＊＊2020年２月改訂（第７版）
＊2019年４月改訂（第６版）

令和３年12月20日
令和３年度医薬品等安全対策調査会
資料１－４

光線力学診断用剤

処方箋医薬品注）

アラベル®内用剤1.5g
Alabel® Oral 1.5g

（アミノレブリン酸塩酸塩）

承認番号	22500AMX00883000
薬価収載	2013年８月
販売開始	2013年９月
国際誕生	2007年９月

貯　　法：室温保存
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
1．本剤又はポルフィリンに対し過敏症の既往歴のある患者
2．ポルフィリン症の患者〔症状を増悪させるおそれがある。〕
3．光線過敏症を起こすことが知られている薬剤：テトラサイクリン系抗生物質、スルフォンアミド系製剤、ニューキノロン系抗菌剤、ヒペリシン（セイヨウオトギリソウ抽出物）等、セイヨウオトギリソウ（St. John's Wort、セント・ジョーンズ・ワート）含有食品を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕
4. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人〔「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照〕

【組成・性状】

販売名	アラベル内用剤1.5g
成分・含量	1バイアル中アミノレブリン酸塩酸塩1.5g
添加物	なし
性状	白色又はわずかに灰色を帯びた白色の塊で、水に溶かすとき、澄明で無色ないし微黄色の液

【効能・効果】
悪性神経膠腫の腫瘍摘出術中における腫瘍組織の可視化

【用法・用量】
通常、成人には、アミノレブリン酸塩酸塩として20mg/kgを、手術時の麻酔導入前3時間（範囲：2～4時間）に、水に溶解して経口投与する。

【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）
（1） 心血管系疾患のある患者〔収縮期及び拡張期血圧、肺動脈圧並びに肺血管抵抗が低下するおそれがある。〕
（2） 肝機能又は腎機能障害のある患者〔使用経験がない。〕

2．重要な基本的注意
（1） 本剤を用いた診断では、神経機能に関する情報は得られないことを考慮して切除範囲の決定の参考とすること。
（2） 本剤を用いた診断において偽陰性及び偽陽性を示す部位が生じる可能性があることを考慮し、他の方法による診断や残すべき神経機能も踏まえて切除範囲を決定すること。
（3） 本剤投与後少なくとも48時間は、強い光（手術室の照明、直射日光又は明るい集中的な屋内光等）への眼及び皮膚の曝露を避け、照度500ルクス以下注1の室内で過ごさせること。

注1：日本工業規格の照度基準（JIS Z 9110）では、病院の照度について、病室100～200ルクス、一般検査室・食堂200～500ルクス、診察室・薬局300～750ルクスと規定している。

（4） 肝機能障害があらわれることがあるので、定期的に肝機能検査を行うなど、患者の状態を十分に観察すること。
（5） 脳の機能的構造に関する深い知識があり、本剤の使用についての十分な知識と悪性神経膠腫の手術の豊富な経験を持つ医師の管理のもとに使用すること。

3．相互作用
（1）併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
光線過敏症を起こすことが知られている薬剤： テトラサイクリン系抗生物質 スルフォンアミド系製剤 ニューキノロン系抗菌剤 ヒペリシン（セイヨウオトギリソウ抽出物）等	光線過敏症を起こすおそれがある。 本剤投与後2週間は左記薬剤の投与又は食品の摂取は避けること。	本剤は体内で光感受性物質に代謝されるので、左記薬剤との併用又は食品の摂取により光線過敏症が増強されることが考えられる。
セイヨウオトギリソウ（St.John's Wort、セント・ジョーンズ・ワート）含有食品		

（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
バルビツール酸系全身麻酔剤 チオペンタール	ポルフィリン合成が促進され、肝障害があらわれるおそれがある。	アミノレブリン酸(5-ALA)合成酵素を誘導し、ヘム生合成を増強する。

4．副作用
国内の患者を対象とした第Ⅲ相試験において、安全性を評価した45例中、副作用（臨床検査値異常を含む）発現例数は11例（24.4％）で、悪心3例（6.7％）、嘔吐2例（4.4％）、発熱2例（4.4％）、肝機能異常2例（4.4％）、LDH増加1例（2.2％）、γ-GTP増加1例（2.2％）、リンパ球数減少1例（2.2％）、血小板数減少1例（2.2％）、血尿1例（2.2％）であった。（承認時）

