

【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、潰瘍の癒着化を促進した(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】

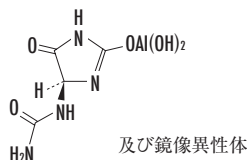
一般名：アルジオキサ

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°C (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) 山形敵一 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