

※※2011年7月改訂(第7版)
※2007年12月改訂

痛風治療剤

日本薬局方 プロベネシド錠

販売名 **ベネシッド錠250mg** ※

日本標準商品分類番号

873942

規制区分
処方せん医薬品 (注意—医師等の処方せんにより使用すること)

貯法
室温保存
使用期限
外箱に表示



BENECID®

※	ベネシッド錠250mg
※	承認番号 21900AMX01176000
※	薬価収載 2007年12月
	販売開始 1956年10月
	再評価結果 1975年6月

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- 腎臓結石症又は高度の腎障害のある患者
[尿中尿酸排泄量の増大によりこれらの症状を悪化させるおそれがある。なお、本剤は慢性腎不全(特に糸球体濾過値30mL/分以下)の患者には無効とされている。]
- 血液障害のある患者
[血液障害が悪化するおそれがある。]
- 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2歳未満の乳児
[安全性が確立していない。]

※【組成・性状】

有効成分	1錠中に日本薬局方プロベネシド250mgを含有する。		
添加物	乳糖水和物、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000		
性状	白色～帯黄白色のフィルムコーティング錠で、におい及び味はない。		
外形		サイズ	識別コード
表面	裏面	重量	
		直径 10.1mm 厚さ 5.8mm 重量 0.385g	KC16

【効能・効果】

- 痛風
- ペニシリン、パラアミノサリチル酸の血中濃度維持

【用法・用量】

1. 痛風

プロベネシドとして、通常、成人1日0.5～2g(2～8錠)を分割経口投与し、その後維持量として1日1～2g(4～8錠)を2～4回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

2. ペニシリン、パラアミノサリチル酸の血中濃度維持

プロベネシドとして、通常、成人1日1～2g(4～8錠)を4回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

消化性潰瘍の既往歴のある患者
[消化性潰瘍が再発するおそれがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1) 急性痛風発作がおさまるまで、本剤の投与を開始しないこと。
- (2) 投与初期に尿酸の移動により痛風発作の一時的な増強をみることがある。
- (3) 本剤投与中に痛風が増悪した場合には、コルヒチン、インドメタシン等を併用すること。
- (4) 尿が酸性の場合、痛風患者に尿酸結石及びこれに由来する血尿、腎仙痛、肋骨脊椎痛等の症状を起こしやすいので、これを防止するため、水分の摂取による尿量

の増加及び尿のアルカリ化をはかること。なお、この場合には、患者の酸・塩基平衡に注意すること。

3. 相互作用

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
サリチル酸系薬剤 アスピリン等	本剤の尿酸排泄作用に拮抗する。	機序は不明であるが、腎尿細管分泌部位での阻害、血漿アルブミンの結合部位の競合によると考えられている。
インドメタシン ナプロキセン	これら薬剤の半減期の延長、AUCの増加等の報告があるので、併用する場合には減量するなど注意すること。	本剤が併用薬の腎尿細管からの分泌、胆汁中への排泄を抑制するためと考えられている。
※ 経口糖尿病用剤 スルホニルウレア系 スルホニルアミド系 パントテン酸 セファロスポリン系 抗生物質 ペニシリン系抗生物質 アンピシリン水和物等 アシクロビル バラシクロビル塩酸塩 ザルシタピン ガチフロキサシン水和物 ジアフェニルスルホン		本剤がこれら薬剤の腎尿細管分泌を阻害し、尿中排泄を低下させるためと考えられている。
メトトレキサート	メトトレキサートの中毒症状(口内炎、汎血球減少)があらわれたとの報告があるので、併用する場合には減量するなど注意すること。	
経口抗凝血剤 ワルファリン サルファ剤	これら薬剤の作用を増強するおそれがある。	
ガンシクロビル	ガンシクロビルの半減期が延長し、AUCが増加するおそれがある。	
※ ノギテカン塩酸塩	ノギテカン塩酸塩の腎クリアランスが低下するおそれがある。	動物実験において、ノギテカン塩酸塩の腎排泄に有機アニオントランスポーターが関与していることが示唆されているため。

4. 副作用

総症例237例中、副作用が認められたのは16例(6.75%)20件で、その主な副作用は食欲不振5件(2.11%)、胃部不快感4件(1.69%)、皮膚炎4件(1.69%)等であった。

(再評価結果時)

