

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

胃炎・消化性潰瘍治療剤

日本薬局方 アルジオキサ錠



日本薬局方 アルジオキサ顆粒



剤 形	錠 100mg : 白色素錠 顆粒 25% : 白色顆粒剤 顆粒 50% : 白色顆粒剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠 100mg : 1錠中 日局アルジオキサ 100mg 含有 顆粒 25% : 1g 中 日局アルジオキサ 250mg 含有 顆粒 50% : 1g 中 日局アルジオキサ 500mg 含有
一般名	和名: アルジオキサ (JAN) 洋名: Aldioxa (JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 発売年月日 錠 100mg 2008年8月11日 2008年12月19日 1971年12月7日 顆粒 25% 1986年12月5日 1987年10月1日 1987年10月8日 顆粒 50% 2001年6月25日 2001年9月7日 1971年12月7日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元: あすか製薬株式会社 販売: 武田薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	あすか製薬株式会社 くすり相談室 TEL 0120-848-339 FAX 03-5484-8358 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.aska-pharma.co.jp/medical/index.html">http://www.aska-pharma.co.jp/medical/index.html</a>

本IFは2016年2月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

## IF 利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受け、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品医療機器総合機構ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

#### [IF の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

## [ I F の作成 ]

- ① I F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（P D F）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

## [ I F の発行 ]

- ① 「I F 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「I F 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には I F が改訂される。

### 3. I F の利用にあたって

「I F 記載要領 2013」においては、P D F ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の I F については、医薬品医療機器総合機構ホームページに掲載場所が設定されている。製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、I F の利用性を高める必要がある。また、隨時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I F が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器総合機構ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり、その取扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

I F を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。I F は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、I F があくまでも添付文書を補完する情報資料であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂・一部変更)

## 目 次

I. 概要に関する項目 .....	1	VI. 薬効薬理に関する項目 .....	14
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 .....	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性.....	1	2. 薬理作用 .....	14
II. 名称に関する項目 .....	2	VII. 薬物動態に関する項目 .....	16
1. 販売名 .....	2	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	16
2. 一般名 .....	2	2. 薬物速度論的パラメータ .....	16
3. 構造式又は示性式.....	2	3. 吸収 .....	17
4. 分子式及び分子量.....	3	4. 分布 .....	17
5. 化学名（命名法） .....	3	5. 代謝 .....	18
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	3	6. 排泄 .....	18
7. C A S 登録番号 .....	3	7. トランスポーターに関する情報 .....	18
III. 有効成分に関する項目 .....	4	8. 透析等による除去率 .....	18
1. 物理化学的性質 .....	4	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 ..	19
2. 有効成分の各種条件下における安定性....	4	1. 警告内容とその理由 .....	19
3. 有効成分の確認試験法 .....	4	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	19
4. 有効成分の定量法.....	5	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とそ の理由 .....	19
IV. 製剤に関する項目 .....	6	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とそ の理由 .....	19
1. 剤形.....	6	5. 慎重投与内容とその理由 .....	19
2. 製剤の組成.....	7	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .....	19
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意.....	7	7. 相互作用 .....	19
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	7	8. 副作用 .....	20
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	8	9. 高齢者への投与 .....	21
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化） ....	9	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 .....	21
7. 溶出性.....	10	11. 小児等への投与 .....	21
8. 生物学的試験法 .....	10	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	21
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	11	13. 過量投与 .....	22
10. 製剤中の有効成分の定量法.....	11	14. 適用上の注意 .....	22
11. 力価 .....	11	15. その他の注意 .....	22
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	11	16. その他 .....	22
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に關 する情報.....	11	IX. 非臨床試験に関する項目 .....	23
14. その他.....	11	1. 薬理試験 .....	23
V. 治療に関する項目 .....	12	2. 毒性試験 .....	23
1. 効能又は効果 .....	12		
2. 用法及び用量 .....	12		
3. 臨床成績 .....	12		

