

** 2009年12月改訂 (第10版、主要文献の記載整備)
* 2007年1月改訂 (日本薬局方 第十五改正に伴う改訂)

日本標準商品分類番号
872329

貯法：しゃ光・室温保存
使用期限：外箱及び容器に表示

粘膜保護・組織修復
胃炎・胃潰瘍治療剤

	錠50	カプセル100	細粒20%
承認番号	20600AMZ00451000	21300AMZ00646000	21600AMZ00120000
薬価収載	1994年7月	2001年9月	2004年7月
販売開始	1994年10月	1984年3月	2004年8月
再審査結果	1990年9月	効能追加	1987年12月

ソロン錠50 ソロンカプセル100 ソロン細粒20%


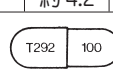
SOLON tab.50/cap.100/fine granules 20%

ソファルコン製剤

*【組成・性状】

販売名	ソロン錠50	ソロンカプセル100
成分・含量	1錠中 ソファルコン 50 mg	1カプセル中 ソファルコン 100 mg
添加物	無水リン酸水素カルシウム D-マンニトール メタケイ酸アルミン酸マグネシウム トウモロコシデンブ 低置換度ヒドロキシプロピルセルロース ポリソルベート80 ヒプロメロース 硬化油 ステアリン酸マグネシウム	無水リン酸水素カルシウム 結晶セルロース ヒドロキシプロピルスターチ メタケイ酸アルミン酸マグネシウム カルメロースカルシウム ポリソルベート80 ヒプロメロース ステアリン酸マグネシウム 硬化油 カプセル本体： ゼラチン ラウリル硫酸ナトリウム 二酸化チタン

販売名	ソロン細粒20%
成分・含量	0.5g中 ソファルコン 100 mg
添加物	無水リン酸水素カルシウム D-マンニトール バレイシヨデンブ ポリソルベート80 ヒプロメロース 軽質無水ケイ酸 香料

販売名	識別コード	剤形	外形・サイズ等		
			上面	下面	側面
ソロン錠50	T290	淡黄色～黄色の素錠			
			直径 (mm)	厚み (mm)	重量 (mg)
			約9	約4.2	約300
ソロンカプセル100	T292	キャップ部及びボディ部が白色不透明な1号硬カプセル			
			重量 (mg)		
			約376		
ソロン細粒20%	T294 (分包)	微黄色～淡黄色の細粒			

【効能・効果】

下記疾患の胃粘膜病変（びらん、出血、発赤、浮腫）の改善
急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期
胃潰瘍

【用法・用量】

通常、成人にはソファルコンとして1回100mgを1日3回経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 副作用

総症例22,583例中20例(0.09%)23件の副作用が認められた。その主なものは便秘7件、口渇2件、胸やけ2件であった。〔再審査終了時及び「錠50」承認時〕

(1) 重大な副作用

肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）：AST(GOT)、ALT(GPT)、γ-GTP、Al-Pの上昇等を伴う肝機能障害や黄疸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。

(2) その他の副作用

	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^(注)		発疹
消化器	便秘 口渇 胸やけ	

注) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

2. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

(2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。〔動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが報告されている。〕

3. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

4. 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、更には穿孔をお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. 吸収^{(1)~(4)}

健常人にソファルコンとして100mgを空腹時経口投与した場合、速やかに消化管から吸収され投与後約1時間で最高血中濃度(約0.50~0.66 μg/mL)に達し、12時間後にはほぼ血中から消失する。血中濃度半減期は約1時間である。また、連続投与しても蓄積性は認められない。

