

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

ピナロック®配合散
ピナロック®配合錠
PINALOC

(クエン酸カリウム・クエン酸ナトリウム水和物配合剤)

	配合散	配合錠
承認番号	22100AMX01011	22100AMX01373
薬価収載	2009年9月	
販売開始	2001年10月	

貯 法：室温保存
(ピナロック配合錠：開封後は湿気を避けて保存すること)
使用期限：容器に表示の使用期限内に使用すること




※※【禁忌(次の患者には投与しないこと)】
ヘキサミンを投与中の患者(「3. 相互作用」の項参照)

【組成・性状】

1. ピナロック配合散

成分・含量 (1g中)	(乾燥重量として) クエン酸カリウム 463mg 日本薬局方 クエン酸ナトリウム水和物 390mg
添加物	黄色5号、無水クエン酸、乳糖水和物、香料
製剤の性状	うすいだいだい色の粉末～粒で、芳香があり、清涼な塩味がある。
識別コード	TKS262(分包シート面)

2. ピナロック配合錠

成分・含量 (1錠中)	(乾燥重量として) クエン酸カリウム 231.5mg 日本薬局方 クエン酸ナトリウム水和物 195.0mg						
添加物	無水クエン酸、乳糖水和物、合成ケイ酸アルミニウム・ヒドロキシプロピルスターチ・結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム						
外形							
表面	裏面	側面	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)	色調 剤形	識別 コード
			10.0	5.1	600	白色 割線 入り 素錠	TKS 263

【効能・効果】

- 痛風ならびに高尿酸血症における酸性尿の改善
- アシドーシスの改善

【用法・用量】

1. ピナロック配合散

- 痛風ならびに高尿酸血症における酸性尿の改善
通常成人1回1gを1日3回経口投与するが、尿検査でpH6.2から6.8の範囲に入るよう投与量を調整する。
- アシドーシスの改善
原則として成人1日量6gを3～4回に分けて経口投与するが、年齢、体重、血液ガス分析結果などから患者の状況に応じ適宜増減する。

2. ピナロック配合錠

- 痛風ならびに高尿酸血症における酸性尿の改善
通常成人1回2錠を1日3回経口投与するが、尿検査でpH6.2から6.8の範囲に入るよう投与量を調整する。

○アシドーシスの改善

原則として成人1日量12錠を3～4回に分けて経口投与するが、年齢、体重、血液ガス分析結果などから患者の状況に応じ適宜増減する。

※※【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)

- ※※(1)腎機能障害のある患者 [カリウムの排泄低下により、高カリウム血症があらわれやすい。] (「2. 重要な基本的注意」の項参照)
- (2)肝疾患・肝機能障害のある患者 [症状を悪化させるおそれがある。]
- (3)尿路感染症の患者 [感染を助長するおそれがある。]

2. 重要な基本的注意

- ※※(1)本剤の投与に際しては、患者の血清電解質の変化に注意すること。特に、腎機能障害のある患者に投与する場合や、長期間投与する場合には、血中のカリウム値、腎機能等を定期的に検査すること。また、高カリウム血症があらわれた場合には、投与を中止すること。(「4. 副作用」の項参照)
- (2)リン酸カルシウムは、アルカリ側で不溶性となることが知られているので、結石防止のため過度の尿アルカリ化は避けるべきである。

3. 相互作用

(1)併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
※※ヘキサミン (ヘキサミン注)	ヘキサミンの効果を減弱することがあるので併用は避けること。	ヘキサミンは酸性尿下で効果を発現するので、尿pHの上昇により効果が減弱することがある。

(2)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
水酸化アルミニウムゲル	他のクエン酸製剤との併用でアルミニウムの吸収が促進されたとの報告があるので、併用する場合には2時間以上投与間隔を置くこと。	クエン酸がアルミニウムとキレート化合物を形成し、アルミニウムの吸収を促進させるとの報告がある。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

※※(1)重大な副作用(頻度不明)

高カリウム血症 高カリウム血症があらわれることがある。また、高カリウム血症に伴い、徐脈、全身倦怠感、脱力感等があらわれることがあるので、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)その他の副作用

	頻度不明
1)肝 臓 ^{注1)}	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、 γ -GTP、LDHの上昇
2)腎 臓	血中クレアチニン、BUNの上昇
※※3)消 化 器	胃不快感、下痢、食欲不振、嘔気、悪心、嘔吐、胸やけ、口内炎、腹部膨満感、胃痛、舌炎
4)皮 膚	発疹、そう痒感
5)泌 尿 器	排尿障害 ^{注2)}
6)そ の 他	頻脈、残尿感、眠気、貧血、全身倦怠感

注1)観察を十分に行い、異常が認められた場合には、減量又は休薬等の適切な処置を行うこと。

注2)縮小した結石の尿管への嵌頓による。このような場合には外科的処置を含む適切な処置を行うこと。

5. 高齢者への投与

高齢者では、生理機能が低下していることが多く、副作用があらわれやすいので、減量するなど注意すること。

6. 適用上の注意

(1)ピナロック配合錠

服用時 服用しにくい場合は、水などに溶かして服用すること。[本剤は、塩味が強く服用しにくいことがある。また、痛風・尿酸血症の患者においては、尿量の増加をはかることが望ましいとされている。]

(2)ピナロック配合錠

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、更には穿孔を起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. 生物学的同等性試験