X. 管理的事項に関する項目 .....	24
1. 規制区分 .....	24
2. 有効期間又は使用期限 .....	24
3. 貯法・保存条件 .....	24
4. 薬剤取扱い上の注意点 .....	24
5. 承認条件等 .....	24
6. 包装 .....	24
7. 容器の材質 .....	25
8. 同一成分・同効薬 .....	25
9. 国際誕生年月日 .....	25
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 .....	25
11. 薬価基準収載年月日 .....	25
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 .....	25
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 .....	26
14. 再審査期間 .....	26
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 .....	26
16. 各種コード .....	26
17. 保険給付上の注意 .....	26
X I. 文献 .....	27
1. 引用文献 .....	27
2. その他の参考文献 .....	27
X II. 参考資料 .....	28
1. 主な外国での発売状況 .....	28
2. 海外における臨床支援情報 .....	28
X III. 備考 .....	29



## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

創傷の治療に有効な成分であるアラントインは、1912年 Macalister によりヒレハリソウの地下茎からはじめて抽出された。その後、1935年、Robinson が蛆の分泌物よりアラントインを発見した。このアラントインは 1962 年、Cahen,R.によってアルミニウムとの縮合物として、消化性潰瘍の治療に応用され、その効果が認められるようになった。

アルジオキサは、アラントインの抗潰瘍作用とアルミニウムヒドロキシドの收れん被覆作用の双方の効果をねらって、アラントインと水酸化アルミニウムを縮合させたアラントインの二水酸化アルミニウム塩である。

1970年7月にイサロン錠、1971年5月にイサロン顆粒の承認を取得し、いずれも 1971 年 12 月に販売を開始した。1986 年 12 月に「イサロン顆粒 25%」の承認を取得し、2001 年 6 月にイサロン顆粒は「イサロン顆粒 50%」に販売名を変更した。また、医療過誤防止のため、イサロン錠は 2008 年 12 月に「イサロン錠 100mg」に販売名を変更した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 胃・十二指腸粘膜の、特に損傷部位に直接作用し、正常な肉芽組織の増生及び粘膜上皮再生などのいわゆる組織修復作用を中心とした防御因子増強作用を有する。
- (2) 緩和な制酸・抗ペプシン作用を有する。
- (3) 潰瘍及び胃炎における自覚症状の改善に優れている。
- (4) 副作用は便秘の消化器症状のみであり、いずれも重篤なものは認められていない。
- (5) 製剤は無味無臭で、崩壊性に優れており、服用しやすい薬剤である。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

イサロン®錠 100mg

イサロン®顆粒 25%

イサロン®顆粒 50%

#### (2) 洋名

ISALON® TABLETS

ISALON® GRANULES

#### (3) 名称の由来

傷つき荒れはてたイ（胃）をサロン（応接間）のように美しく蘇らせる薬

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

アルジオキサ（JAN）

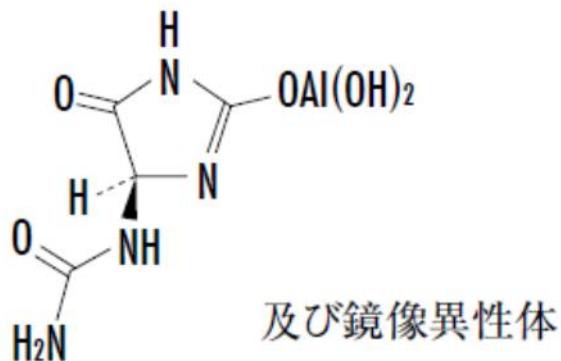
#### (2) 洋名（命名法）

Aldioxa（JAN）

#### (3) ステム

不明

### 3. 構造式又は示性式



#### 4. 分子式及び分子量

分子式 : C<sub>4</sub>H<sub>7</sub>AlN<sub>4</sub>O<sub>5</sub>

分子量 : 218.10

#### 5. 化学名（命名法）

Dihydroxo [(4RS)-5-oxo-4-ureido-4,5-dihydro-1*H*imidazol-2-yl] oxoaluminium (IUPAC)

#### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

ジヒドロキシアルミニウムアラントイナート

#### 7. C A S 登録番号

5579-81-7

### III. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の粉末である。

##### (2) 溶解性

水又はエタノール（99.5）にほとんど溶けない。

希塩酸に溶ける。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 230°C（分解）

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

フッ化ナトリウム・塩酸試液溶液（1→100）は旋光性を示さない。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

