

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2008 に準拠して作成

脳代謝促進剤

ガンマロン[®]錠250mg

(ガンマーアミノ酪酸錠)

GAMMALON[®] Tablets 250mg

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	なし
規格・含量	1錠中 ガンマーアミノ酪酸 250mg 含有
一般名	和名：ガンマーアミノ酪酸（JAN） 洋名： γ -Aminobutyric Acid（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2009年6月26日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2009年9月25日（販売名変更による） 発売年月日：2009年9月（販売名変更による）
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：アルフレッサ ファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部 TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212 医療関係者向けホームページ https://www.alfresa-pharma.co.jp/auth/confirm/

本 IF は 2019 年 3 月作成（第 1 版）の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

IF利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会において新たなIF記載要領が策定された。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

【IFの様式】

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

【IFの作成】

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF記載要領2008」は、平成21年4月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2008年9月)

目 次

I. 概要に関する項目	1	9. 製剤中の有効成分の確認試験法	5
1. 開発の経緯	1	10. 製剤中の有効成分の定量法	5
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	11. 力 価	5
II. 名称に関する項目	2	12. 混入する可能性のある夾雑物	5
1. 販売名	2	13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	5
(1) 和 名	2	14. その他	5
(2) 洋 名	2	V. 治療に関する項目	6
(3) 名称の由来	2	1. 効能又は効果	6
2. 一般名	2	2. 用法及び用量	6
(1) 和 名 (命名法)	2	3. 臨床成績	6
(2) 洋 名 (命名法)	2	(1) 臨床データパッケージ	6
(3) システム	2	(2) 臨床効果	6
3. 構造式又は示性式	2	(3) 臨床薬理試験：忍容性試験	6
4. 分子式及び分子量	2	(4) 探索的試験：用量反応探索試験	6
5. 化学名 (命名法)	2	(5) 検証的試験	6
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1) 無作為化並行用量反応試験	6
7. CAS登録番号	2	2) 比較試験	6
III. 有効成分に関する項目	3	3) 安全性試験	6
1. 物理化学的性質	3	4) 患者・病態別試験	6
(1) 外観・性状	3	(6) 治療的使用	6
(2) 溶解性	3	1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・	6
(3) 吸湿性	3	製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)	6
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	3	2) 承認条件として実施予定の内容	6
(5) 酸塩基解離定数	3	又は実施した試験の概要	6
(6) 分配係数	3	VI. 薬効薬理に関する項目	7
(7) その他の主な示性値	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	7
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	2. 薬理作用	7
3. 有効成分の確認試験法	3	(1) 作用部位・作用機序	7
4. 有効成分の定量法	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	7
IV. 製剤に関する項目	4	(3) 作用発現時間・持続時間	7
1. 剤 形	4	VII. 薬物動態に関する項目	8
(1) 剤形の区別、規格及び性状	4	1. 血中濃度の推移・測定法	8
(2) 製剤の物性	4	(1) 治療上有効な血中濃度	8
(3) 識別コード	4	(2) 最高血中濃度到達時間	8
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	8
無菌の旨及び安定なpH域等	4	(4) 中毒域	8
2. 製剤の組成	4	(5) 食事・併用薬の影響	8
(1) 有効成分(活性成分)の含量	4	(6) 母集団(ポピュレーション)解析により	8
(2) 添加物	4	判明した薬物体内動態変動要因	8
(3) その他	4	2. 薬物速度論的パラメータ	8
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	(1) コンパートメントモデル	8
4. 製剤の各種条件下における安定性	4	(2) 吸収速度定数	9
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	(3) バイオアベイラビリティ	9
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	(4) 消失速度定数	9
7. 溶出性	5	(5) クリアランス	9
8. 生物学的試験法	5	(6) 分布容積	9

