

胃炎・消化性潰瘍治療剤
日本薬局方 アルジオキサ錠
アルジオキサ錠100mg「あすか」
ALDIOXA TABLETS
日本薬局方 アルジオキサ顆粒
アルジオキサ顆粒25%「あすか」
アルジオキサ顆粒50%「あすか」
ALDIOXA GRANULES

貯 法：室温保存
有効期間：3年

| | | |
|------------|--------|---------------|
| 日本標準商品分類番号 | | |
| 872329 | | |
| 承認番号 | 錠100mg | 23000AMX00047 |
| | 顆粒25% | 23000AMX00048 |
| | 顆粒50% | 23000AMX00146 |
| 販売開始 | 錠100mg | 1971年12月 |
| | 顆粒25% | 1987年10月 |
| | 顆粒50% | 1971年12月 |

2. 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。〕〔9.2.1参照〕

3. 組成・性状

3.1 組成

| | | |
|------|--|--|
| 販売名 | アルジオキサ錠100mg「あすか」 | |
| 有効成分 | 1錠中 日局アルジオキサ 100mg | |
| 添加剤 | メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、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、ステアリン酸マグネシウム | |

| | | |
|------|--|---|
| 販売名 | アルジオキサ顆粒25%「あすか」 | アルジオキサ顆粒50%「あすか」 |
| 有効成分 | 1g中 日局アルジオキサ 250mg | 1g中 日局アルジオキサ 500mg |
| 添加剤 | 乳糖水和物、結晶セルロース、デキストリン、トウモロコシデンプン、カルメロースカルシウム、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、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、デキストリン、結晶セルロース、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 |

3.2 製剤の性状

| | | | |
|-------|--------------------------|----|---|
| 販売名 | アルジオキサ錠100mg「あすか」 | | |
| 剤形 | 白色素錠 | | |
| 外形 | 表 | 側面 | 裏 |
| | | | |
| | 直径8.0mm 厚さ約2.8mm 質量200mg | | |
| 識別コード | G210 | | |

| | | |
|-----|------------------|------------------|
| 販売名 | アルジオキサ顆粒25%「あすか」 | アルジオキサ顆粒50%「あすか」 |
| 剤形 | 白色顆粒剤 | |

4. 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

6. 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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 透析療法を受けている患者

投与しないこと。〔2.参照〕

9.2.2 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。

9.5 妊婦

治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。

10. 相互作用

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 |
|---|--|-------------------------------------|
| 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。 | |

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。

11.2 その他の副作用

| | |
|-----|----------|
| | 0.1～5%未満 |
| 消化器 | 便秘 |

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

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¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈胃潰瘍〉

17.1.1 国内二重盲検比較試験

胃潰瘍患者を対象に本剤（アルジオキサとして100mg）1日4回6週間経口投与し、対照群（ゲファルナート）と比較した結果、以下のとおりであった。副作用は認められなかった²⁾。

| | n | 総合評価判定（累積有効率） | | | | Ridit検定 |
|---------|----|---------------|-----------|-----------|----|---------|
| | | 著効 | 有効 | やや有効 | 無効 | |
| アルジオキサ | 40 | 20 (50.0%) | 7 (67.5%) | 5 (80.0%) | 8 | N.S. |
| ゲファルナート | 40 | 18 (45.0%) | 5 (57.5%) | 8 (77.5%) | 9 | |

(十二指腸潰瘍)

17.1.2 国内臨床試験

十二指腸潰瘍患者74例(男性59例、女性15例)を対象に本剤(アルジオキサとして100mg)1日4回6週間経口投与した結果、以下のとおりであった。副作用は認められなかった³⁾。

| 内視鏡判定による有効率 (累積有効率) | n | 総合判定 | | | | |
|------------------------|----|------------|------------|-----------|----|----|
| | | 著効 | 有効 | やや有効 | 無効 | 悪化 |
| | 74 | 26 (35.1%) | 21 (63.5%) | 7 (73.0%) | 20 | |

(胃炎)

17.1.3 国内二重盲検比較試験

急性胃炎又は慢性胃炎の急性増悪所見を有する患者を対象に本剤(アルジオキサとして100mg)1日4回1週間経口投与し、対照群(プラセボ)と比較した結果、以下のとおりであった。副作用は認められなかった⁴⁾。

| | n | 総合判定 | | | | | Mann-Whitney U検定 |
|--------|-----|------|----|------|----|----|---------------------|
| | | 著効 | 有効 | やや有効 | 無効 | 悪化 | |
| アルジオキサ | 113 | 23 | 52 | 24 | 13 | 1 | p<0.01 |
| プラセボ | 118 | 10 | 52 | 36 | 17 | 3 | |