高温・高湿（40°C・90%RH, 50°C・90%RH）下、45日間放置で、ほとんど変化は認められない。

#### 3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「アルジオキサ」の確認試験による。

- (1) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
- (2) アルミニウム塩の定性反応

#### 4. 有効成分の定量法

日本薬局方「アルジオキサ」の定量法による。

- (1) 窒素定量法
- (2) 原子吸光光度法

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 効形

#### (1) 効形の区別、外観及び性状

<イサロン錠 100mg>

効 形	白色素錠		
	表	側 面	裏
外 形			
直径 8.0mm、厚さ 約 2.8mm、重量 200mg			

<イサロン顆粒 25%・50%>

効 形	白色顆粒剤

#### (2) 製剤の物性

<イサロン錠 100mg>

- 1) 硬 度 : 4kg 以上
- 2) 崩壊試験 : 本剤は日局製剤総則、錠剤の項に定める崩壊試験法により試験を行うとき、これに適合する。

<イサロン顆粒 25%>

- 1) 崩壊試験 : 本剤は日局製剤総則、顆粒剤の項に定める崩壊試験法により試験を行うとき、これに適合する。
- 2) 安 息 角 : 35.75°
- 3) 飛 散 性 : 逃飛率 42.5%
- 4) 粒度分布 : 10 mesh on 0%  
10~42 mesh 91.2%  
42 mesh through 8.8%

<イサロン顆粒 50%>

- 1) 崩壊試験 : 本剤は日局製剤総則、顆粒剤の項に定める崩壊試験法により試験を行うとき、これに適合する。
- 2) 安 息 角 : 33.69°
- 3) 飛 散 性 : 逃飛率 53.5%
- 4) 粒度分布 : 10 mesh on 0%  
10~42 mesh 98.8%  
42 mesh through 1.2%

(3) 識別コード

	薬剤本体	包装材料
イサロン錠 100mg	G 210	G 210 (PTP)
イサロン顆粒 25%	—	G 2112 (分包)
イサロン顆粒 50%	—	G 2113 (分包)

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

## 2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

イサロン錠 100mg : 1 錠中 日局アルジオキサ 100mg 含有

イサロン顆粒 25% : 1g 中 日局アルジオキサ 250mg 含有

イサロン顆粒 50% : 1g 中 日局アルジオキサ 500mg 含有

(2) 添加物

	添加物
イサロン錠 100mg	ステアリン酸マグネシウム、デキストリン、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム
イサロン顆粒 25%	カルメロースカルシウム、結晶セルロース、デキストリン、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール
イサロン顆粒 50%	カルメロースカルシウム、結晶セルロース、デキストリン、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム

(3) その他

該当しない

## 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## 4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

<イサロン錠 100mg>

保存条件	保存形態	保存期間	結果
40°C、75%RH	PTP 包装	6 カ月間	変化なし
蛍光灯下 1,000Lux	PTP 包装	30 日間	変化なし

(2) 長期保存試験<sup>1)</sup>

<イサロン錠 100mg、イサロン顆粒 25%、イサロン顆粒 50%>

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、4年）の結果、本剤は通常の市場流通下において4年間安定であることが確認された。

製品	保存条件	保存形態	保存期間	結果
イサロン錠 100mg	室温	PTP／アルミピロー	4年	変化なし
イサロン顆粒 25%	室温	0.4g 分包	4年	変化なし
		バラ包装		
イサロン顆粒 50%	室温	0.2g 分包	4年	変化なし
		バラ包装		

試験項目：

イサロン錠 100mg：性状、確認試験、質量偏差試験、溶出試験、定量

イサロン顆粒 25%、50%：性状、確認試験、質量偏差試験（分包のみ）、粒度試験、崩壊試験、定量

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

### (1) イサロン顆粒 25%

イサロン顆粒 25%と他剤を混合し、下記条件下に保存し観察した。

配合薬剤	室 内 (14 日間)	25°C、75%RH (14 日間)	30°C、92%RH (14 日間)
アスピリン	—	±	+
アルサルミン細粒 90%	—	—	—
S・M 散	—	—	+
ガスター散 10%	—	—	—
ガストロゼピン細粒 10%	—	—	+
ガストロピロール	—	—	+
キャベジン U コーワ散	—	+	+
グルマール顆粒 70%	—	—	+
グルミン顆粒 99%	—	—	—
ケルナック細粒 8%	—	—	—
コランチル顆粒	—	—	±
セルベックス細粒 10%	—	—	—
ソロン細粒 20%	—	—	—
タガメット細粒 20%	—	—	+
つくし A・M 散	—	—	+
ドグマチール細粒 10%	—	—	—
ネオ・ユモール末	—	—	—
ノイエル細粒 40%	—	—	±
ハイゼット細粒 20%	—	—	—
ベリチーム顆粒	—	—	+
マーズレン - S 顆粒	—	+	+
メサフィリン末	—	—	—
ケイ酸マグネシウム	—	—	+
酸化マグネシウム	—	—	+
重質酸化マグネシウム	—	—	+
炭酸水素ナトリウム	—	—	+
炭酸マグネシウム	—	—	—
沈降炭酸カルシウム	—	—	—