(7) 血漿蛋白結合率	9	13. 過量投与	13
3. 吸 収	9	14. 適用上の注意	13
4. 分 布	9	15. その他の注意	13
(1) 血液－脳関門通過性	9	16. その他	13
(2) 血液－胎盤関門通過性	9		
(3) 乳汁への移行性	9	IX. 非臨床試験に関する項目	14
(4) 髄液への移行性	9	1. 薬理試験	14
(5) その他の組織への移行性	9	(1) 薬効薬理試験	14
5. 代 謝	10	(2) 副次的薬理試験	14
(1) 代謝部位及び代謝経路	10	(3) 安全性薬理試験	14
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等） の分子種	10	(4) その他の薬理試験	14
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	10	2. 毒性試験	14
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	10	(1) 単回投与毒性試験	14
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	10	(2) 反復投与毒性試験	14
6. 排 泄	10	(3) 生殖発生毒性試験	14
(1) 排泄部位及び経路	10	(4) その他の特殊毒性	14
(2) 排泄率	10		
(3) 排泄速度	10	X. 管理的事項に関する項目	15
7. 透析等による除去率	10	1. 規制区分	15
		2. 有効期間又は使用期限	15
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	11	3. 貯法・保存条件	15
1. 警告内容とその理由	11	4. 薬剤取扱い上の注意点	15
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	11	5. 承認条件等	15
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意 とその理由	11	6. 包 装	15
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 とその理由	11	7. 容器の材質	15
5. 慎重投与内容とその理由	11	8. 同一成分・同効薬	15
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	11	9. 国際誕生年月日	15
7. 相互作用	11	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	15
(1) 併用禁忌とその理由	11	11. 薬価基準収載年月日	16
(2) 併用注意とその理由	11	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の 年月日及びその内容	16
8. 副作用	11	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	16
(1) 副作用の概要	11	14. 再審査期間	16
(2) 重大な副作用と初期症状	11	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	16
(3) その他の副作用	12	16. 各種コード	16
(4) 項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	12	17. 保険給付上の注意	16
(5) 基礎疾患、合併症、重症度 及び手術の有無等背景別の 副作用発現頻度	12		
(6) 薬物アレルギーに対する注意 及び試験法	12	XI. 文 献	17
9. 高齢者への投与	12	1. 引用文献	17
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	12	2. その他の参考文献	17
11. 小児等への投与	12		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	12	XII. 参考資料	18
		1. 主な外国での発売状況	18
		2. 海外における臨床支援情報	18
		XIII. 備 考	19
		その他の関連資料	19

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ガンマーアミノ酪酸は 1950 年 Awapara¹⁾らにより動物の脳髄中に存在することが認められ、それ以来、生理学的あるいは生化学的研究によりその作用が明確にされてきた。

本剤は、ガンマーアミノ酪酸（略名 GABA）を成分として開発されたフィルムコーティング錠である。

なお、医療事故防止対策として「ガンマロン錠」から「ガンマロン錠 250mg」に販売名の変更を申請し、2009 年 6 月に承認された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1)有効性

頭部外傷後遺症に伴う諸症状（頭痛、頭重、易疲労性、のぼせ感、耳鳴、記憶障害、睡眠障害、意欲低下）に対して改善効果を示す。（「V.治療に関する項目」参照）

(2)安全性

1) 総症例 714 例中報告された副作用は 3.2%（23 例）で、主な副作用は食欲不振 0.4%（3 件）、下痢 0.3%（2 件）であった。〔文献集計による（再審査対象外）〕

2) 副作用としてはその他に、悪心、便秘等が認められており、また、感情失禁の改善を妨げることがある。（「VIII.安全性（使用上の注意等）に関する項目」参照）

(3)製 剤

ガンマーアミノ酪酸を 1 錠中に 250mg 含有するフィルムコーティング錠である。（「IV.製剤に関する項目」参照）

(4)治 療

ガンマーアミノ酪酸として、通常成人 1 日 3g（12 錠）を 3 回に分割経口投与する。（「V.治療に関する項目」参照）

(5)薬理学

ガンマーアミノ酪酸は、TCA サイクルの導入部に必要なヘキソキナーゼ活性を高め糖質代謝を促進する。また、実験的脳損傷（イヌ）にガンマーアミノ酪酸 50mg/kg を静注した場合、脳血流量、脳酸素供給量などの増加が認められている。（「VI.薬効薬理に関する項目」参照）