＊＊(1) 重大な副作用
1)肝機能障害：γ-GTP（6.7％）、AST（GOT）（4.4％）、ALT（GPT）（4.4％）、Al-P（2.2％）の増加等を伴う肝機能障害があらわれることがあるので、定期的に肝機能検査を行うなど、十分に観察を行い、異常が認められた場合には、適切な処置を行うこと。〔「重要な基本的注意」の項参照〕
2)低血圧（頻度不明）：低血圧があらわれることがあるので、十分に観察を行い、異常が認められた場合には、適切な処置を行うこと。手術後も、低血圧が遷延し、昇圧剤の持続投与が必要な症例が報告されている。

＊＊(2) その他の副作用
次のような症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、適切な処置を行うこと。

分類＼頻度	5%以上	2～5%未満	頻度不明[注2]
一般・全身		発熱	悪寒
血液			貧血
精神・神経			脳浮腫、感覚鈍麻、片麻痺、失語症、痙攣、半盲
心・血管			血栓塞栓症、深部静脈血栓症
呼吸器			呼吸不全
胃腸	悪心	嘔吐	下痢
皮膚・皮下組織			光線過敏性反応、光線性皮膚症、紅斑
腎・尿路		血尿	
臨床検査		LDH増加、リンパ球数減少、血小板数減少	白血球数増加、血中ビリルビン増加、血中アミラーゼ増加

注2：海外でのみ認められている副作用については頻度不明とした。

5．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投与しないこと。〔妊娠ラットに投与した場合、胎児の発育遅延が、また、マウス、ラットの妊娠子宮及び胎児に直接光照射した場合、胎児毒性が生じるとの報告がある。〕
(2) 本剤投与後24時間は、授乳を避けさせること。〔乳汁移行について動物試験を実施していない。〕

6．小児等への投与
小児等における安全性は確立していない。〔使用経験がない。〕

7．過量投与
症例：外国の臨床試験において、1例で過量投与（38mg/kg）により、術中に呼吸不全が生じた。
処置：人工呼吸器による処置後、回復した。

8．適用上の注意
(1) 投与経路
本剤は経口投与のみに使用し、注射しないこと。
(2) 調製方法
本剤1バイアルに水50mLを加えて溶解後、24時間以内に使用する。24時間を過ぎた溶解液は廃棄する。
(3) 診断
1)本剤による診断の原理は、本剤投与後に体内で代謝されて生成したプロトポルフィリンⅨ（PPⅨ）が腫瘍組織に集積し、青色光線（400～410nm）により励起されPPⅨが赤色蛍光を発することを利用して、腫瘍組織を可視化することにある。
2)PPⅨが赤色蛍光を発することにより、通常での白色光では見分けられない腫瘍組織を認識し切除できるが、偽陰性及び偽陽性を示す場合がある。〔「重要な基本的注意」の項参照〕

9．その他の注意
(1) 動物試験（ラット、イヌ）で代謝物（PPⅨ）による肝臓障害が報告されている。
(2) 動物細胞に5-ALAを曝露後、光照射すると遺伝毒性を示すことが報告されている。
(3) マウスへの静脈内投与後に紫外線照射すると光毒性（死亡、炎症性皮膚反応）を生ずることが報告されている。

【薬物動態】
1．血漿中濃度[1)]
日本人患者6例に本剤20mg/kgを経口投与したときの血漿中未変化体濃度は、投与後0.83時間に最高濃度34.0mg/Lを示し、消失半減期は2.27時間であった。薬物動態パラメータを表1に示した。

表1 本剤20mg/kgを経口投与したときの未変化体の薬物動態パラメータ

C_{max} (mg/L)	AUC_{∞} (mg・h/L)	t_{max} (h)	$t_{1/2}$ (h)
34.0±12.7	77.1±40.7	0.83±0.26	2.27±2.35

（n=6、平均値±標準偏差）

2．血漿蛋白結合率[2)]
限外ろ過法により測定した5-ALAのヒト血漿蛋白結合率は、500～5,000μg/Lの濃度で12%であった。

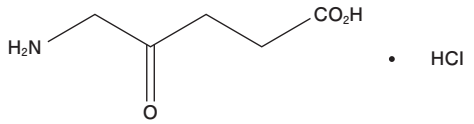
3．代謝[1)]
本剤の投与後、体内でPPⅨに代謝される。血漿中PPⅨ濃度は本剤投与後6.17時間に最高濃度351μg/Lを示し、消失半減期は4.91時間であった。