注) −：変化なし、±：やや変化がみられる、+：変化が認められる

## (2) イサロン顆粒 50%

イサロン顆粒 50%と他剤を混合し、下記条件下に保存し観察した。

保存条件 配合薬剤	室 内 (1カ月間)	25°C、75%RH (1カ月間)	50°C、80%RH (1カ月間)
アルサルミン細粒 90%	—	—	+
キャベジン U コーワ散	—	—	—
グルミン顆粒 99%	—	—	+
コランチル顆粒	—	—	—
メサフィリン末	—	—	—

注) − : 変化なし、+ : 変化が認められる

保存条件 配合薬剤	室 内	25°C、70%RH	40°C、75%RH
アスコルビン酸 (7日間放置)	—	—	+
酸化マグネシウム (1カ月間放置)	—	±	—
シナール (15日間放置)	—	—	+
ラックビー微粒 (14日間放置)	—	—	+

注) − : 変化なし、± : やや変化が認められる、+ : 変化が認められる

## 7. 溶出性

### <イサロン錠 100mg>

日本薬局方医薬品各条に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

表示量	規定時間	溶出率
100mg	30分間	70%以上

### <イサロン顆粒 25%・50%>

日本薬局方医薬品各条に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

規定時間	溶出率
15分間	85%以上

## 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

### <イサロン錠 100mg>

日本薬局方「アルジオキサ錠」の確認試験による。

紫外可視吸光度測定法

### <イサロン顆粒 25%・50%>

日本薬局方「アルジオキサ顆粒」の確認試験による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法吸 光度
- (2) アルミニウム円の定性反応

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

### <イサロン錠 100mg>

日本薬局方「アルジオキサ錠」の定量法による。

紫外可視吸光度測定法

### <イサロン顆粒 25%・50%>

日本薬局方「アルジオキサ顆粒」の定量法による。

紫外可視吸光度測定法

## 11. 力価

該当しない

## 12. 混入する可能性のある夾雜物

該当資料なし

## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

## 14. その他

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

下記疾患における自覚症状及び他覚所見の改善

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃炎

### 2. 用法及び用量

アルジオキサとして、通常成人 1 日 300～400mg を 3～4 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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果<sup>3)～6)</sup>

国内で実施された、二重盲検比較試験を含む総症例（効果判定症例）3,758 例において、75.3% の有効率を示した。

また、自覚症状についても 80%以上の改善効果が認められた。

	症例数	有効以上例数	有効率
胃潰瘍	1,111 例	913 例	82.2%
十二指腸潰瘍	451 例	321 例	71.2%
胃・十二指腸潰瘍	40 例	36 例	90.0%
急性胃炎	1,965 例	1,434 例	73.0%
慢性胃炎	191 例	127 例	66.5%
計	3,758 例	2,831 例	75.3%

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

## 2) 比較試験<sup>6)</sup>

胃潰瘍患者 80 例を対象として、ゲファルナートとの二重盲検比較試験を行った。イサロン錠 100mg を 1 回 1錠、1 日 4 回又はゲファルナートカプセルを 1 回 50mg、1 日 4 回を経口投与した。その結果、自覚症状の改善ではいずれの症状においてもイサロン錠 100mg 投与群(40 例)において高い改善率が得られ、とくに腹部重圧感及び食欲不振の改善率では有意差が認められた。

また、総合効果は、イサロン錠 100mg 投与群で 67.5%(27 例／40 例)、ゲファルナートカプセル投与群で 57.5%(23 例／40 例)の有効率が得られた(有効以上と判定されたものの合計)。

## 3) 安全性試験

該当資料なし

## 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

## (6) 治療的使用

### 1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

該当資料なし

### 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

アルクロキサ

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 1) 作用部位

消化管（とくに胃・十二指腸）の障害粘膜面又はそれらの組織間と推定される。

##### 2) 作用機序

①損傷部位において、正常な肉芽組織を速やかに増生させるとともに、粘膜上皮の再生促進、微小血管の新生促進、粘液成分の合成分泌促進などの諸作用により、積極的な組織の修復をもたらす（ラット）。

