

貯法：室温保存  
有効期間：5年

口腔内炎症治療剤－徐放性挿入錠－  
アズレンスルホン酸ナトリウム水和物錠

# アズノール<sup>®</sup>ST錠口腔用5mg

Azunol<sup>®</sup> ST Tablets

日本標準商品分類番号

872399

承認番号 21800AMX10778000

販売開始 1986年12月

Z16

### 3. 組成・性状

#### 3.1 組成

販売名	アズノールST錠口腔用5mg
有効成分	1錠中 アズレンスルホン酸ナトリウム水和物5mg
添加剤	炭酸水素ナトリウム、ヒプロメロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、香料、デキストリン、乳糖水和物、精製白糖、トウモロコシデンプン、塩化ナトリウム、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム

#### 3.2 製剤の性状

販売名	アズノールST錠口腔用5mg
製剤の色	青色
形状	だ円形の裸錠
識別コード	Ⓢ234

#### 4. 効能又は効果

咽頭炎、扁桃炎、口内炎、急性歯肉炎、舌炎、口腔創傷

#### 6. 用法及び用量

通常1回1錠を1日4回左右いずれかの上顎の歯肉口唇移行部に挿入する。

なお、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

	0.1～1%未満
消化器	悪心、胃部不快感、胃部膨満感、食欲不振、便秘、下痢

#### 14. 適用上の注意

##### 14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

##### 14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 左右いずれかの上顎の歯肉口唇移行部に挿入すること。

14.2.2 挿入部付近に病巣を有する患者では、それを避けて使用すること。

14.2.3 本剤は誤って飲み込んでもさしつかえない。また本剤使用中に口腔内が青色になることがあるが、これは有効成分によるもので漸次消失する。

#### 16. 薬物動態

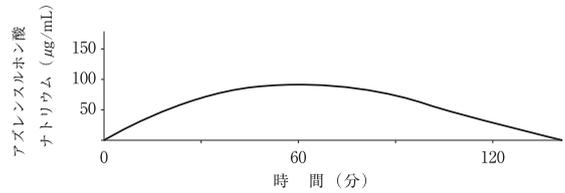
##### 16.2 吸収

口腔内投与では、正常口腔粘膜から吸収されないが、実験的損傷粘膜からわずかに吸収されることが認められている（ラット）<sup>1)</sup>。また経口投与では一部消化管から吸収される（ラット）<sup>2)</sup>。

##### 16.3 分布

本剤1錠を上顎の歯肉口唇移行部に挿入した場合の唾液中のアズレンスルホン酸ナトリウム濃度は、投与後約90分間、40 $\mu$ g/mL以上を維持する。また、挿入中の唾液分泌量の増加は少なく、唾液中に溶出したアズレンスルホン酸ナトリウムは安定である（健康成人）<sup>3)</sup>。経口投与したとき、主に血液、肝臓、腎臓に多く分布し、中枢神経系への分布はみられない（ラット）<sup>2)</sup>。

アズレンスルホン酸ナトリウムの唾液中濃度推移（健康成人）



##### 16.5 排泄

経口投与した場合、投与後72時間で約80%が尿及び糞中へ排泄される（ラット）<sup>2)</sup>。

#### 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

咽頭炎、口内炎を対象に、プラセボを対照薬とした二重盲検比較試験において、本剤の有用性が確認されており<sup>4)</sup>、またアズレンスルホン酸ナトリウム水和物錠（含嗽）との比較試験においても治癒日数の短縮が認められている<sup>5)</sup>。

二重盲検比較試験を含む全国18施設、総計762例の臨床成績は、有効率66.9%（510/762例）であった。

疾患名	有効率（有効以上例数/評価対象例数）
咽頭炎 <sup>注1)</sup>	59.6% (180/302)
扁桃炎	71.7% (38/53)
口内炎	74.2% (112/151)
急性歯肉炎	66.1% (39/59)
舌炎	65.9% (54/82)
口腔創傷 <sup>注2)</sup>	75.7% (87/115)
計	66.9% (510/762)

注1) 咽喉頭炎を含む

注2) 扁桃、抜歯、声帯ポリープ、慢性副鼻腔炎等の手術後創傷

#### 18. 薬効薬理

##### 18.1 作用機序

本剤の抗炎症作用は、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、PGE<sub>2</sub>合成阻害作用を示さない。このことから、本剤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<sup>6),7)</sup>。

##### 18.2 実験的口腔内炎に対する創傷治癒促進作用

口腔内粘膜に酢酸を注入し惹起させた実験的口腔内炎に対し、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物は40 $\mu$ g/mL以上の濃度で有意に創

傷治癒促進作用を認めている（ハムスター）<sup>8)</sup>。また角膜上皮剥離等の実験的創傷においても治癒促進効果を認めている（家兎）<sup>9)</sup>。

### 18.3 消炎作用

アズレンスルホン酸ナトリウム水和物は、*in vitro*において白血球遊走阻止作用を認めるとともに、肥満細胞からのヒスタミン遊離抑制作用を示し、またカラゲニン、デキストラン等の各種起炎物質による浮腫、カラゲニン胸膜炎等、種々の実験的炎症を抑制することが知られている（ラット）<sup>6) .10)</sup>。

### 19. 有効成分に関する理化学的知見

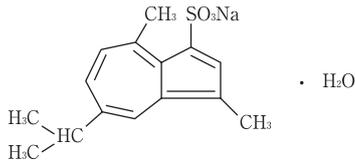
一般的名称：アズレンスルホン酸ナトリウム水和物（Sodium Gualenate Hydrate）

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

分子式：C<sub>15</sub>H<sub>17</sub>NaO<sub>3</sub>S · H<sub>2</sub>O

分子量：318.36

化学構造式：



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。

### 20. 取扱い上の注意

アルミビローの開封後は湿気を避けて保管すること。

### 22. 包装

100錠 [10錠 (PTP) ×10]、500錠 [10錠 (PTP) ×50]

### 23. 主要文献

- 1) 社内資料：アズレンスルホン酸ナトリウムの口腔内吸収
- 2) 社内資料：水溶性アズレンの吸収分布排泄について
- 3) 小野尊睦ほか：基礎と臨床. 1981;15 (13) :6658-66
- 4) 武田一雄ほか：耳鼻臨床. 1981;74 (10) :2275-92
- 5) 原田康夫ほか：耳鼻臨床. 1983;76 (5) :1505-15
- 6) 柴田芳久ほか：薬理と治療. 1986;14 (3) :1303-11
- 7) 山崎英正ほか：日薬理誌. 1958;54 (2) :362-77
- 8) 吉田博次ほか：薬理と治療. 1986;14 (3) :1313-20
- 9) 佐々木嘉彦ほか：日本眼科紀要. 1962;13 (3) :116-24
- 10) 宇田昭夫：日薬理誌. 1960;56:1151-63

### 24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本新薬株式会社 製品情報担当  
〒601-8550 京都市南区吉祥院西ノ庄門口町14  
フリーダイヤル 0120-321-372  
TEL 075-321-9064  
FAX 075-321-9061

### 26. 製造販売業者等

#### 26.1 製造販売元

日本新薬株式会社  
京都市南区吉祥院西ノ庄門口町14