4．排泄[3)]
外国健康成人において、本剤投与後12時間までに投与量の30.6%が尿中に排泄された。

【臨床成績】
国内における第Ⅲ相試験（非盲検試験）[1)]
外科的腫瘍切除の適応である悪性神経膠腫患者を対象に、非盲検下で本剤20mg/kgを麻酔導入前3時間に経口投与した。本剤を投与した45例中、WHOグレードⅢ・Ⅳ以外の4例及び腫瘍本体に蛍光が認められなかった3例を除いた有効性評価症例38例において、主要評価項目である蛍光組織の陽性診断率（患者割合）は65.8%（25/38例）、蛍光の強/弱別での強蛍光領域及び弱蛍光領域では、それぞれ94.4%（34/36例）及び65.8%（25/38例）であった。また、蛍光組織での生検組織ごとの陽性診断率は85.6%（190/222検体）、強蛍光領域及び弱蛍光領域では、それぞれ94.4%（102/108検体）及び77.2%（88/114検体）であった。

【薬効薬理】
In vitroにおける悪性腫瘍細胞及び正常細胞を用いた5-ALA添加時のPPⅨ生成量は、正常細胞に比べて悪性腫瘍細胞では顕著に増加し、高い蓄積が認められている[4)]。
また、担癌ウサギに5-ALAを耳静脈内投与した時のPPⅨの脳内分布を検討した試験では、白質、灰白質より腫瘍部で多く認められている[5)]。
この作用機序として、腫瘍細胞では正常細胞に比べてPPⅨ生成までの酵素活性が高いこと及びPPⅨからヘムを触媒する酵素活性が低いことから、腫瘍細胞では正常細胞に比べてより多くのPPⅨが蓄積すると考えられている[6,7)]。

【有効成分に関する理化学的知見】
日本名：アミノレブリン酸塩酸塩
英　名：Aminolevulinic Acid Hydrochloride
化学名：5-Amino-4-oxopentanoic acid hydrochloride
分子式：$C_5H_9NO_3$・HCl
分子量：167.59
構造式：



性　状：白色又はわずかに灰色を帯びた白色の結晶性の粉末で、水に溶けやすく、エタノール（99.5）に溶けにくい。
融　点：約153℃（分解）

【承認条件】
本剤は希少疾病用医薬品であり、国内臨床試験における症例数が極めて少ないことから、製造販売後、一定症例数に係るデータが集積されるまでの間は、全症例を対象に使用成績調査を実施することにより、本剤使用患者の背景情報を把握するとともに、本剤の安全性及び有効性に関するデータを収集し、本剤の適正使用に必要な措置を講じること。

【包装】
アラベル内用剤1.5g：1バイアル

【主要文献】

1）社内資料：第Ⅲ相試験
2）社内資料：ヒト血漿蛋白結合率試験
3）社内資料：バイオアベイラビリティ試験
4）Iinuma S, et al.：Br J Cancer. 1994 ; 70：21-28
5）Lilge L, et al.：J Clin Laser Med Surg. 1998 ; 16：81-91
6）Navone NM, et al.：Int J Biochem. 1990 ; 22：1407-1411
7）Kondo M, et al.：Cell Biol Toxicol. 1993 ; 9：95-105

＊【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

ノーベルファーマ株式会社　カスタマーセンター
〒104-0033　東京都中央区新川1-17-24
フリーダイヤル：0120-003-140

＊製造販売元　ノーベルファーマ株式会社
東京都中央区新川１－１７－２４

ALA2002-7

＜参考＞　アラベル内用剤1.5g　体重あたりの投与量換算表
1バイアル（アミノレブリン酸塩酸塩1.5g含有）を水50mLで溶解した後の濃度は30mg/mLである。
体重あたりの投与量は下表を参照すること。

投与量（mL）＝体重（kg）× 20（mg/kg）÷ 30（mg/mL）

体重（kg）	投与液量※（mL）
35	23
36	24
37	25
38	25
39	26
40	27
41	27
42	28
43	29
44	29
45	30
46	31
47	31
48	32
49	33
50	33
51	34
52	35
53	35
54	36
55	37
56	37
57	38
58	39
59	39
60	40
61	41
62	41
63	42
64	43
65	43
66	44
67	45

体重（kg）	投与液量※（mL）
68	45
69	46
70	47
71	47
72	48
73	49
74	49
75	50
76	51※※
77	51※※
78	52※※
79	53※※
80	53※※
81	54※※
82	55※※
83	55※※
84	56※※
85	57※※
86	57※※
87	58※※
88	59※※
89	59※※
90	60※※
91	61※※
92	61※※
93	62※※
94	63※※
95	63※※
96	64※※
97	65※※
98	65※※
99	66※※
100	67※※

