

※※ アズレン顆粒1%「ツルハラ」

Azulene Granules「TSURUHARA」 (アズレンスルホン酸ナトリウム水和物顆粒)

承認番号	225AMX01342000
薬価収載	2013年12月
販売開始	1995年7月

貯法	湿気を避けて室温保存
使用期限	外箱、容器に表示

【組成・性状】

組成

アズレン顆粒1%「ツルハラ」は1g中アズレンスルホン酸ナトリウム水和物10mgおよび添加物として乳糖水和物、炭酸水素ナトリウム、ポビドン、*l*-メントール、含水二酸化ケイ素を含有する。

製剤の性状

アズレン顆粒1%「ツルハラ」は淡青色の顆粒で、わずかにそう快な芳香があり、味は清涼である。

【効能・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

【用法・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。

【使用上の注意】

副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

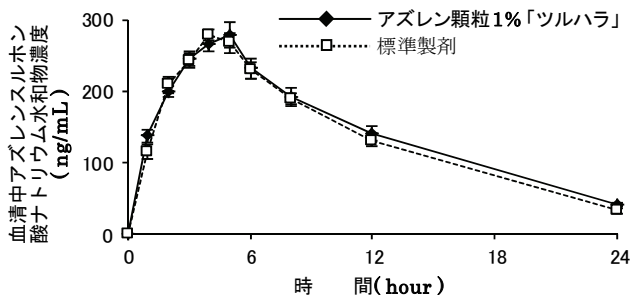
その他の副作用

	頻度不明
消化器	下痢、便秘、膨満感、腹痛、悪心・嘔吐等

※【薬物動態】

(1) 生物学的同等性試験¹⁾

アズレン顆粒1%「ツルハラ」と標準製剤を、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。



	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
標準製剤(細粒、1%)	3266.7±104.7	292.3±11.6	4.2±0.2	9.1±1.4

(mean±S.E., n=12)

血清中濃度並びに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。

(2) 溶出挙動²⁾

アズレン顆粒1%「ツルハラ」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアズレンスルホン酸ナトリウム水和物顆粒の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

ヒスタミン遊離抑制作用

炎症局所に直接作用して、ヒスタミンの遊離を阻害し、各種起炎物質による浮腫を抑制する^{3) 4)}。

創傷治癒促進作用

ウサギを用いた実験において口腔内火傷創傷やカラシ油による結膜炎の治癒日数を短縮する。また、ラットで各種実験的胃障害に対して予防又は治癒促進作用を有する。

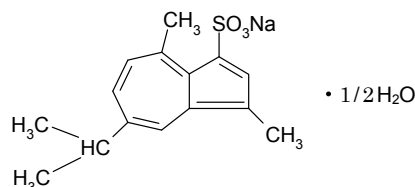
その他

in vitroで抗ペプシン作用が認められている⁵⁾。

また、弱いが解熱・鎮痛、局所麻酔、抗ヒスタミン作用を有する³⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式:



一般名: アズレンスルホン酸ナトリウム水和物

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

分子式: C₁₅H₁₇NaO₃S・1/2H₂O

分子量: 309.36

吸光度: E_{1cm}^{1%}(568nm): 19.85~20.65(乾燥後、0.02g、pH7.0のリン酸塩緩衝液、100mL)

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。

本品の水溶液(1→200)のpHは6.0~9.0である。

本品は光により変化する。

※【取扱い上の注意】

安定性試験⁶⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、5年)の結果、アズレン顆粒1%「ツルハラ」は通常の市場流通下において5年間安定であることが確認された。

※【包装】

100g、1000g

【主要文献】

- 1) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 3) 宇田昭夫: 日薬理誌, 56, 1151-1163(1960)
- 4) 山崎英正 他: 日薬理誌, 54, 362-377(1958)
- 5) Thiemer, K. et al: Arzneimittel-Forsch., 22, 1086-1087 (1972)
- 6) 鶴原製薬株式会社 社内資料

【文献請求先】

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



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