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1)和名

ガンマロン[®]錠 250mg

(2)洋名

GAMMALON[®] Tablets 250mg

(3)名称の由来

本剤の成分である γ -Aminobutyric Acid (ガンマーアミノ酪酸) のギリシア語「 γ 」(gamma、ガンマ) に由来し、その製剤として、ガンマロン (GAMMALON) と命名された。

2. 一般名

(1)和名(命名法)

ガンマーアミノ酪酸 (JAN)

(2)洋名(命名法)

γ -Aminobutyric Acid (JAN)

(3)ステム

不明

3. 構造式又は示性式

$\text{H}_2\text{NCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COOH}$

4. 分子式及び分子量

分子式 : $\text{C}_4\text{H}_9\text{NO}_2$

分子量 : 103.12

5. 化学名(命名法)

4-aminobutanoic acid (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

GABA

7. CAS 登録番号

56-12-2

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末で、わずかに特異なおいがあり、味はわずかに苦い。

(2) 溶解性

水又は氷酢酸に溶けやすく、メタノールに溶けにくく、エーテル又はクロロホルムにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

吸湿性あり（潮解性を示す）、その臨界湿度は約 70%RH（25℃）である。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 200℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

水溶液（1→10）の pH は 7.0～8.0 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

局外規「ガンマーアミノ酪酸」による




4. 有効成分の定量法

局外規「ガンマーアミノ酪酸」による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	有効成分	剤形	色	外形			識別コード
				直径 (mm)	厚さ (mm)	重さ (mg)	
ガンマロン錠 250mg	ガンマーアミノ酪酸 250mg	フィルム コーティング錠	白色～ 淡黄白色				601
				10.2	5.9	366	

(2) 製剤の物性

溶出性：「IV.7.溶出性」参照

(3) 識別コード

上記「IV.1.(1)剤形の区別、規格及び性状」参照

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

上記「IV.1.(1)剤形の区別、規格及び性状」参照

(2) 添加物

トウモロコシデンプン、軽質無水ケイ酸、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 6000、タルク、ジメチルポリシロキサン、二酸化ケイ素、カルナウバロウ

(3) その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

最終包装（PTP・アルミピロー・函）

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	3年	最終包装	ほとんど変化は認められず、安定である。
加速試験	40°C/75%RH	3ヵ月	最終包装	
		3ヵ月	PTP包装	
		14日	シャーレ開放	
苛酷試験	室内散光 (蛍光灯 500lx、室温)	3ヵ月	PTP包装	

(試験項目：外観、溶出試験、含量)

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

ある種のアミノ酸と糖類とは化学反応（マイヤー反応又はアミノカルボニル反応）をおこし、褐色の経時変化をおこすことが知られている。ガンマロンの主成分であるガンマーアミノ酪酸と糖類が同様の反応をおこし褐色に変化する。

7. 溶出性

局外規「ガンマーアミノ酪酸」による

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

(1) ニンヒドリン試液による呈色反応

(2) 日局一般試験法「薄層クロマトグラフィー」による

10. 製剤中の有効成分の定量法

滴定終点検出法（電位差滴定法）

11. 力 価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

下記疾患に伴う諸症状（頭痛、頭重、易疲労性、のぼせ感、耳鳴、記憶障害、睡眠障害、意欲低下）
頭部外傷後遺症

2. 用法及び用量

ガンマーアミノ酪酸として、通常成人 1 日 3g（12 錠）を 3 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。

3. 臨床成績

(1)臨床データパッケージ（2009 年 4 月以降承認品目）

該当しない

(2)臨床効果

対照薬との二重盲検比較試験で頭部打撲・脳挫傷等、頭部外傷後遺症の諸症状の改善に有用性が認められている。

(3)臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4)探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5)検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

本剤 3g/日（35 例）は塩酸ピリチオキシン 300mg/日（30 例）との二重盲検比較試験で頭部打撲・脳挫傷等、頭部外傷後遺症の諸症状の改善に有用性が認められている²⁾。

2) 武田文和ほか：薬理と治療 1979;7(1):249-265

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6)治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