※　小数点1位を四捨五入した。
※※　2バイアルを用いて調製すること。

＊＊2021年６月改訂（第6版）
＊2021年１月改訂

日本標準商品分類番号
87729

承認番号	22900AMX00989000
薬価収載	2017年11月
販売開始	2017年12月
国際誕生	2007年９月

光線力学診断用剤

アラグリオ®顆粒剤分包1.5g

アミノレブリン酸塩酸塩顆粒剤

ALAGLIO®

規制区分：処方箋医薬品注）
貯　　法：遮光、室温保存
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。

注）注意―医師等の処方箋により使用すること

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1．本剤又はポルフィリンに対し過敏症の既往歴のある患者
2．ポルフィリン症の患者〔症状を増悪させるおそれがある。〕
3．光線過敏症を起こすことが知られている薬剤：テトラサイクリン系抗生物質、スルフォンアミド系製剤、ニューキノロン系抗菌剤、ヒペリシン（セイヨウオトギリソウ抽出物）等、セイヨウオトギリソウ（St.John's Wort、セント・ジョーンズ・ワート）含有食品を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕
4．妊婦又は妊娠している可能性のある婦人〔「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照〕

【組成・性状】

販売名	アラグリオ顆粒剤分包1.5g
成分・含量	１包中アミノレブリン酸塩酸塩1.5g
添加物	なし
性状	白色の顆粒、水に溶かすとき、無色澄明な液

【効能・効果】

経尿道的膀胱腫瘍切除術時における筋層非浸潤性膀胱癌の可視化

<効能・効果に関連する使用上の注意>

炎症部位では偽陽性を生じることがあり、BCG又は抗がん剤の膀胱内投与や膀胱生検等により膀胱内に炎症が生じている場合があるため、本剤を用いた経尿道的膀胱腫瘍切除術（TURBT）施行の適否を慎重に判断すること。

【用法・用量】

通常、成人には、アミノレブリン酸塩酸塩として20mg/kgを、膀胱鏡挿入３時間前（範囲：２～４時間前）に、水に溶解して経口投与する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

（1）本剤投与後に体内で生成されたプロトポルフィリンⅨ（PPⅨ）は、400～410nmの波長域を含む青色励起光により励起され、635nmをピークとする赤色蛍光を発する。
上記の青色励起光を発する光源装置を用いて膀胱内壁を照射し、膀胱鏡によりPPⅨの赤色蛍光の有無を観察する。
（2）PPⅨの赤色蛍光は、青色励起光の照射により退色が生じ、偽陰性となる場合があるため、以下の点に留意して、本剤を用いたTURBT施行時の観察を行うこと。
・青色光源下による観察は白色光源下による観察と併用し、可能な限り短時間とすること。
・白色光源にも、赤色蛍光の退色の原因となるPPⅨの励起波長が含まれている可能性があるため、本剤使用時には、必要以上の時間の曝露は避けること。

【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）
（1）心血管系疾患のある患者〔収縮期及び拡張期血圧、肺動脈圧並びに肺血管抵抗が低下するおそれがある。〕
（2）肝機能又は腎機能障害のある患者〔使用経験がない。〕

2．重要な基本的注意
（1）本剤投与後少なくとも48時間は、強い光（手術室の照明、直射日光又は明るい集中的な屋内光等）への眼及び皮膚の曝露を避け、照度500ルクス以下注1の室内で過ごさせること。
注1：日本工業規格の照度基準（JIS Z 9110）では、病院の照度について、病室100～200ルクス、一般検査室・食堂200～500ルクス、診察室・薬局300～750ルクスと規定している。
（2）肝機能障害があらわれることがあるので、定期的に肝機能検査を行うなど、患者の状態を十分に観察すること。

3．相互作用
（1）併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
光線過敏症を起こすことが知られている薬剤： テトラサイクリン系抗生物質 スルフォンアミド系製剤 ニューキノロン系抗菌剤 ヒペリシン（セイヨウオトギリソウ抽出物）等	光線過敏症を起こすおそれがある。 本剤投与後２週間は左記薬剤の投与又は食品の摂取は避けること。	本剤は体内で光感受性物質に代謝されるので、左記薬剤との併用又は食品の摂取により光線過敏症が増強されることが考えられる。
セイヨウオトギリソウ（St.John's Wort、セント・ジョーンズ・ワート）含有食品		