②抗ペプシン・制酸作用を有し、塩酸、ペプシンなどの浸潤から損傷部位を保護する（イヌ、*in vitro*）。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 肉芽形成・粘膜上皮再生促進作用<sup>7)</sup>

酢酸潰瘍における組織学的検討から、肉芽組織の増生及び粘膜上皮の再生が早期に認められ、潰瘍の瘢痕化を促進した（ラット）。

##### 2) 胃粘膜微小血管新生<sup>8)</sup>・血流改善作用<sup>9)</sup>

酢酸潰瘍において潰瘍部周辺の粘膜下血管及び漿膜面から放射状血管を新生させ、早期に血管構築を完成させた（ラット）。

また、アスピリンによる胃粘膜血流低下に対し抑制作用を示した（ラット）。

##### 3) 粘液合成分泌促進作用<sup>7), 10)</sup>

アスピリンにより惹起された胃粘膜中のヘキソサミンの減少を用量依存的に抑制し、同時に胃液中へのヘキソサミンの遊離抑制、すなわち粘液層の破壊抑制作用も認められた（ラット）。

また、アルコール負荷による胃粘膜ヘキソサミン量の減少を有意に抑制した（ラット）。

##### 4) 胃粘膜プロスタグランдин（PGs）正常化作用<sup>11)</sup>

アルコール胃粘膜障害における PGs（PGE、6-keto-PGF<sub>1α</sub>）の減少に対し、有意な抑制作用を示した（ラット）。

##### 5) H<sup>+</sup> back diffusion 抑制作用<sup>10)</sup>

アスピリンによる胃障害において惹起された H<sup>+</sup>の back diffusion に対し、有意な抑制作用を示した（ラット）。

6) 抗ペプシン作用<sup>12)、13)</sup>

4%溶液においてほぼ完全にペプシンの活性を抑制した(West Ellis & Scott 法:in vitro)。また、10 分後、すでにその活性を 10%以下に抑制し、その効果は 100 分以上持続した(K.Schaub 法:in vitro)。

7) 制酸作用<sup>13)</sup>

0.05N 塩酸 100mL に対する中和能は、水酸化アルミニウムとほぼ同等の作用を示し (in vitro)、また、ヒスタミン刺激による胃液分泌に対し、遊離酸度、総酸度を減少させ pH を上昇させた(イヌ)。

8) 抗潰瘍作用<sup>7)、12)、14)～17)</sup>

酢酸潰瘍、ストレス潰瘍等の実験潰瘍において内視鏡的あるいは肉眼的及び組織学的に治癒の促進が認められている。

また、ストレス潰瘍、Shay 潰瘍、ヒスタミン潰瘍、レセルピン潰瘍、フェニルブタゾン潰瘍等において潰瘍の発生を抑制することが認められている(ラット、ヒスタミン潰瘍のみモルモット)。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間

<参考. 動物データ><sup>18)</sup>

アルジオキサ-<sup>14</sup>C をラットに経口投与した場合、消化管内でアラントインと水酸化アルミニウムに加水分解され、アラントインの大部分は吸収され、血中濃度は投与後 0.5~1 時間で最高に達した。

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

#### (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸收速度定数

該当資料なし

#### (3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

#### (4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

### 3. 吸収

該当資料なし

<参考. 動物データ><sup>18)</sup>

アルジオキサは消化管内でアラントインと水酸化アルミニウムに加水分解され、生じたアラントインの大部分は速やかに吸収され、0.5~1 時間後にピークに達した。投与 6 時間までの半減期は 2 時間であった。

一方、水酸化アルミニウムは未吸収のまま消化管内に残るものと考えられる（ラット）。

### 4. 分布

(1) 血液一脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液一胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

<参考. 動物データ><sup>18)</sup>

アルジオキサを経口投与した 30 分後、アラントインの各臓器、組織内分布量はピークに達し、その値は胃において最も多く、次いで腸、腎、肝の順に分布する（ラット）。

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

### (2) 代謝に関する酵素 (CYP450 等) の分子種

該当資料なし

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

<参考. 動物データ><sup>18)</sup>

アルジオキサを経口投与した場合、胃内でアラントインと水酸化アルミニウムに加水分解され、吸収されたアラントインはアラントイン酸、ヒダントイン酸、尿素等に代謝されると考えられる (ラット)。

