

貯 法：気密容器、  
 湿気を避けて室温保存  
 使用期限：外箱に表示

口腔内炎症治療剤-徐放性挿入錠-

※※ **アズノール<sup>®</sup>ST錠口腔用5mg**  
 Azunol<sup>®</sup>ST Tablets 5mg

※※承認番号	21800AMX10778000
※※薬価収載	2006年12月
※※販売開始	1986年12月

<アズレンスルホン酸ナトリウム水和物製剤>

## 組成・性状

### 1. 組成

本剤は1錠中、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物5mgを含有する。添加物として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を含有する。

### 2. 製剤の性状

本剤は、青色のだ円形の裸錠で味は清涼でわずかに甘い。

表	裏	側面	識別コード	長径(mm)	短径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)
			234	10.5	6.0	3.7	180

## 効能・効果

咽頭炎、扁桃炎、口内炎、急性歯肉炎、舌炎、口腔創傷

## 用法・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。



## 使用上の注意

### 1. 副作用

調査対象762例において、副作用が発現した症例は9例(1.2%)で、いずれも悪心、胃部不快感等の軽度の消化器症状であり、臨床検査上も異常は認められていない。(承認時)

種類	頻度	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、下痢等

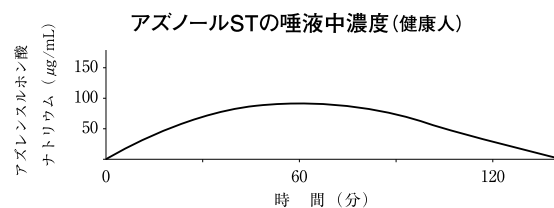
### 2. 適用上の注意

- (1)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。
- (2)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。
- (3)薬剤交付時：  
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して使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、更には穿孔を起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。]

## 薬物動態<sup>1)</sup>

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が少なく、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(健康人)。



## <参考>

### 動物での吸収・排泄<sup>2),3)</sup>

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。また経口投与では一部消化管から吸収され、投与後24時間には約80%が、投与後3日目には全量が尿、糞中より排泄される(ラット)。組織への分布は循環器系に集中し、脳内及び中枢神経系への分布は無視し得る程度である。

## 臨床成績

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>、またアズノール錠（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例/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*	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**	75.7%（87/115）
計	66.9%（510/762）

\* 咽喉頭炎を含む

\*\* 扁桃摘、拔牙、声帯ポリープ、慢性副鼻腔炎等の手術後創傷

## 薬効薬理

### 1. 実験的口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>6)</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>7)</sup>）。

### 2. 消炎作用

本品は、*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>8),9)</sup>）。その消炎作用機序は、下垂体-副腎系を介するものでなく、炎症組織に対する直接的な局所作用であると考えられている<sup>8),10)</sup>。

## 有効成分に関する理化学的知見

一般名：アズレンスルホン酸ナトリウム水和物

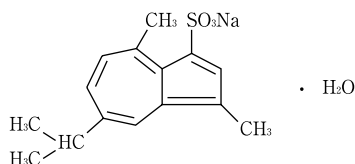
(Sodium Gualenate Hydrate)

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。

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。

## 包装

アズノールST錠口腔用5mg：PTP100錠、500錠

## 主要文献

- 1) 小野尊睦ほか：基礎と臨床, 15(13), 6658(1981)
- 2) 杉山 信ほか：アズレンスルホン酸ナトリウムの口腔内吸収（日本新薬社内資料）
- 3) 井上 祥ほか：水溶性アズレンの吸収分布排泄について（日本新薬社内資料）(1974)
- 4) 武田一雄ほか：耳鼻臨床, 74(10), 2275(1981)
- 5) 原田康夫ほか：耳鼻臨床, 76(5), 1505(1983)
- 6) 吉田博次ほか：薬理と治療, 14(3), 1313(1986)
- 7) 佐々木嘉彦ほか：日本眼科紀要, 13(3), 116(1962)
- 8) 柴田芳久ほか：薬理と治療, 14(3), 1303(1986)
- 9) 宇田昭夫：日薬理誌, 56(5), 1151(1960)
- 10) 山崎英正ほか：日薬理誌, 54(2), 362(1958)

## 文献請求先

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

日本新薬株式会社 医薬情報部 くすり相談担当

〒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

※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