（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
バルビツール酸系全身麻酔剤 チオペンタール	ポルフィリン合成が促進され、肝障害があらわれるおそれがある。	アミノレブリン酸（5-ALA）合成酵素を誘導し、ヘム生合成を増強する。

4．副作用

膀胱癌患者を対象とした国内臨床試験において、安全性を評価した総症例123例中、副作用（臨床検査値異常を含む）発現例数は46例（37.4％）であり、AST（GOT）増加21例（17.1％）、ALT（GPT）増加17例（13.8％）、LDH増加12例（9.8％）、血中ビリルビン増加12例（9.8％）、γ-GTP増加10例（8.1％）、悪心９例（7.3％）、嘔吐8例（6.5％）等であった。（承認時）

（1）重大な副作用[注2]

1）**肝機能障害**：AST（GOT）（17.1％）、ALT（GPT）（13.8％）、LDH（9.8％）、血中ビリルビン（9.8％）、γ-GTP（8.1％）、Al-P（1.6％）の増加等を伴う肝機能障害があらわれることがあるので、定期的に肝機能検査を行うなど、十分に観察を行い、異常が認められた場合には、適切な処置を行うこと。〔「重要な基本的注意」の項参照〕

2）**低血圧（0.8％）**：低血圧があらわれることがあるので、十分に観察を行い、異常が認められた場合には、適切な処置を行うこと。手術後も、低血圧が遷延し、昇圧剤の持続投与が必要な症例が報告されている。

（2）その他の副作用[注2]

次のような症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、適切な処置を行うこと。

分類＼頻度	5％以上	0.1～5％未満	頻度不明
一般・全身			悪寒、発熱
血液			貧血
精神・神経		頭痛	脳浮腫、感覚鈍麻、片麻痺、失語症、痙攣、半盲
心・血管		心室性不整脈	血栓塞栓症、深部静脈血栓症
呼吸器			呼吸不全
胃腸	悪心、嘔吐	腹痛	下痢
皮膚・皮下組織		蕁麻疹	光線過敏性反応、光線性皮膚症、紅斑
筋骨格・結合組織障害		頚部痛	
腎・尿路障害			血尿
臨床検査		アミラーゼ増加、好酸球数増加	白血球数増加、リンパ球数減少、血小板数減少

注2：膀胱癌を対象とした国内臨床試験から頻度を算出した。悪性神経膠腫への使用でのみ認められている副作用については頻度不明とした。

5．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投与しないこと。〔妊娠ラットに投与した場合、胎児の発育遅延が、また、マウス、ラットの妊娠子宮及び胎児に直接光照射した場合、胎児毒性が生じるとの報告がある。〕

（2）本剤投与後24時間は、授乳を避けさせること。〔乳汁移行について動物試験を実施していない。〕

6．小児等への投与

小児等における安全性は確立していない。〔使用経験がない。〕

7．過量投与

症例：外国の臨床試験において、１例で過量投与（38mg/kg）により、術中に呼吸不全が生じた。

処置：人工呼吸器による処置後、回復した。

8．適用上の注意

（1）調製方法

本剤１包に水50mLを加えて溶解後、24時間以内に使用する。24時間を過ぎた溶解液は廃棄する。

（2）診断

本剤による診断の原理は、本剤投与後に体内で代謝されて生成したPPⅨが腫瘍組織に集積し、青色光線（400～410nm）により励起されPPⅨが赤色蛍光を発することを利用して、腫瘍組織を可視化することにある。

9．その他の注意

（1）動物試験（ラット、イヌ）で代謝物（PPⅨ）による肝臓障害が報告されている。

（2）動物細胞に５-ALAを曝露後、光照射すると遺伝毒性を示すことが報告されている。

（3）マウスへの静脈内投与後に紫外線照射すると光毒性（死亡、炎症性皮膚反応）を生ずることが報告されている。

【薬物動態】

1．血漿中濃度[1)]

日本人患者６例にアミノレブリン酸塩酸塩20mg/kgを経口投与したときの血漿中未変化体濃度は、投与後0.83時間に最高濃度34.0mg/Lを示し、消失半減期は2.27時間であった。薬物動態パラメータを表１に示した。

表1 アミノレブリン酸塩酸塩20mg/kgを経口投与したときの未変化体の薬物動態パラメータ

C_{max} (mg/L)	AUC_{∞} (mg･h/L)	t_{max} (h)	$t_{1/2}$ (h)
34.0±12.7	77.1±40.7	0.83±0.26	2.27±2.35

