

医薬品インタビューフォーム
 日本病院薬剤師会の I F 記載要領（1998 年 9 月）に準拠して作成

非ステロイド性・抗炎症点眼剤

AZ点眼液[®] 0.02%

AZ Ophthalmic Solution

剤 形	点眼剤
規 格 ・ 含 量	AZ点眼液 0.02%は、1mL 中アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 0.2mg を含有する。
一 般 名	和名：アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 洋名：Sodium Azulenesulfonate Hydrate
製造・輸入承認年月日・ 薬価基準収載・ 発売年月日	製造・輸入承認年月日：2008年 9月 5日 薬価基準収載年月日：2008年12月19日 発売年月日：1970年 5月 1日
開発・製造・輸入・ 発売・販売会社名	製造販売元：ゼリア新薬工業株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX	

本 I F は 2008 年 12 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

整理番号

--	--	--	--	--	--	--	--

ご自由にご利用下さい。

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

当該医薬品について製薬企業の医薬品情報担当者（以下、MRと略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会（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）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けとIF記載要領が策定された。

2. IFとは

IFは「医療用医薬品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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な医薬品解説書として、日本病院薬剤師会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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報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。

3. IFの様式・作成・発行

規格A4判、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IFは日病薬が策定した「IF記載要領」に従って記載するが、本IF記載要領は、平成11年1月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合にはIFが改訂・発行される。

4. IFの利用にあたって

IFの策定原点を踏まえ、MRへのインタビュー、自己調査のデータを加えてIFの内容を充実させ、IFの利用性を高めておく必要がある。

MR等へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により、薬剤師等自らが加筆・整備する。そのための参考として、表紙下段にIF作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月日を記載している。なお、適正使用や安全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」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目 次

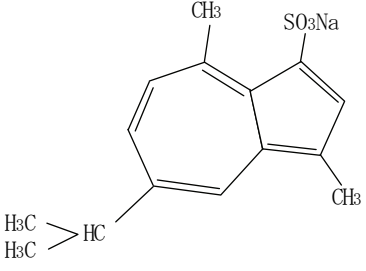
I. 概要に関する項目	1	1. 血中濃度の推移・測定方法	8
1. 開発の経緯	1	2. 薬物速度論的パラメータ	8
2. 製品の特徴及び有用性	1	3. 吸 収	8
II. 名称に関する項目	2	4. 分 布	8
1. 商品名	2	5. 代 謝	9
2. 一般名	2	6. 排 泄	9
3. 構造式又は示性式	2	7. 透析等による除去率	9
4. 分子式・分子量	2	VIII. 使用上の注意に関する項目	10
5. 化学名（命名法）	2	1. 警告内容とその理由	10
6. 慣用名、別名、略名、記号番号	2	2. 禁忌内容とその理由	10
7. CAS登録番号	2	3. 効能・効果に関連する使用上の注意と その理由	10
III. 有効成分に関する項目	3	4. 用法・用量に関連する使用上の注意と その理由	10
1. 有効成分の規制区分	3	5. 慎重投与内容とその理由	10
2. 物理化学的性質	3	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	10
3. 有効成分の各種条件下における安定性	3	7. 相互作用	10
4. 有効成分の確認試験法	3	8. 副作用	10
5. 有効成分の定量法	3	9. 高齢者への使用に関する注意	11
IV. 製剤に関する項目	4	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	11
1. 剤 形	4	11. 小児等への投与	11
2. 製剤の組成	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	11
3. 製剤の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与時	11
4. 他剤との配合変化	4	14. 適用上及び薬剤交付時の注意 （患者等に留意すべき必須事項等）	11
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	15. その他	11
6. 生物学的試験法（微生物試験等）	5	IX. 非臨床試験に関する項目	12
7. 製剤中の有効成分の確認試験法	5	1. 一般薬理	12
8. 製剤中の有効成分の定量法	5	2. 毒 性	12
9. 力 価	5	X. 取扱い上の注意、包装、承認等に関する項目	13
10. 容器の材質	5	1. 有効期間又は使用期限	13
11. 刺激性	5	2. 貯法・保存条件	13
V. 治療に関する項目	6	3. 薬剤取扱い上の注意点	13
1. 効能又は効果	6	4. 包 装（形態、規格）	13
2. 用法・用量	6	5. 同一成分・同効薬	13
3. 臨床成績	6	6. 国際誕生年月日	13
VI. 薬効薬理に関する項目	7	7. 製造・輸入承認年月日及び承認番号	13
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	7	8. 薬価基準収載年月日	13
2. 薬理作用	7	9. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等	
VII. 体内薬物動態に関する項目	8		

