

胃炎・消化性潰瘍治療剤
日本薬局方 アルジオキサ錠
イサロン[®]錠100mg
ISALON[®] TABLETS
日本薬局方 アルジオキサ顆粒
イサロン[®]顆粒25%
イサロン[®]顆粒50%
ISALON[®] GRANULES

日本標準商品分類番号 872329

	承認番号	薬価収載	販売開始
錠100mg	22000AMX01850	2008年12月	1971年12月
顆粒25%	16100AMZ04713	1987年10月	1987年10月
顆粒50%	21300AMZ00491	2001年 9月	1971年12月
			再評価結果 1982年 1月

貯 法：気密容器，室温保存
使用期限：外箱等に表示

【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.]

【組成・性状】

販 売 名	イサロン錠100mg		
成分・含量	1錠中 日局アルジオキサ 100mg		
添 加 物	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		
剤 形	白色素錠		
外 形	表	側 面	裏
	直径 8.0mm 厚さ 約2.8mm 重量 200mg		
識別コード	G210		

販 売 名	イサロン顆粒25%	イサロン顆粒50%
成分・含量	1g中 日局アルジオキサ 250mg	1g中 日局アルジオキサ 500mg
添 加 物	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	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
剤 形	白色顆粒剤	

【効能・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・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。

【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)

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，アルカリフォスファターゼ等の測定を行うこと.]

2. 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
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。	

3. 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

4. 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。

5. 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)。

【薬 物 動 態】

1. 血漿中濃度¹⁾

(参考)

アルジオキサ-¹⁴C 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。

2. 溶出挙動¹⁴⁾

イサロン錠 100mg，イサロン顆粒 25%及びイサロン顆粒 50%は，日本薬局方医薬品各条に定められたアルジオキサ錠及びアルジオキサ顆粒の溶出規格に適合していることが確認されている。

【臨床成績】^{2～5)}

二重盲検比較試験を含む臨床試験で胃潰瘍・十二指腸潰瘍，急性・慢性胃炎の自他覚的所見の改善に対して有用性が認められている。

【薬効薬理】

酢酸潰瘍⁶⁾、ストレス潰瘍⁷⁾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、また、ストレス潰瘍⁸⁾、Shay潰瘍^{7,8)}、ヒスタミン潰瘍⁷⁾、レセルピン潰瘍⁹⁾、フェニルブタゾン潰瘍⁹⁾において潰瘍の発生が抑制された(ラット、ヒスタミン潰瘍のみモルモット)。これらの実験潰瘍に対する効果は次のような薬理作用に基づくものと考えられる。

1. 肉芽形成・粘膜上皮再生促進作用⁶⁾

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・血流改善作用¹⁰⁾

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の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^{6,11)}

酢酸潰瘍における組織化学的検討から、再生上皮及び潰瘍底肉芽組織の酸性ムコ多糖体を増加させた(ラット)。また、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)。

4. 胃粘膜 PGs 正常化作用¹²⁾

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

5. H⁺ Back diffusion 抑制作用¹¹⁾

アスピリンによる胃障害において惹起された H⁺ 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^{7,13)}

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¹³⁾

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)。

【有効成分に関する理化学的知見】

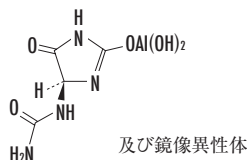
一般名: アルジオキサ

Aldioxa [JAN]

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

分子式: C₄H₇AlN₄O₅

化学構造式:



分子量: 218.10

性状: 白色の粉末である。

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。

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。

融点: 約 230℃ (分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験¹⁵⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験 (室温, 4年) の結果、イサロン錠 100mg, イサロン顆粒 25% 及びイサロン顆粒 50% 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。

*【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)

イサロン顆粒 25%: 500g

イサロン顆粒 50%: 100g, 500g

【主要文献】

- 1) 府川 和 永 他: 応用薬理, **11**: 421, 1976
- 2) 大木 一 郎 他: 基礎と臨床, **10**: 3429, 1976
- 3) 馬場 滝 夫 他: 基礎と臨床, **24**: 2797, 1990
- 4) 山形 徹 一 他: 診療と新薬, **15**: 287, 1978
- 5) 石井 信 光 他: 診療と新薬, **12**: 897, 1975
- 6) 府川 和 永 他: 応用薬理, **7**: 1339, 1973
- 7) 社内資料 (イサロンの薬理学的研究)
- 8) Cahen, R. et al.: Ann. Pharm. Franc., **20**: 704, 1962
- 9) Cahen, R. et al.: Ann. Pharm. Franc., **21**: 215, 1963
- 10) 河野 修 他: 薬理と治療, **14**: 1367, 1986
- 11) 府川 和 永 他: 応用薬理, **26**: 921, 1983
- 12) 府川 和 永 他: 応用薬理, **27**: 295, 1984
- 13) Cahen, R. et al.: Ann. Pharm. Franc., **20**: 693, 1962
- 14) 社内資料 (溶出試験)
- 15) 社内資料 (安定性試験)

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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。

あすか製薬株式会社 くすり相談室

〒108-8532 東京都港区芝浦二丁目5番1号

TEL 0120-848-339

FAX 03-5484-8358

製造販売元

あすか製薬株式会社

東京都港区芝浦二丁目5番1号

販売

武田薬品工業株式会社

大阪府中央区道修町四丁目1番1号