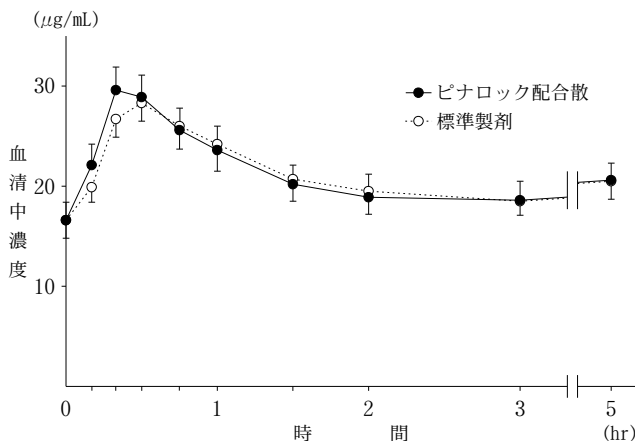
(1)ピナロック配合散

ピナロック配合散と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2g(クエン酸カリウムとして926mg、クエン酸ナトリウム水和物として780mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して、血清中クエン酸濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

薬物動態パラメータ

	AUC _{0-3hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)
ピナロック配合散	64.9 \pm 5.2	31.5 \pm 2.2	0.46 \pm 0.07
標準製剤	64.9 \pm 4.2	30.3 \pm 1.8	0.52 \pm 0.05

(Mean \pm S. E., n=14)



血清中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

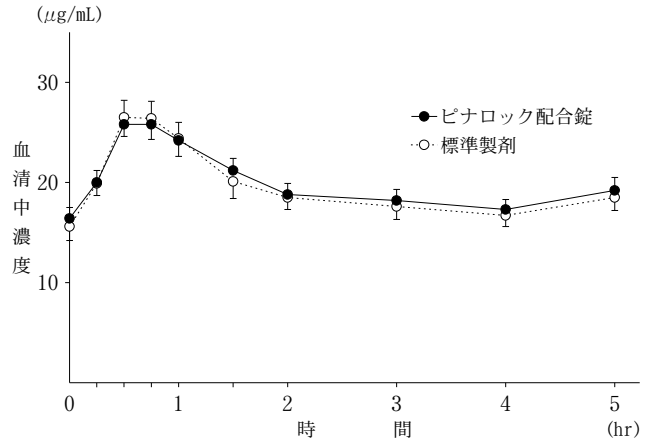
(2)ピナロック配合錠

ピナロック配合錠と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ4錠(クエン酸カリウムとして926mg、クエン酸ナトリウム水和物として780mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して、血清中クエン酸濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された²⁾。

薬物動態パラメータ

	AUC _{0-3hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)
ピナロック配合錠	62.9 \pm 3.3	28.1 \pm 1.3	0.71 \pm 0.05
標準製剤	62.0 \pm 4.1	28.1 \pm 1.7	0.61 \pm 0.04

(Mean \pm S. E., n=14)



血清中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

ピナロック配合散及びピナロック配合錠は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたそれぞれクエン酸カリウム463mg/g・クエン酸ナトリウム水和物390mg/g散及びクエン酸カリウム231.5mg・クエン酸ナトリウム水和物195.0mg錠の溶出規格に適合していることが確認されている³⁾⁴⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

1. クエン酸カリウム

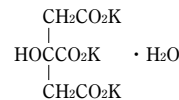
一般名：クエン酸カリウム (Potassium Citrate)

化学名：Tripotassium 2-hydroxypropane-1, 2, 3-tricarboxylate hydrate

分子式：C₆H₅K₃O₇ · H₂O

分子量：324.41

構造式：



性状：本品は無色の結晶又は白色の結晶性の粉末で、においが無い。

本品は水に極めて溶けやすく、酢酸(100)にやや溶けやすく、エタノール(95)、アセトン、ジエチルエーテル又はヘキサンにほとんど溶けない。

2. クエン酸ナトリウム水和物

一般名：〔日局〕クエン酸ナトリウム水和物

(Sodium Citrate Hydrate)

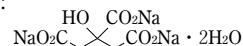
〔日局別名〕クエン酸ナトリウム

化学名：Trisodium 2-hydroxypropane-1, 2, 3-tricarboxylate dihydrate

分子式：C₆H₅Na₃O₇ · 2H₂O

分子量：294.10

構造式：



性状：本品は無色の結晶又は白色の結晶性の粉末で、においはなく、清涼な塩味がある。
本品は水に溶けやすく、エタノール(95)又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いて加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)を実施した結果、ピナロック配合散及びピナロック配合錠は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された⁵⁾⁶⁾。

【包装】

ピナロック配合散 1g×90包

ピナロック配合錠 PTP 100錠(10錠×10) 1000錠(10錠×100)

【主要文献】

- 1)ナガセ医薬品(株)：ピナロック配合散の生物学的同等性試験 (NM0040)
- 2)ナガセ医薬品(株)：ピナロック配合錠の生物学的同等性試験 (NM0041)
- 3)ナガセ医薬品(株)：ピナロック配合散の溶出試験 (NM0042)
- 4)ナガセ医薬品(株)：ピナロック配合錠の溶出試験 (NM0043)
- 5)ナガセ医薬品(株)：ピナロック配合散の安定性試験 (NM0046)
- 6)ナガセ医薬品(株)：ピナロック配合錠の安定性試験 (NM0047)

※【製品に関するお問い合わせ先】

「主要文献」に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

®登録商標

製造販売元
ナガセ医薬品株式会社
兵庫県伊丹市千僧4丁目323番地

※販売
ファイザー株式会社
東京都渋谷区代々木3-22-7

※提携
マイラン製薬株式会社
大阪市中央区本町2丁目6番8号