2. 分布⁽⁵⁾

(参考) 動物による成績：

ラットへの経口投与による検討では、肝、消化管に高濃度の分布が認められ、他組織への移行は概ね血中濃度以下であり、中枢神経系への移行は極めてわずかである。

また、消化性潰瘍ラットでの分布は正常ラットと類似しているが、正常、病態時とも胃表面に比較的長時間にわたって残存し、胃壁付着による保護作用の可能性が示唆される。

3. 代謝⁽¹⁾

健常人に経口投与した場合、主代謝物としてカルコン骨格のα、β不飽和結合還元体、更に、イソプレニル側鎖酸化体が認められる。

4. 排泄^{(1),(6)}

健常人にソファルコンとして100~300mgを経口投与した場合、イソプレニル側鎖酸化体として48時間までに投与量の6~8%が尿中に排泄される。

(参考) 動物による成績：

ラット及びマウスに経口投与した結果、いずれも24時間までに投与量の約90%が糞中へ排泄され、一部尿中へも排泄される。

【臨床成績】

承認時に実施された二重盲検比較試験を含む臨床試験における総症例1,120例での成績は以下の通りであった。

疾患名	有効率(%) 【中等度改善以上】	内視鏡判定改善率(%) 【改善以上】
*胃炎 ^{(7)~(11)}	85.7 (335/391)	82.4 (322/391)
胃潰瘍 ^{(12)~(19)}	82.9 (604/729)	78.7 (574/729)

※：下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善
急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期

【薬効薬理】

1. 実験潰瘍に対する作用^{(20),(21)}

ラットにおける幽門結紮、ストレス、レセルピン、フェニルブタゾン、ヒスタミン及び酸性アスピリン惹起潰瘍を各々抑制し、ラット酢酸潰瘍及びモルモットヒスタミン潰瘍に対して潰瘍治癒を促進する。