アデノシン三リン酸二ナトリウム水和物、ジヒドロエルゴトキシンメシル酸塩等

2. 薬理作用

(1)作用部位・作用機序

脳では主として、血液からのグルコースをエネルギー源として機能が営まれている。ガンマーアミノ酪酸は、TCA サイクルの導入部に必要なヘキソキナーゼ活性を高め糖質代謝を促進する³⁾。

(2)薬効を裏付ける試験成績

脳代謝促進作用⁴⁾

実験的脳損傷（イヌ）にガンマーアミノ酪酸 50mg/kg を静注した場合、脳血流量、脳酸素供給量などの増加が認められている。

(3)作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1)治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2)最高血中濃度到達時間

該当資料なし

<参考：イヌ>

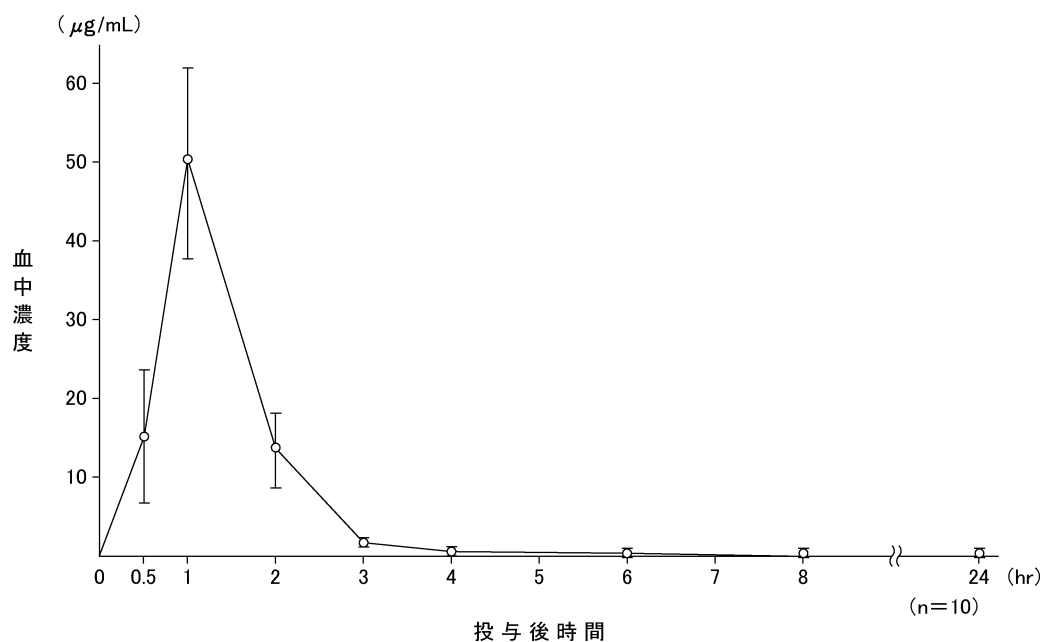
1時間（ビーグル犬）

(3)臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

<参考：イヌ>

ビーグル犬にガンマーアミノ酪酸 1g を経口投与した場合、胃腸管から速やかに吸収され、投与後 1 時間で最高血中濃度（約 50 $\mu\text{g}/\text{mL}$ ）を示し、その後急速に減少し、投与後 24 時間には消失した。



ガンマーアミノ酪酸（1g/dog）投与後の血中濃度推移

(4)中毒域

該当資料なし

(5)食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6)母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1)コンパートメントモデル

該当資料なし

(2)吸収速度定数

該当資料なし

(3)バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4)消失速度定数

該当資料なし

(5)クリアランス

該当資料なし

(6)分布容積

該当資料なし

(7)血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸 収

該当資料なし

<参考：イヌ>

「VII.1.(3)臨床試験で確認された血中濃度」参照

4. 分 布

(1)血液－脳関門通過性

該当資料なし

<参考：モルモット、ネコ、ラット>

モルモットを用いた実験では、正常状態では血液－脳関門の通過は困難であるが⁵⁾、ネコの凍結による損傷脳では血中から迅速に脳中へ移行する⁶⁾。

ラットを用いた実験で、*Saccharomyces cerevisise* PUT4 permease と類似した酵素を介してガンマーアミノ酪酸 (GABA) が血液－脳関門を通過するとの報告がある⁷⁾。

