

貯法：室温保存
有効期間：5年

アズレンスルホン酸ナトリウム水和物顆粒

アズレン顆粒1%「ツルハラ」

Azulene Granules 1% [TSURUHARA]

承認番号	22500AMX01342000
販売開始	1995年7月

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分	1g 中 アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 10mg
添加剤	乳糖水和物、炭酸水素ナトリウム、ポビドン、 <i>l</i> -メントール、含水二酸化ケイ素

3.2 製剤の性状

剤形	顆粒
色調	淡青色
におい	わずかにそう快な芳香
味	清涼

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
胃炎、胃潰瘍

6. 用法及び用量

アズレンスルホン酸ナトリウム水和物として、通常成人1回2mg（アズレン顆粒1%「ツルハラ」として0.2g）を1日3回食前に経口投与する。この際、1回量を約100mLの水又は微温湯に溶解して経口投与することが望ましい。
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

9.6 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。

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

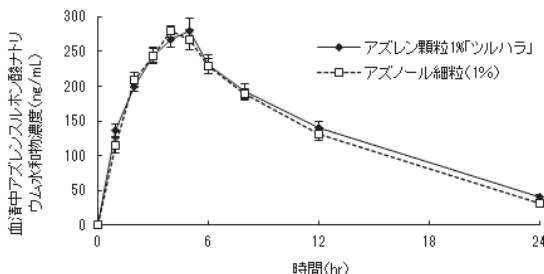
	0.1～5%未満
消化器	下痢、便秘、膨満感、腹痛、悪心・嘔吐等

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

アズレン顆粒1%「ツルハラ」とアズノール細粒（1%）を、クロスオーバー法によりそれぞれ0.5g（アズレンスルホン酸ナトリウム水和物5mg）を健康成人男子に絶食時単回経口投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.8）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
アズレン顆粒1%「ツルハラ」	3406.3 ± 175.2	294.0 ± 16.1	4.3 ± 0.2	8.7 ± 0.8
アズノール細粒(1%)	3266.7 ± 104.7	292.3 ± 11.6	4.2 ± 0.2	9.1 ± 1.4

(mean ± S.E., n=12)

血中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

胃炎148例を対象とした二重盲検比較試験で、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物の有用性が確認されている²⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

アズレンスルホン酸ナトリウム水和物の抗炎症作用は、白血球遊走阻止作用及び肥満細胞からのヒスタミン遊離抑制作用等によるものである。下垂体-副腎系を介さず、また、PGE₂生成阻害作用を示さない。このことから、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物は炎症組織に対する直接的な局所作用を発揮すると考えられている³⁾、⁴⁾。

18.2 消炎作用及び創傷治癒促進作用

各種起炎物質による浮腫（ラット³⁾、⁵⁾）、カラゲニン胸膜炎（ラット³⁾）等の実験的炎症を抑制し、更に実験的口内炎で創傷治癒促進作用を認めている（ハムスター⁶⁾）。

18.3 ヒスタミン遊離抑制・白血球遊走阻止作用

ラット肥満細胞あるいは組織からのヒスタミン遊離を抑制し、また白血球遊走阻止作用（*in vitro*）を認めている³⁾、⁴⁾。

18.4 抗潰瘍作用

酢酸潰瘍、幽門結紮潰瘍、幽門結紮-アスピリン潰瘍、アスピリン胃損傷等の各種実験的胃傷害に対し、予防又は治療促進効果を示し（ラット⁷⁾）、*in vitro*で抗ペプシン作用も認められている⁸⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 (Sodium Gualenate Hydrate)

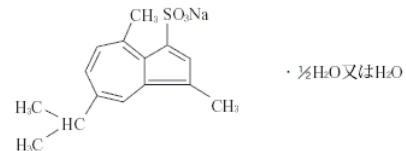
化学名：Sodium 1,4-dimethyl-7-isopropylazulene-3-sulfonate semihydrate
Sodium 1,4-dimethyl-7-isopropylazulene-3-sulfonate monohydrate

分子式：C₁₅H₁₇NaO₃S · 1/2H₂O又はC₁₅H₁₇NaO₃S · H₂O

分子量：309.36又は318.36

性状：本品は暗青色の結晶又は結晶性の粉末で、におい及び味はない。本品はメタノールにやや溶けやすく、水又は酢酸（100）にやや溶けにくく、エタノール（95）に溶けにくく、無水酢酸、ジエチルエーテル又はヘキサンにほとんど溶けない。

化学構造式：



20. 取扱い上の注意

開封後は湿気を避けて保存すること。

22. 包装

バラ【缶】：100g、1,000g（乾燥剤入り）

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験
- 小林節雄ほか：薬物療法. 1974;7 (7) :1035-43
- 柴田芳久ほか：薬理と治療. 1986;14 (3) :1303-11
- 山崎英正ほか：日薬理誌. 1958;54 (2) :362-77
- 宇田昭夫：日薬理誌. 1960;56 (5) :1151-63
- 吉田博次ほか：薬理と治療. 1986;14 (3) :1313-20
- 岡部 進ほか：応用薬理. 1975;9 (1) :31-7
- Thiemer K, et al. : Arzneimittel-Forsch. 1972;22 (6) :1086-7

24. 文献請求先及び問い合わせ先

鶴原製薬株式会社 医薬情報部
〒563-0036 大阪府池田市豊島北1丁目16番1号
TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

鶴原製薬株式会社

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号