2. 実験胃炎に対する作用^{(22)~(25)}

タウロコール酸ナトリウム及びN-メチル-ニトロソグアニジンによって惹起されるラットの慢性萎縮性胃炎に対し治癒効果を示す。

3. 急性胃粘膜病変に対する作用⁽²⁶⁾

アスピリン及び50%エタノールによるラット急性胃粘膜病変を抑制する。

4. 胃粘膜保護作用^{(27)~(30)}

0.6N塩酸及び100%エタノールによるラット胃粘膜病変を抑制する。

5. 胃血流量増加作用^{(31),(32)}

水素ガスクリアランス法及び交叉熱電対法においてラットの胃組織血流量を増加させ、また、電磁血流量計法においてイヌの短胃動脈血流量を増加させる。

6. 胃粘膜血管拡張作用⁽³³⁾

生体位ビデオ観察法及び透明標本法においてラット胃粘膜の血管拡張作用を示す。

7. 胃組織酸素消費量増加作用⁽³⁴⁾

血管内酸素分圧測定法においてイヌの胃組織酸素消費量を増加させる。

8. 胃粘膜修復促進作用⁽³⁵⁾

ラット酢酸潰瘍の組織学的検討において胃粘膜再生促進作用を示す。

9. 胃壁構成成分増加作用^{(26),(36)~(40)}

ラットの胃粘膜高分子糖蛋白質硫酸化酵素活性を上昇させるとともに、ストレス、アスピリン及び酢酸潰瘍において胃壁硫酸化ムコ物質を増加させる。

また、ラットのストレス潰瘍、急性胃粘膜病変及びタウロコール酸ナトリウム惹起胃炎において胃粘膜内高分子糖蛋白質の減少及び生合成能の低下を抑制する。

10. 胃粘液の胃粘膜への接着性に対する作用^{(30),(41)}

100%エタノール投与によるラット胃粘膜の粘液糖蛋白質の胃液中への放出を抑制し、胃粘膜の接着性を保持する。

11. 胃粘膜粘液の強化作用⁽⁴²⁾

ブタ胃より分取した粘液において、粘度を高め水素イオンの透過性を抑制するとともにペプシン活性を抑制する。

12. 金属プロテアーゼ産生抑制作用⁽³⁾

タウロコール酸ナトリウム惹起ラット胃炎の胃組織培養細胞からの金属プロテアーゼ産生を抑制する。

13. 胃粘膜細胞新生能に対する作用⁽⁴⁾

³H-チミジンの増殖細胞の標識率を指標とした胃粘膜細胞新生能の検討においてタウロコール酸ナトリウム惹起ラット慢性萎縮性胃炎の胃粘膜細胞新生能を亢進する。

14. 胃組織プロスタグランジン量に対する作用^{(45)~(49)}

ウサギ(in vitro)、ラット、ブタ及び胃潰瘍患者の胃粘膜プロスタグランジン量を増加させる。その作用機序はプロスタグランジン分解酵素15-ヒドロキシプロスタグランジン脱水素酵素(15-OH-PG-DH)活性の阻害による。また、ラットにおけるタウロコール酸ナトリウム惹起胃炎における15-OH-PG-DH活性の上昇とプロスタグランジン量の低下を抑制する。

15. 抗酸化作用⁽⁵⁰⁾

活性酸素が関与すると考えられる虚血一再灌流によるラット胃粘膜障害を抑制し、脂質過酸化の指標であるチオバルビツール酸反応物質を低下させる。

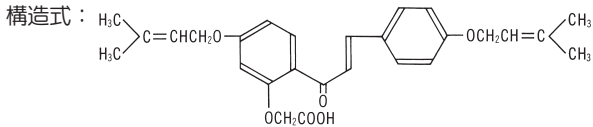
16. *Helicobacter pylori* に対する作用^{51)~56)}

Helicobacter pylori に対して、抗菌活性及び菌体と胃粘液との付着抑制作用等を有する (*in vitro*)。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ソファルコン (sofalcone) (JAN)

化学名：2'-carboxymethoxy-4,4'-bis(3-methyl-2-butenyloxy) chalcone



分子式：C₂₇H₃₀O₆

分子量：450.52

性状：淡黄色～黄色の結晶又は結晶性の粉末で、におい及び味はない。ジメチルホルムアミド及びジクロロメタンにやや溶けやすく、メタノール、エタノール(95)又はエタノール(99.5)に溶けにくく、水にほとんど溶けない。光によって徐々に変化する。

融点：142～146℃

【包装】

ソロン錠 50：PTP 100錠、PTP 1000錠

ソロンカプセル100：PTP100カプセル

ソロン細粒 20%：100g、1kg、

0.5g×90包、0.5g×1200包

**【主要文献】

- 1) 林徹ほか：薬理と治療, **10** (5), 2697 (1982)
- 2) 社内資料 (カプセル 100 の生物学的同等性に関する資料)
- 3) 社内資料 (錠 50 の生物学的同等性に関する資料)
- 4) 社内資料 (細粒 20% の生物学的同等性に関する資料)
- 5) 野津隆司ほか：応用薬理, **18** (5), 823 (1979)
- 6) 野津隆司ほか：応用薬理, **18** (5), 815 (1979)
- 7) 森治樹ほか：基礎と臨床, **21** (1), 259 (1987)
- 8) 名尾良憲ほか：診療と新薬, **23** (12), 2619 (1986)
- 9) 後藤由夫ほか：診療と新薬, **23** (12), 2633 (1986)
- 10) 野村喜重郎：薬理と治療, **20** (5), 2015 (1992)
- 11) 森治樹：薬理と治療, **20** (10), 4125 (1992)
- 12) 名尾良憲ほか：臨床成人病, **12** (9), 1677 (1982)
- 13) 市田文弘ほか：臨床成人病, **12** (12), 2427 (1982)
- 14) 野村喜重郎ほか：薬理と治療, **10** (5), 2721 (1982)
- 15) 野村喜重郎ほか：薬理と治療, **10** (5), 2733 (1982)
- 16) 五味清英ほか：薬理と治療, **10** (5), 2759 (1982)
- 17) 石川誠ほか：薬理と治療, **10** (5), 2769 (1982)
- 18) 野村喜重郎：薬理と治療, **20** (5), 2005 (1992)
- 19) 森治樹：薬理と治療, **20** (10), 4137 (1992)
- 20) 佐直隆一ほか：応用薬理, **18** (4), 579 (1979)
- 21) Konturek, S. J. et al.: Eur. J. Pharmacol., **125** (2), 185 (1986)
- 22) 岸本真也ほか：内科宝函, **33** (10), 355 (1986)