(2)血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3)乳汁への移行性

該当資料なし

(4)髄液への移行性

該当資料なし

(5)その他の組織への移行性

該当資料なし

<参考：モルモット>

モルモットに標識 GABA (ガンマーアミノ酪酸) を用い、1.5g/kg 経口投与の 15 時間後には、肝、腎、尿中に GABA が確認されたが、脳、血中には全く認められなかった⁵⁾。

5. 代 謝

(1)代謝部位及び代謝経路

ガンマーアミノ酪酸は生体内で主としてアミノ酸転移反応によって、コハク酸セミアルデヒドとなり、次いでコハク酸となり、Krebs 回路に入る。ガンマーアミノ酪酸トランスアミナーゼはアミノ酸転移反応を触媒する⁸⁾。

(2)代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

(3)初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4)代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5)活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排 泄

(1)排泄部位及び経路

腎臓（尿中排泄）

(2)排泄率

該当資料なし

<参考：モルモット、ウサギ>

モルモットに標識ガンマーアミノ酪酸を 1.5g/kg 経口投与した際の尿中排泄量は、1.5 時間までに 1%以下であった。また呼気中に著明な放射性炭酸ガスが見出された⁵⁾。

ウサギにガンマーアミノ酪酸 200mg/kg 及び 213.6mg/kg を静注したところ、投与後 2 時間までに約 40%が未変化体のまま尿中に排泄された⁹⁾。

(3)排泄速度

該当資料なし

<参考：モルモット、ウサギ>

「VII.6.(2)排泄率」参照

7. 透析等による除去率

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

該当しない

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

7. 相互作用

(1)併用禁忌とその理由

該当しない

(2)併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1)副作用の概要

1. 副作用

総症例 714 例中報告された副作用は 3.2%（23 例）で、主な副作用は食欲不振 0.4%（3 件）、下痢 0.3%（2 件）であった。 [文献集計による（再審査対象外）]

(2)重大な副作用と初期症状

該当しない

(3)その他の副作用

1. 副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 消化器：悪心（1%未満）、食欲不振（1%未満）、下痢（1%未満）、便秘（頻度不明^注）等があらわれることがある。

(2) その他：感情失禁の改善を妨げることがある（頻度不明^注）。

注）自発報告又は海外において認められている副作用のため頻度不明。

解説：(1) GABA（ガンマーアミノ酪酸）は、腸管の Auerbach 神経叢に作用し、コリン性神経伝達を促進し、又は抑制し、腸管運動又は胃液分泌を調節していると考えられている。従って、消化器系の上記副作用が現れることがあるので、異常が認められた場合は、必要に応じて投与を中止するなどの適切な処置を行うこと。

(2) GABA（ガンマーアミノ酪酸）は、哺乳動物の脳に高濃度に存在し、抑制伝達物質として中枢神経機能（精神、感情、運動など）に影響を及ぼしていると考えられている。従って、上記副作用が現れることがあるので、異常が認められた場合は、必要に応じて投与を中止するなどの適切な処置を行うこと。

(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5)基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当資料なし

9. 高齢者への投与

該当資料なし

10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与

2. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。〕

解説：妊娠中の投与に関するデータがなく、安全性が確立されていないので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。しかし、治療上の有益性が危険性を上回ると判断された場合には、慎重に投与し、異常が認められた場合には投与を中止し適切な処置を行うこと。

11.小児等への投与

該当資料なし

12.臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13.過量投与

該当資料なし

14.適用上の注意

3. 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。）

15.その他の注意

該当しない

16.その他

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1)薬効薬理試験（「VI.薬効薬理に関する項目」参照）

(2)副次的薬理試験

該当資料なし

(3)安全性薬理試験

1) ラットの膀胱に対する作用¹⁰⁾

ガンマーアミノ酪酸を静脈内投与すると、（排尿反射を目的として）生理食塩液を負荷した膀胱の自発的収縮作用を抑制する。これは、骨盤神経節に対するガンマーアミノ酪酸の作用に基づくものと考えられる。