の年月日及びその内容	13
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	13
11. 再審査期間	14
12. 長期投与の可否	14
13. 厚生労働省薬価基準収載の医薬品コード	14
14. 保険給付上の注意	14
XI. 文 献	15
1. 引用文献	15
XII. 参考資料	16
主な外国での発売状況	16
XIII. 備 考	17
その他の関連資料	17
文献請求先	17

I. 概要に関する項目

- | | |
|---------------|--|
| 1. 開発の経緯 | 従来、眼科領域における炎症性疾患患者に対する抗炎症点眼剤としては、ステロイド剤が繁用され優れた効果を挙げてきたが、その反面しばしば副作用の発現をみることがあり、副作用の懸念の少ない安全性の高い薬剤が要望されてきた。本剤は、各種炎症性眼疾患に有用な非ステロイド性抗炎症点眼剤として開発されたものである。 |
| 2. 製品の特徴及び有用性 | 抗炎症、抗アレルギー作用を示しステロイド剤にみられる副作用の懸念が少ない。 |

II. 名称に関する項目

1. 商品名	
(1) 和名	AZ点眼液0.02%
(2) 洋名	AZ Ophthalmic Solution 0.02%
(3) 名称の由来	主成分の水溶性アズレン (Azulene) よりAZ点眼液0.02%とした。
2. 一般名	
(1) 和名	アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 (水溶性アズレン)
(2) 洋名	Sodium Azulene Sulfonate Hydrate
3. 構造式又は示性式	構造式  <p>• 1/2 H₂O又はH₂O</p>
4. 分子式・分子量	分子式 : C ₁₅ H ₁₇ NaO ₃ S • 1/2H ₂ O又はH ₂ O 分子量 : 309.36又は318.36
5. 化学名 (命名法)	Sodium 1,4-dimethyl-7-isopropylazulene-3-sulfonate Hydrate
6. 慣用名、別名、略名、 記号番号	慣用名 : なし 別名 : なし 略名 : なし 記号番号 : なし
7. CAS登録番号	6222-35-4

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 有効成分の規制区分	該当しない
2. 物理化学的性質	
(1) 外観・性状	暗青色の結晶又は結晶性の粉末で、におい及び味はない。 本品は光により変化する。
(2) 溶解性	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。
(3) 吸湿性	該当資料なし
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	融点は示さず、90℃以上で分解する。
(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→200)のpHは6.0～9.0である。 吸光度 $E_{1\text{cm}}^{1\%}$ (568nm)：19.85～20.65 (乾燥後、0.02g、pH7.0のリン酸塩緩衝液、100mL)
3. 有効成分の各種条件下における安定性	光に対して不安定。
4. 有効成分の確認試験法	紫外吸収スペクトル、可視部吸収スペクトル法による。
5. 有効成分の定量法	吸光度法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形	
(1) 投与経路	点眼剤
(2) 剤形の区別、規格及び性状	無臭、青紫色澄明の無菌水性点眼液
(3) 製剤の物性	pH : 7.0~8.5
(4) 識別コード	なし
(5) 無菌の有無	無菌
(6) 酸化、ヨウ素価等	該当しない
2. 製剤の組成	
(1) 有効成分(活性成分)の含量	1mL中にアズレンスルホン酸ナトリウム水和物(水溶性アズレン)を0.2mg含有。
(2) 添加物	ホウ酸、ホウ砂、塩化ナトリウム、塩化カリウム パラオキシ安息香酸メチル パラオキシ安息香酸プロピル
3. 製剤の各種条件下における安定性	長期保存試験 最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、3年2ヶ月間)の結果、AZ点眼液0.02%は通常の市場流通下において3年2ヶ月間安定であることが確認された。 加速試験 AZ点眼液0.02%をAZ点眼液0.02%容器(ポリエチレン製容器、淡白色半透明、内容量500ml)に充てんし脱酸素剤を入れアルミフィルムでピロー包装し、紙箱に入れ保存検体とする。 加速試験(40℃、75%RH、6ヶ月保存)における、性状、確認試験、不溶性異物試験及び無菌試験の試験結果は、試験規格に適合するものであり、また、pHにおいても著しい変化は認められない。アズレンスルホン酸ナトリウム含量は、加速試験において若干の低下が見られるものの著しい変化は認められない。
4. 他剤との配合変化	タチオン点眼用2%(白濁)、ミケラン点眼液(にごり)、サンテマイシン点眼液0.3%(白濁)、コリマイC点眼液(褐色)