- 23) 岸本真也ほか：内科宝函, **33** (12), 455 (1986)
- 24) 岸本真也ほか：内科宝函, **33** (10), 349 (1986)
- 25) 岸本真也ほか：内科宝函, **33** (9), 291 (1986)
- 26) Muramatsu, M. et al.: Res. Commun. Chem. Pathol. Pharmacol., **54** (3), 321 (1986)
- 27) Saziki, R. et al.: J. Pharmacobio. Dyn., **7**, 791 (1984)
- 28) Suwa, T. et al.: Japan. J. Pharmacol., **35** (1), 47 (1984)
- 29) Isobe, Y. et al.: Arzneimittel.-Forsch./Drug Res., **35** (I), 1, 138 (1985)
- 30) Fujimoto, N. et al.: J. Pharmacobio. Dyn., **7**, 864 (1984)
- 31) Matsuo, Y. et al.: Arzneimittel.-Forsch./Drug Res., **33** (I), 2, 242 (1983)
- 32) 佐直隆一ほか：日薬理誌, **79** (3), 193 (1982)
- 33) 勝呂信雄ほか：応用薬理, **23** (1), 63 (1982)
- 34) 佐直隆一ほか：診療と新薬, **21** (1), 185 (1984)
- 35) Kimura, M. et al.: Japan. J. Pharmacol., **35** (4), 389 (1984)
- 36) Murakami, S. et al.: Res. Commun. Chem. Pathol. Pharmacol., **57** (1), 77 (1987)
- 37) 諏訪俊男ほか：診療と新薬, **21** (1), 175 (1984)
- 38) Suwa, T. et al.: Japan. J. Pharmacol., **34** (1), 89 (1984)
- 39) 諏訪俊男ほか：診療と新薬, **21** (1), 181 (1984)
- 40) Slomiany, A. et al.: Gastroenterology, **92** (5), 1645 (1987)
- 41) Murakami, S. et al.: J. Pharmacobio. Dyn., **9**, 359 (1986)
- 42) Sarosiek, J. et al.: Digestion, **37**, 238 (1987)
- 43) 仲西城太郎ほか：応用薬理, **32** (6), 1113 (1986)
- 44) Kohno, Y. et al.: Japan. J. Pharmacol., **43** (4), 407 (1987)
- 45) Muramatsu, M. et al.: Biochem. Pharmacol., **33** (16), 2629 (1984)
- 46) Muramatsu, M. et al.: Life Sciences, **41** (3), 315 (1987)
- 47) Muramatsu, M. et al.: Res. Commun. Chem. Pathol. Pharmacol., **53** (3), 289 (1986)
- 48) Ota, S. et al.: J. Clin. Gastroenterol., **17** (Suppl.1), S15 (1993)
- 49) 朝倉均ほか：Gastroenterological Endoscopy, **31** (6), 1464 (1989)
- 50) Yoshikawa, T. et al.: J. Clin. Gastroenterol., **17** (Suppl. 1), S111 (1993)
- 51) 長手尊俊：最新医学, **44** (2), 318 (1989)
- 52) 藤岡利生ほか：診療と新薬, **30** (10), 1831 (1993)
- 53) Sunairi, M. et al.: Eur. J. Gastroenterol. Hepatol., **6** (Suppl.1), S121 (1994)
- 54) Slomiany, B. L. et al.: Digestion, **43**, 33 (1989)
- 55) 神谷茂ほか：Prog. Med., **15** (11), 2383 (1995)
- 56) Kamiya, S. et al.: J. Clin. Gastroenterol., **25** (Suppl.1), S172 (1997)

【文献請求先】

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下さい。

大正富山医薬品株式会社 メディカルインフォメーションセンター
〒170-8635 東京都豊島区高田3-25-1
電話 0120-591-818