また、ガンマーアミノ酪酸は *in vitro* で、排尿筋片の収縮を刺激する。

2) ラットのノルアドレナリン誘発徐脈に対する作用¹¹⁾

ガンマーアミノ酪酸の静脈内投与で、ノルアドレナリン誘発反射による迷走神経徐脈が有意に減少した。

徐脈の軽減は、ガンマーアミノ酪酸（静注）により、迷走神経節前線維が刺激を受けることによる。

(4)その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1)単回投与毒性試験

静注時の LD₅₀ 値はマウスで 5g/kg である。

(2)反復投与毒性試験

ウサギに 12～15 日間連続静注し、諸臓器を調べると、50 及び 250mg/kg の用量で脳室壁グリア細胞の集ぞくと腎に軽度の変化がみられる以外に異常は認められなかった。

(3)生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4)その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：該当しない

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存、吸湿注意 「X.4.薬剤取扱い上の注意点」参照

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1)薬局での取扱いについて

【取扱い上の注意】

本剤は品質保証上、アルミラップ包装にしているため、ラップ開封後の保管及び投薬調剤の場合は、吸湿に注意すること。

(2)薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ.14.適用上の注意」参照

くすりのしおり：有り

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

ガンマロン錠 250mg （PTP）100錠

7. 容器の材質

PTP：塩化ビニル、金属

8. 同一成分・同効薬

同一成分：なし

同 効 薬：アデノシン三リン酸二ナトリウム水和物、ジヒドロエルゴトキシンメシル酸塩 等

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2009年6月26日（販売名変更による）

承 認 番 号：22100AMX01288

注：旧販売名：ガンマロン錠 承認年月日：1959年9月22日

11.薬価基準収載年月日

2009年9月25日（販売名変更による）

12.効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

効能又は効果追加承認年月日：1961年11月22日

内容：「頭部外傷後遺症の緩解」の効能・効果を追加

13.再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：

1980年8月14日 効能・効果：「本態性高血圧症、腎性高血圧症及びこれに伴う自覚症状（頭痛、肩こり、めまい）」を削除

1996年3月7日 効能・効果：「脳動脈硬化症」を削除

1999年6月29日 効能・効果：「脳卒中後遺症」を削除

14.再審査期間

該当しない

15.投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16.各種コード

販売名	HOT（9桁）番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
ガンマロン錠 250mg	103512403（PTP 100錠）	2190004F1034	620351201

17.保険給付上の注意

該当しない

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) Awapara J, et al. : J Biol Chem 1950;187(1):35-39
- 2) 武田文和ほか：薬理と治療 1979;7(1):249-265
- 3) Mori A : J Biochem 1958;45(12):985-990
- 4) 柴田孝行：脳と神経 1967;19(3):231-240
- 5) 塚田裕三ほか：神経研究の進歩 1960;4(3):487-496
- 6) Strasberg P, et al. : J Neurochem 1967;14(7):755-760
- 7) García SC, et al. : Gen Pharmacol 1998;31(4):579-582
- 8) 田中千賀子、加藤隆一編：NEW 薬理学 改訂第6版 2011:80-96, 南江堂
- 9) 皆見 新：ビタミン 1960;19(2):233-238
- 10) Maggi CA, et al. : Gen Pharmacol 1983;14(4):455-458
- 11) Maggi CA, et al. : Gen Pharmacol 1985;16(6):579-584

2. その他の参考文献

- 第十七改正日本薬局方解説書 2016, 廣川書店
日本薬局方外医薬品規格 2002, 財団法人日本公定書協会

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

販売名	国名
Gammar	ブラジル
An Luo	中国
Gammalon	香港
Aminalon	ロシア
Bainto	タイ
Aminalon	ウクライナ

(Martindale 38th ed., 2014)

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報 (FDA 分類)

該当しない

小児等に関する記載

該当しない

XIII. 備 考

その他の関連資料