IV. 製剤に関する項目

5. 混入する可能性のある 夾雑物	該当資料なし
6. 生物学的試験法 (微生物試験等)	無菌試験 日局一般試験法無菌試験法により試験を行う時これに適合する。
7. 製剤中の有効成分の確 認試験法	可視吸収スペクトル法による。
8. 製剤中の有効成分の定 量法	絶対吸収法による吸光度測定法。
9. 力 価	該当しない
10. 容器の材質	ポリエチレン
11. 刺激性	家兔眼粘膜刺激試験 Draize法および国立衛生試験所改良法による眼粘膜刺激試験の結果、AZ 点眼液0.02%及び0.02%水溶性アズレン溶液 (AZ点眼液0.02%と同濃度) の間には障害の現われ方に有意差なく、Draize法採点で1群3匹の合計点 が最高10点で、これから見ると点眼液として安全であると判定出来る。

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	急性結膜炎、慢性結膜炎、アレルギー性結膜炎、表層角膜炎、眼瞼縁炎、強膜炎
2. 用法・用量	1日 3～5回、1回 1～2滴を点眼する。 〈参考〉1滴あたりの容量は約40 μ L
3. 臨床成績	
(1) 臨床効果	結膜炎、角膜炎等の炎症性疾患に対する臨床試験成績は、有効率74.8% (326例中244例) であった ^{1)～9)} 。
(2) 臨床薬理試験：忍容性試験	該当資料なし
(3) 探索的試験：用量反応探索試験	該当資料なし
(4) 検証的試験	
1) 無作為化平行用量反応試験	該当資料なし
2) 比較試験	該当資料なし
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
(5) 治療的使用	
1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験	該当資料なし
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
(6) 治療的特徴	抗炎症、抗アレルギー作用を有するが、ステロイド剤にみられる副作用（感染症の誘発、緑内障、白内障）の誘発がない。 また、上皮形成、肉芽形成促進作用があるので、創傷治癒促進作用も期待される。

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	Guaiazulene
2. 薬理作用	
(1) 作用部位・作用機序	本剤の作用は、点眼部位で局所性に発揮する。
(2) 薬効を裏付ける試験成績	実験的アレルギー性結膜炎に対する作用 ^{10),11)} 1) 生卵白液結膜下注射により惹起した家兎のアレルギー性結膜炎に対し充血及び浮腫は消退し、明らかな消炎効果が確認された。 2) クロマツ花粉抽出液より惹起した家兎のアレルギー性結膜炎に対し、病理的・組織学的所見、浸潤細胞数測定法による検査で炎症抑制効果を示した。

Ⅶ. 体内薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定方法	
(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
(3) 通常用量での血中濃度	該当資料なし
(4) 中毒症状を発現する血中濃度	該当資料なし
2. 薬物速度論的パラメータ	
(1) 吸収速度定数	該当資料なし
(2) バイオアベイラビリティ	該当資料なし
(3) 消失速度定数	該当資料なし
(4) クリアランス	該当資料なし
(5) 分布容積	該当資料なし
(6) 血漿蛋白結合率	該当資料なし
3. 吸収	
(1) 吸収部位	眼
(2) 経路	該当資料なし
(3) 吸収率	該当資料なし
(4) 腸肝循環	該当資料なし
4. 分布	
(1) 血液-脳関門通過性	該当資料なし

VII. 体内薬物動態に関する項目

(2) 胎児への移行性	該当資料なし
(3) 乳汁中への移行性	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
5. 代謝	
(1) 代謝部位及び代謝経路	該当資料なし
(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	該当資料なし
(2) 排泄率	該当資料なし
(3) 排泄速度	該当資料なし
7. 透析等による除去率	
(1) 腹膜透析	該当資料なし
(2) 血液透析	該当資料なし
(3) 直接血管灌流	該当資料なし

