

アルカリ化療法剤－酸性尿・アシドーシス改善－

処方箋医薬品[※]

クエン酸カリウム・クエン酸ナトリウム水和物配合製剤

ウタゲン[®] 配合散

UTAGEN POWDER

貯法：室温保存

有効期間：3年

注)注意-医師等の処方箋により使用すること

承認番号 22100AMX01374000

販売開始 1994年7月

2. 禁忌 (次の患者には投与しないこと)

2.1 ヘキサミンを投与中の患者 [10.1 参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

成分・分量 (1g中、乾燥質量 として)	クエン酸カリウム 463mg 日局 クエン酸ナトリウム水和物 390mg
添加剤	無水クエン酸、乳糖水和物、黄色5号、香料

3.2 製剤の性状

性状	淡橙色の粉末～粒で、芳香があり、清涼な塩味
外形	分包品 (1g) はヒートシール包装

4. 効能又は効果

- 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

6. 用法及び用量

〈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。

8. 重要な基本的注意

- 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。[9.2、11.1.1 参照]
- 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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 尿路感染症の患者

感染を助長するおそれがある。

9.2 腎機能障害患者

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。[8.1、11.1.1 参照]

9.3 肝機能障害患者

肝疾患・肝機能障害の症状を悪化させるおそれがある。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。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。

10. 相互作用

10.1 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 (ヘキサミン静注液) [2.1 参照]	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。

10.2 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。

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 高カリウム血症 (0.54%)

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。[8.1、9.2 参照]

11.2 その他の副作用

	0.1%～2%未満	頻度不明
肝臓	AST 上昇、ALT 上昇、Al-P 上昇、 γ -GTP 上昇	LDH 上昇
腎臓		血中クレアチニン上昇、BUN 上昇
消化器	胃不快感、下痢、悪心、胸やけ、嘔吐、食欲不振	嘔気、口内炎、腹部膨満感、胃痛、舌炎
皮膚	発疹	そう痒感
泌尿器	排尿障害 ^{注)}	
その他	頻脈、残尿感、眠気	貧血、全身倦怠感

注) 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。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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・高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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

本剤の体内薬物動態は、本剤の成分及び代謝産物がすべて生体常在物質であることをふまえて解析された。

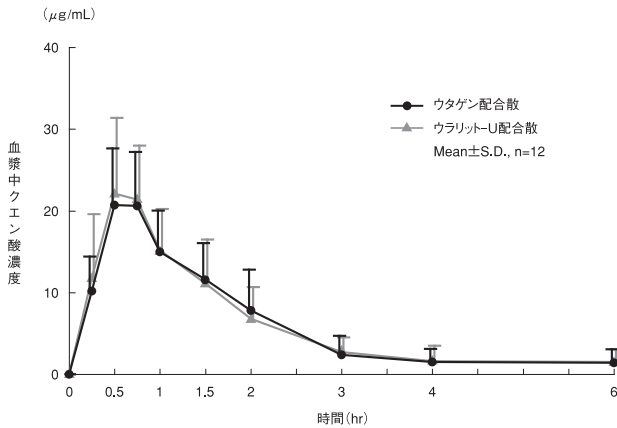
16.1.1 生物学的同等性試験

ウタゲン配合散とウラリット-U配合散を、クロスオーバー法によりそれぞれ6g(クエン酸カリウムとして2,778mg、クエン酸ナトリウム水和物として2,340mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中クエン酸濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、 C_{max})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

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (0→6) ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	C_{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ウタゲン配合散	36.2±11.6	22.4±6.1	0.6±0.1	1.2±0.6
ウラリット-U 配合散	36.7±14.1	23.9±7.8	0.8±0.4	1.3±0.7

(補正後：Mean±S.D., n=12)



血漿中クエン酸濃度推移

血漿中濃度並びに AUC、 C_{max} 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。

注) 本剤の承認されている用法及び用量

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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

本剤の作用は、主として代謝産物の重碳酸塩 (HCO_3^-) が、生体において塩基として作用することに基づくと考えられる²⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

19.1 クエン酸カリウム

一般名：クエン酸カリウム (Potassium Citrate)

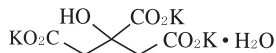
化学名：Tripotassium 2-hydroxypropane-1,2,3-tricarboxylate hydrate

分子式： $\text{C}_6\text{H}_5\text{K}_3\text{O}_7 \cdot \text{H}_2\text{O}$

分子量：324.41

性状：クエン酸カリウムは無色の結晶又は白色の結晶性の粉末である。水に極めて溶けやすく、酢酸 (100) にやや溶けにくく、エタノール (95) にほとんど溶けない。

構造式：



19.2 クエン酸ナトリウム水和物

一般名：クエン酸ナトリウム水和物 (Sodium Citrate Hydrate) (JAN)

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

分子式： $\text{C}_6\text{H}_5\text{Na}_3\text{O}_7 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$

分子量：294.10

性状：クエン酸ナトリウム水和物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。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。

構造式：



22. 包装

1g×120 包

1g×600 包

23. 主要文献

- 社内資料: 生物学的同等性試験
- 日本泌尿器学会ほか: 尿路結石症診療ガイドライン 2013 年版. 金原出版; 2013: 114-116

24. 文献請求先及び問い合わせ先

全星薬品工業株式会社 医薬情報部
〒545-0051 大阪市阿倍野区旭町 1-2-7

☎ 0120-189-228

TEL 06-6630-8820

FAX 06-6630-8990

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 全星薬品工業株式会社
大阪市阿倍野区旭町 1-2-7

26.2 発売元

 全星薬品株式会社
堺市堺区向陵中町 2-4-12