микрокристаллическая целлюлоза (102), крахмал натрия гликолят, коллоидный безводный кремнезем, стеарат магния, повидон К-30, стеариновая кислота (микронизированная), опадрай желтый YS-1-2063, Опадрай прозрачный YS-1-7006.

Фармакологическое действие

Пробенецид представляет собой урикозурическое и почечно-канальцевое блокирующее средство. Тормозит трубчатую реабсорбцию урата, таким образом увеличивая экскрецию мочевой кислоты с мочой и уменьшая уровни уратов в сыворотке. Эффективная урикозурия уменьшает смешивающийся пул уратов, замедляет осаждение уратов и способствует рассасыванию уратных отложений. Несмотря на выраженную урикозурическую активность, требуется время для достижения клинических результатов. Острые приступы подагры могут возникнуть на ранней стадии терапии, несмотря на возвращение к нормальному уровню мочевой кислоты в сыворотке крови. Однако при продолжительном использовании в течение нескольких месяцев острая подагра становится менее частой и менее интенсивной. Поскольку уратовые отложения в периартикулярных и суставных структурах реабсорбируются, боль в суставах облегчается, достигается большая подвижность суставов, и можно предотвратить дальнейшее разрушение суставов. По мере того как отрывистые отложения мобилизуются из подагрической почки, почечная функция может улучшаться и дальнейшие разрушительные изменения могут быть предотвращены.

Фармакокинетика

Абсорбция

Пробенецид полностью всасывается после приема внутрь. Пиковые уровни в плазме достигаются через два-четыре часа.

Распределение

От 85 до 95% пробенецида связано с альбумином плазмы; кажущийся объем распределение препарата составляет 11 литров.

Метаболизм

Метаболизм включает окисление алкильных боковых цепей и конъюгацию глюкуронида. Главный метаболит, пробенецид ацил глюкуронид, составляет около 50% дозы.

Выведение

Выводится почками путем клубочковой фильтрации и путем активной секреции проксимальными канальцами почек. В моче определяется 75-85% метаболитов, остальное количество выводится в виде неизмененного вещества. Выведение с мочой неизмененного пробенецида зависит от pH и скорости тока мочи.

Показания препарата

Гиперурикемия при хронической подагре, гиперурикемия при применении диуретиков.

В качестве дополнительного средства при антибиотикотерапии пенициллинами и некоторыми цефалоспоринами (кроме цефалоридина).

Режим дозирования

При хронической подагре лечение начинают с дозы 250 мг 2 раза/сут в течение месяца. Через неделю дозу можно увеличить до 500 мг 2 раза/сут. При недостаточном эффекте дозу можно увеличивать на 500 мг каждый месяц. Максимальная доза 2 г/сут. Если в течение 6 месяцев приема пробенецида у пациента не было острых приступов подагры, а концентрация уратов в плазме крови не превышает допустимого уровня, доза может быть постепенно снижена (на 500 мг каждые 6 месяцев) до минимальной эффективной. Дозы пробенецида могут быть увеличены у пациентов, получающих диуретики или пиперазид, повышающие концентрацию мочевой кислоты в плазме крови.

При антибиотикотерапии препаратами пенициллина и цефалоспоринами доза пробенецида у взрослых составляет 500 мг 4 раза/сут. У детей в возрасте 2 лет и старше начальная доза составляет 25 мг/кг с последующим увеличением до 40 мг/кг; интервал между приемами - 6 ч. Дозы для взрослых, однако, рекомендуется применять у детей с массой тела более 50 кг.

При лечении гонореи пробенецид можно применять в дозе 1 г за 30 мин до парентерального введения антибактериального препарата.

Побочное действие

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, анорексия, болезненность десен; редко - некроз печени.

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение.

Со стороны мочевыделительной системы: учащение мочеиспускания; редко - нефротический синдром.

Аллергические реакции: повышение температуры тела, зуд, крапивница, синдром Стивенса-Джонсона; редко - анафилактический шок.

Со стороны системы кроветворения: анемия, гемолитическая анемия (чаще связанная с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы); редко - апластическая анемия, лейкопения.

Дерматологические реакции: дерматит, алоpecia, приливы.

Со стороны костно-мышечной системы: обострение подагры.

Противопоказания

Острый приступ подагры, мочекаменная болезнь (особенно наличие уратных камней), порфирия, нарушения картины периферической крови, беременность, детский возраст до 2 лет, вторичная гиперурикемия, обусловленная опухолевым процессом или применением химиотерапевтических средств; повышенная чувствительность к пробенециду.

Беременность и кормление грудью

Проникает через плацентарный барьер. Неизвестно, выделяется ли пробенецид с грудным молоком.

Применять при беременности и в период лактации следует с осторожностью и только в случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

В экспериментальных исследованиях не обнаружено отрицательного действия на репродуктивные параметры у крыс.

Применение при нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять при хронической почечной недостаточности. При хронической почечной недостаточности пробенецид может оказаться неэффективным, особенно если уровень клубочковой фильтрации ниже 30 мл/мин.

Применение у детей

Противопоказан в детском возрасте до 2 лет.

Особые указания

Не применяют при вторичной гиперурикемии, обусловленной опухолевым процессом или применением химиотерапевтических средств, поскольку пробенецид не снижает синтез мочевой кислоты, а только увеличивает ее экскрецию почками; возникающая при этом гиперурикозурия усиливает риск нефропатии.

С осторожностью следует применять у лиц с указаниями в анамнезе на язвенную болезнь, а

также при хронической почечной недостаточности. При хронической почечной недостаточности пробенецид может оказаться неэффективным, особенно если уровень клубочковой фильтрации ниже 30 мл/мин.

При применении пробенецида для лечения хронической подагры возможно возникновение острого приступа подагры, а также появление или увеличение роста почечных конкрементов и провокация почечной колики с гематурией (или без нее).

У лиц с дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы возможно развитие гемолитической анемии.

Передозировка пробенецида проявляется возбуждением ЦНС, судорогами и может привести к летальному исходу вследствие дыхательной недостаточности.

Следует избегать одновременного применения пробенецида с кеторолаком, а также с салицилатами. Лицам, принимающим пробенецид, необходимы более низкие дозы тиопентала для введения в наркоз. При одновременном применении пробенецида и метотрексата дозу метотрексата следует снижать с целью уменьшения его побочного действия.

На фоне приема пробенецида возможны ложноположительные результаты анализа мочи на глюкозу.

Лекарственное взаимодействие

Пробенецид нарушает экскрецию и таким образом увеличивает концентрацию в плазме крови следующих препаратов: ацикловир, каптоприл, производные сульфонилмочевины, аминосалицилаты, лоразепам, парацетамол, рифампицин, зидовудин, конъюгаты сульфаниламидов, индометацин, кетопрофен, меклофенамат, напроксен, метотрексат.

Пробенецид снижает в моче концентрацию нитрофурантоина и пенициллина, что приводит к уменьшению терапевтического эффекта нитрофурантоина при инфекциях мочевыводящих путей, а пенициллина - при цистинурии.

Пробенецид может вызывать повышение экскреции фенилсульфонталеина, сульфобромфталейна, аминокипуровой кислоты, 5-окси-индолилуксусной кислоты; снижение выведения с мочой метаболитов стероидных гормонов.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °C, в месте недоступном для детей.

Категория отпуска

По рецепту.