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

### (2) 排泄率

該当資料なし

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 8. 透析等による除去率

該当資料なし

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

**【禁 忌】**（次の患者には投与しないこと）

透析療法を受けている患者

[他のアルミニウム含有製剤で、長期投与によりアルミニウム脳症、アルミニウム骨症があらわれたとの報告がある。]

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

**慎重投与**（次の患者には慎重に投与すること）

腎障害のある患者

[長期投与によりアルミニウム脳症、アルミニウム骨症があらわれるおそれがあるので、定期的に血中アルミニウム、リン、カルシウム、アルカリリフォスファターゼ等の測定を行うこと。]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

### 7. 相互作用

«相互作用»

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

## (2) 併用注意とその理由

### [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
テトラサイクリン系抗生物質 テトラサイクリン ドキシサイクリン塩酸塩水和物等	テトラサイクリン系抗生物質の作用が減弱するおそれがあるので、同時に服用させないこと。	本剤に含まれるアルミニウムイオンとキレートを形成し、吸収が阻害される。
ニューキノロン系抗菌剤 塩酸シプロフロキサシン ノルフロキサシン オフロキサシン等	ニューキノロン系抗菌剤の作用が減弱するおそれがあるので、同時に服用させないこと。	

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

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ため、発現頻度については文献、自発報告等を参考に集計した。

総症例 3,120 症例中、副作用が報告されたのは 5 症例 (0.16%) で、いずれも便秘であった（再評価結果）。

	0.1～5%未満
消化器	便秘

### (2) 重大な副作用と初期症状

該当しない

### (3) その他の副作用

該当しない

#### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

全対象症例 5,049 例中 15 例(0.30%)、延べ 17 症状(0.34%)が認められた。いずれも消化器系のもので、軽度であった。

発現症状	発現例数	発現率
便 秘	12 例	0.24%
下 痢	2 例	0.04%
悪 心	1 例	0.02%
腹部膨満感	1 例	0.02%
食欲不振	1 例	0.02%
計	17 例	0.34%

(1992 年 1 月、社内集計)

#### (5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

#### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当しない

#### 9. 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慎重に投与すること。

#### 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

該当しない

#### 11. 小児等への投与

該当しない

#### 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

### 13. 過量投与

該当資料なし

<参考>

最大使用投与量及び投与期間

①胃潰瘍：イサロン顆粒 50% 1回 1g、1日 4g、8週間

参考文献：基礎と臨床, 12 : 1925, 1978

②十二指腸潰瘍：イサロン顆粒 50% 1回 1g、1日 3g、8週間

参考文献：基礎と臨床, 13 : 903, 1979

### 14. 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）。

### 15. その他の注意

該当しない

### 16. その他

該当しない

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験<sup>12)</sup>

LD<sub>50</sub> (mg/kg)

動物	性	経 口	腹腔内
ラット	♂	>4,000	>4,000
マウス	♀	>8,000	>8,000

(2) 反復投与毒性試験<sup>19)</sup>

- 1) ラット（雌雄）にアルジオキサを含む飼料（2.5%、5%、10%）を与えて94日間飼育し、対照群（飼料のみ投与）と比較検討した結果、食事摂取量、発育、血液所見、臓器所見、生殖能力等に何ら差は認められていない。
- 2) ラット（雌雄）にアルジオキサを含む飼料（2.5%、5%、10%）を与えて311日間飼育し、対照群（飼料のみ投与）と比較検討した結果、食事摂取量、発育、血液所見、臓器所見、生殖能力等に何ら差は認められていない。

(3) 生殖発生毒性試験<sup>19)</sup>

ラット（第一世代）にイサロン2.5、5、10%濃度を含む飼料を与えて飼育した。第二世代の児ラットは生後21日に離乳させ、同様にイサロンを含む飼料を与えた。さらに第三世代に対しても同様な検討を行った結果、対照群（飼料のみ投与）と比べて何ら異常所見は認められなかった。

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：該当しない

有効成分：該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：4年（安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

イサロン顆粒25%とイサロン顆粒50%は、含量別に包装が異なるが、いずれも白色の顆粒であることから、取扱いには注意すること。

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

イサロン錠100mg : 100錠 (10錠×10)  
500錠 (10錠×50)  
1,000錠 (10錠×100、バラ)  
2,800錠 (28錠×100)