(1) 重大な副作用

1) 溶血性貧血、再生不良性貧血

溶血性貧血、再生不良性貧血(頻度不明*)があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

2) アナフィラキシー様反応

アナフィラキシー様反応(頻度不明*)があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

3) 肝壊死

肝壊死(頻度不明*)があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4) ネフローゼ症候群

ネフローゼ症候群(頻度不明*)があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

分類	頻度	0.1～5%未満	頻度不明*
血液**			貧血
過敏症**		皮膚炎	発熱、そう痒
消化器		食欲不振、胃部不快感	悪心・嘔吐
その他		頭痛	めまい、頻尿、歯肉痛、潮紅

*：自発報告による副作用のため頻度不明。

**：発現した場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、減量するなど注意すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 本剤投与中は授乳を中止させること。

[授乳中の投与に関する安全性は確立していない。]

7. 臨床検査結果に及ぼす影響

(1) ベネディクト試薬による尿糖検査では偽陽性を呈することがある。

(2) 次の化合物の尿中排泄を抑制することがある。

パラアミノ馬尿酸、フェノールスルホンフタレイン、17-ケトステロイド

(3) スルホプロモフタレインの肝及び腎からの排泄を抑制することがある。

8. 過量投与

本剤の過量投与により、昏睡や中枢神経系が刺激され痙攣、呼吸不全を引き起こすことがある。

9. 適用上の注意

薬剤交付時

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。)

【薬物動態】

1. 血中濃度¹⁾

(外国人のデータ)

健常成人6人にプロベネシド2gを朝食2時間後に経口投与した場合、吸収は速やかで最高血漿中濃度に達する時間は1～5時間である。更に、健常成人3人にプロベネシド2gを経口投与した場合、血漿中半減期は6～12時間である。

2. 排泄²⁾

(外国人のデータ)

健常成人2人に¹⁴C-標識プロベネシド2gを経口投与した場合、投与48時間以内で投与量の約40%がグルクロン酸抱合体として尿中に排泄され、未変化体の排泄は少ない(<4%)。他の代謝物は、n-プロピル側鎖の2位(7.2～12.5%)及び末端(1.6～3.7%)

が水酸化された誘導体、及びカルボキシ体(6.2～9.2%)、N-脱プロピル体(4.6～8.0%)であり、これらは大部分が遊離の形で排泄される。

(注)本剤の承認された用量は、次のとおりである。

①痛風の場合

プロベネシドとして1日0.5～2gを分割経口投与し、その後維持量として1日1～2gを2～4回に分割経口投与する。

②ペニシリン、パラアミノサリチル酸の血中濃度維持の場合

プロベネシドとして1日1～2gを4回に分割経口投与する。

【薬効薬理】

1. 尿酸排泄作用^{3～5)}

本剤は腎尿細管における尿酸の再吸収を抑制してその尿中排泄を促進し、血清尿酸値を低下させることが認められている。

2. ペニシリン、パラアミノサリチル酸の血中濃度維持^{6,7)}

本剤はペニシリン、パラアミノサリチル酸の腎尿細管における排泄を抑制し、これらの高い血中濃度を持続することが認められている。

【有効成分に関する理化学的知見】

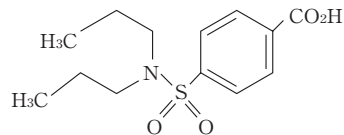
一般名：Probenecid(プロベネシド)

化学名：4-(Dipropylaminosulfonyl) benzoic acid

分子式：C₁₃H₁₉NO₄S

分子量：285.36

構造式：



※※性 状：日本薬局方プロベネシドは白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は初めわずかに苦く、後に不快な苦みになる。

エタノール(99.5)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

水酸化ナトリウム試液又はアンモニア試液に溶ける。

融点：198～200℃

【包装】

(PTP)500錠

(ビン入り)100錠

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- 1) Dayton, P. G. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., **140**, 278～286 (1963)
- 2) Perel, J. M. et al. : Life Sci., **9**(1), 1337～1343(1970)
- 3) Sirota, J. H. et al. : J. Clin. Invest., **31**, 692～701 (1952)
- 4) Pitts, F. W. et al. : U. S. Armed Forces Med. J., **3**(8), 1219～1224 (1952)
- 5) Bartels, E. C. : Med. Clin. N. Amer., **44**, 453～463 (1960)
- 6) Boger, W. P. et al. : Ann. Int. Med., **33**, 18～31 (1950)
- 7) 上田 泰 他：化学療法, **12**, 5～7 (1957)

※〈文献請求先〉

科研製薬株式会社 医薬品情報サービス室
〒113-8650 東京都文京区本駒込2丁目28-8
電話 0120-519-874



製造販売元
科研製薬株式会社
東京都文京区本駒込2丁目28-8