VIII. 使用上の注意に関する項目

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	該当しない				
3. 効能・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・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	該当資料なし				
(2) 併用注意とその理由	該当資料なし				
8. 副作用					
(1) 副作用の概要	<p>・総症例5,325例中5例(0.094%)に副作用が認められた。その主なものは過敏症状であった。</p> <p>以下の副作用が認められた場合には、投与を中止すること。</p>				
1) 重大な副作用と初期症状	該当資料なし				
2) その他の副作用	<table border="1"> <tr> <td></td> <td>0.1%未満</td> </tr> <tr> <td>眼</td> <td>眼瞼の腫脹、発赤、そう痒感</td> </tr> </table>		0.1%未満	眼	眼瞼の腫脹、発赤、そう痒感
	0.1%未満				
眼	眼瞼の腫脹、発赤、そう痒感				
(2) 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				

VIII. 使用上の注意に関する項目

(3) 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
(4) 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. 高齢者への使用に関する注意	該当資料なし
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	該当資料なし
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	該当資料なし
13. 過量投与時	該当資料なし
14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。 遮光袋に入れて保存すること。
15. その他	なし

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 一般薬理

該当資料なし

2. 毒性

(1) 単回投与毒性試験

水溶性アズレンのLD₅₀、中毒症状と死因（72時間値）

	マウス	
	♂	
皮下注	535	
腹腔注	365	

LD₅₀(mg/kg)

中毒症状：死亡所見としては、痙攣などの変化は見られず、次第に呼吸困難の状態となってしまった。

(2) 反復投与毒性試験

マウスにLD₅₀値の1/2、1/10、1/50量を皮下及び腹腔内投与を24日間連続投与した結果、体重、臓器重量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

AZ点眼液0.02%を家兎に1日3回、20日間点眼し、眼組織について薬物の影響を調べたところ、肉眼的・組織学的所見上何等異常が、認められなかった。

X. 取扱い上の注意、包装、承認等に関する項目

1. 有効期間又は使用期限	3年1ヵ月
2. 貯法・保存条件	遮光した気密容器
3. 薬剤取扱い上の注意点	特になし
4. 包装（形態、規格）	5mL×10、5mL×50
5. 同一成分・同効薬	同一成分薬 アズレン点眼液0.02%「わかもと」（わかもと） アズラビン点眼液0.02%（日本点眼薬） アゾテシン点眼液0.02%（参天） 同効薬 フルメトロン点眼液0.02%（参天）
6. 国際誕生年月日	該当しない
7. 製造・輸入承認年月日 及び承認番号	製造承認年月日 2008年9月5日 承認番号 22000AMX02022000
8. 薬価基準収載年月日	2008年12月19日
9. 効能・効果追加、用法・ 用量変更追加等の年月 日及びその内容	該当しない
10. 再審査結果、再評価結 果公表年月日及びその 内容	該当資料なし

X. 取扱い上の注意、包装、承認等に関する項目

11. 再審査期間	該当しない
12. 長期投与の可否	該当しない
13. 厚生労働省薬価基準収載の医薬品コード	1319703Q2124
14. 保険給付上の注意	な し

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 中村 善寿 他：眼科臨床医報 62(4)、386 (1968)
- 2) 大岡 良子 他：Clinical Report 3(4)、257 (1969)
- 3) 佐野 正純：眼科臨床医報 63(8)、675 (1969)
- 4) 石川 清 他：水溶性アズレン点眼液 (AZ点眼液) の使用経験 (社内資料)
- 5) 大熊 紘：水溶性アズレン (ジメチルイソプロピルアズレンスルホン酸ナトリウム) 点眼液の炎症性角膜症患者に対する使用経験 (社内資料)
- 6) 桶渡 正五：AZ点眼液の使用経験について (社内資料)
- 7) 八田 正幸：AZ点眼液の使用成績 (社内資料)
- 8) 田中 宣彦：AZ点眼液の使用経験 (社内資料)
- 9) 谷口 慶晃：AZ点眼液の使用経験 (社内資料)
- 10) 舟橋 知也 他：家兎における実験的アレルギー性結膜炎に対するAZ点眼液の治療効果 (社内資料)
- 11) 猿谷 繁 他：水溶性アズレンの実験アレルギー性結膜炎に及ぼす影響について (社内資料)

XII. 参考資料

主な外国での発売状況

なし

XIII. 備 考

その他の関連資料

な し

文献請求先

ゼリア新薬工業株式会社 お客様相談室
〒103-8351 東京都中央区日本橋小舟町10-11
TEL (03)3661-0277