イサロン顆粒25% : 500g

イサロン顆粒50% : 100g、500g

## 7. 容器の材質

### <イサロン錠 100mg>

PTP 包装	PTP シート	ポリプロピレン、アルミニウム
バラ包装	袋	ポリエステル・アルミニウム・ポリエチレンラミネート

### <イサロン顆粒 25%・50%>

アルミ袋包装	袋	ポリエステル・アルミニウム・ポリエチレンラミネート
分包包装	個包装	セロハン・ポリエチレン複合フィルム

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分：アランタ SP 細粒 20%・SF 錠 100mg、アスコンプ顆粒 50%・細粒 25%

同 効 薬：メチルメチオニンスルホニウムクロリド、ゲファルナート、スクラルファート、セトラキサート塩酸塩、ソファルコン、テプレノン、イルソグラジンマレイン酸塩

## 9. 国際誕生年月日

不明

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
イサロン錠 100mg	2008年 8月 11日	22000AMX01850000
イサロン錠（旧販売名）	1970年 7月 27日	14500AMZ02612000
イサロン顆粒 25%	1986年 12月 5日	16100AMZ04713000
イサロン顆粒 50%	2001年 6月 25日	21300AMZ00491000
イサロン顆粒（旧販売名）	1971年 5月 20日	14600AMZ01065000

## 11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
イサロン錠 100mg	2008年 12月 19日
イサロン錠（旧販売名）	1972年 2月 1日
イサロン顆粒 25%	1987年 10月 1日
イサロン顆粒 50%	2001年 9月 7日
イサロン顆粒（旧販売名）	1972年 2月 1日

## 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

### 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

#### (1) 再評価

通知年月日：1982年1月8日

再評価結果：

[承認時]

**効能又は効果**

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、急性胃炎、慢性胃炎

[評価結果]

**効能又は効果**

下記疾患における自覚症状及び他覚所見の改善

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃炎

**用法及び用量**

アルジオキサとして、通常成人1日300～400mgを3～4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) 品質再評価

通知年月日：2000年12月21日

再評価結果：薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない。

### 14. 再審査期間

該当しない

### 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は投与期間に関する制限は定められていない。

### 16. 各種コード

販売名	薬価基準収載 医薬品コード	HOT(9桁) コード	レセプト電算 コード
イサロン錠 100mg	2329002F2165	104348801	620008500
イサロン顆粒 25%	2329002D3020	104336501	612320391
イサロン顆粒 50%	2329002D4248	014341901	610454006

### 17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## X I . 文献

### 1. 引用文献

- 1) 社内資料（安定性試験）
- 2) 社内資料（溶出試験）
- 3) 大木一郎 他：基礎と臨床，10：3429, 1976
- 4) 馬場滝夫 他：基礎と臨床，24：2979, 1990
- 5) 山形敞一 他：診療と新薬，15：287, 1978
- 6) 石井信光 他：診療と新薬，12：897, 1975
- 7) 府川和永 他：応用薬理，7：1339, 1973
- 8) 府川和永 他：応用薬理，8：45, 1974
- 9) 河野 修 他：薬理と治療，14：1367, 1986
- 10) 府川和永 他：応用薬理，26：921, 1983
- 11) 府川和永 他：応用薬理，27：295, 1984
- 12) 府川和永 他：社内資料（イサロンの薬理学的研究）
- 13) Cahen.R.et al. : Ann.Pharm.Franc., 20 : 693, 1962
- 14) Cahen.R.et al. : Ann.Pharm.Franc., 21 : 405, 1963
- 15) Cahen.R.et al. : Ann.Pharm.Franc., 20 : 704, 1962
- 16) Cahen.R.et al. : Ann.Pharm.Franc., 21 : 215, 1963
- 17) 府川和永 他：応用薬理，28：629, 1984
- 18) 府川和永 他：応用薬理，11：421, 1976
- 19) Cahen.R.et al. : Ann.Pharm.Franc., 20 : 623, 1962

### 2. その他の参考文献

- 1) 三木 宏 他：基礎と臨床，12：1925, 1978
- 2) 森 純伸 他：基礎と臨床，13：903, 1979

## X II . 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

### X III . 備考

その他の関連資料

該当資料なし