（n＝６、平均値±標準偏差）

2．血漿蛋白結合率[2)]

限外ろ過法により測定した５-ALAのヒト血漿蛋白結合率は、500～5,000μg/Lの濃度で12％であった。

3．代謝[1)]

アミノレブリン酸塩酸塩は投与後、体内でPPⅨに代謝される。血漿中PPⅨ濃度は投与後6.17時間に最高濃度351μg/Lを示し、消失半減期は4.91時間であった。

4．排泄[3)]

外国健康成人において、アミノレブリン酸塩酸塩投与後12時間までに投与量の30.6％が尿中に排泄された。

【臨床成績】

国内における第Ⅲ相試験（非盲検試験）[4)]

筋層非浸潤性膀胱癌患者及びその疑いのある症例を対象として、膀胱鏡挿入３時間前（範囲：２～４時間前）にアミノレブリン酸塩酸塩20mg/kgを経口投与した。その後のTURBT施行時における青色光源下での赤色蛍光の有無による腫瘍の可視化に関する有効性を、白色光源下での腫瘍の有無による観察結果と比較した。

本剤を投与した61症例のうち、評価可能な60症例の511検体に対して、主要評価項目である感度〔病理診断で腫瘍ありとされた生検組織検体のうち、各光源下における観察で腫瘍ありとされた生検組織検体の割合〕を比較した結果、青色光源下での感度は79.6％（144/181）であり、白色光源下の感度54.1％（98/181）と比べて有意に高かった（McNemar検定の結果、$p<0.001$）。

副次評価項目である特異度〔病理判断で腫瘍なしと判断された生検組織検体のうち、各光源下における観察で腫瘍なしとされた生検組織検体の割合〕は、青色光源下では80.6％（266/330）、白色光源下では95.5％（315/330）であった。

【薬効薬理】

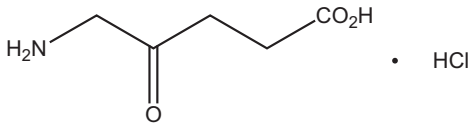
In vitroにおける悪性腫瘍細胞及び正常細胞を用いた5-ALA添加時のPPⅨ生成量は、正常細胞に比べて悪性腫瘍細胞では顕著に増加し、高い蓄積が認められている[5)]。

膀胱への分布に関しては、5-ALAを経口又は静脈投与した正常ラットにおいて5-ALAとPPⅨの膀胱への分布が確認されており[6)]、担癌マウスでは、正常な膀胱よりも腫瘍組織においてPPⅨが多く蓄積することが示されている[7)]。

この作用機序として、腫瘍細胞では正常細胞に比べてPPⅨ生成までの酵素活性が高いこと及びPPⅨからヘムを触媒する酵素活性が低いことから、腫瘍細胞では正常細胞に比べてより多くのPPⅨが蓄積すると考えられている[8、9)]。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アミノレブリン酸塩酸塩
　　Aminolevulinic Acid Hydrochloride（JAN）
化学名：5-Amino-4-oxopentanoic acid hydrochloride
分子式：$C_5H_9NO_3 \cdot HCl$
分子量：167.59
構造式：



性　状：白色の結晶、水に極めて溶けやすく、エタノール（99.5）に溶けにくい。
融　点：約153℃（分解）

＊【承認条件】

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

【包装】

アラグリオ顆粒剤分包1.5g：１包

【主要文献】

1）社内資料：第Ⅲ相試験（NPC-07-1）
2）社内資料：ヒト血漿蛋白結合率試験
3）社内資料：バイオアベイラビリティ試験
4）社内資料：第Ⅲ相試験（SPP2C101）
5）Iinuma S, et al. : Br J Cancer. 1994; 70: 21-28
6）van den Boogert J, et al. : J Photochem Photobiol B. 1998; 44: 29-38
7）Sroka R, et al. :J Photochem Photobiol B. 1996; 34: 13-19
8）Navone NM, et al. : Int J Biochem. 1990; 22: 1407-1411
9）Kondo M, et al. : Cell Biol Toxicol. 1993; 9: 95-105

＊＊【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ください。

日本化薬株式会社　医薬品情報センター
〒100-0005　東京都千代田区丸の内二丁目1番1号
TEL：0120-505-282

® 登録商標

＊＊販売
日本化薬株式会社
東京都千代田区丸の内二丁目１番１号

製造販売元
SBI Pharma
SBIファーマ株式会社
東京都港区六本木一丁目６番１号