17.1.4 国内臨床試験

急性胃炎又は慢性胃炎患者を対象に本剤4週間経口投与し、1日2回投与(アルジオキサとして1回200mg)と1日4回投与(アルジオキサとして1回100mg)を比較した結果、以下のとおりであった。副作用は認められなかった⁵⁾。

| | n | 総合効果判定(累積有効率) | | | | Wilcoxon 順位和検定 |
|--------|----|---------------|-----------|-----------|----|-------------------|
| | | 著効 | 有効 | やや有効 | 無効 | |
| 1日2回投与 | 28 | 11 (39.3%) | 9 (71.4%) | 6 (92.9%) | 2 | N.S. |
| 1日4回投与 | 22 | 10 (45.5%) | 3 (59.1%) | 5 (81.8%) | 4 | |

注) 承認されている用法・用量は、通常成人にアルジオキサとして1日300~400mgを3~4回に分割経口投与である。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

局所傷薬であるアラントインに制酸作用を有する水酸化アルミニウムを結合させたもので、消化管内で加水分解され両者が分離する。アラントインの大部分は吸収される。持続的な制酸作用、抗ペプシン作用を現す。また、胃粘膜損傷部位に付着し被覆作用を現すと共に、肉芽形成、結合組織の増生、粘膜再生及び粘膜下血管の新生を促し、潰瘍の治癒過程を促進する⁶⁾。

18.2 薬理作用

酢酸潰瘍⁷⁾、ストレス潰瘍⁸⁾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⁹⁾、Shay潰瘍^{8),9)}、ヒスタミン潰瘍⁸⁾、レセルピン潰瘍¹⁰⁾、フェニルブタゾン潰瘍¹⁰⁾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。

18.2.1 肉芽形成・粘膜上皮再生促進作用

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、潰瘍の癒着を促進した(ラット)⁷⁾。

18.2.2 胃粘膜微細血管新生・血流改善作用

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)¹¹⁾。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)¹²⁾。

18.2.3 粘液成分分泌促進作用

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)⁷⁾。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)¹³⁾。

18.2.4 胃粘膜PGs正常化作用

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)¹⁴⁾。

18.2.5 H⁺Back diffusion抑制作用

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)¹³⁾。

18.2.6 抗ペプシン作用

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*)⁸⁾。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*)¹⁵⁾。

18.2.7 制酸作用

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)¹⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称: アルジオキサ (Aldioxa)

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

分子式: C₄H₇AlN₄O₅

分子量: 218.10

性状: 白色の粉末である。

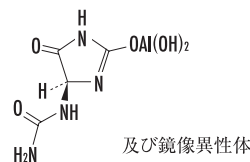
水又はエタノール(99.5)にほとんど溶けない。

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)

化学構造式:



22. 包装

〈アルジオキサ錠100mg「あすか」〉

100錠 [10錠(PTP)×10]

500錠 [10錠(PTP)×50]

1,000錠 [10錠(PTP)×100]

1,000錠 [アルミ袋、バラ]

〈アルジオキサ顆粒25%「あすか」〉

500g [アルミ袋]

〈アルジオキサ顆粒50%「あすか」〉

100g [アルミ袋]

500g [アルミ袋]

23. 主要文献

- 1) 府川和永他: 応用薬理. 1976;11(4):421-428
- 2) 石井信光他: 診療と新薬. 1975;12(4):897-923
- 3) 大木一郎他: 基礎と臨床. 1976;10(12):3429-3444
- 4) 山形徹一他: 診療と新薬. 1978;15(2):287-295
- 5) 馬場滝夫他: 基礎と臨床. 1990;24(5):2797-2807
- 6) 第十七改正日本薬局方解説書. 廣川書店;2016. C352-355
- 7) 府川和永他: 応用薬理. 1973;7(9-10):1339-1348
- 8) 社内資料: 薬理学的研究
- 9) Cahen, R. et al.: Ann. Pharm. Franc. 1962;20:704-713
- 10) Cahen, R. et al.: Ann. Pharm. Franc. 1963;21:215-222
- 11) 府川和永他: 応用薬理. 1974;8(1):45-54
- 12) 河野 修他: 薬理と治療. 1986;14(3):1367-1371
- 13) 府川和永他: 応用薬理. 1983;26(6):921-925
- 14) 府川和永他: 応用薬理. 1984;27(2):295-300
- 15) Cahen, R. et al.: Ann. Pharm. Franc. 1962;20:693-703

24. 文献請求先及び問い合わせ先

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

26. 製造販売業者等

26.1 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

26.2 販売元

武田薬品工業株式会社

大阪市中央区道修町四丁目1番1号