

※※2005年 5 月改訂（第 4 版、薬事法改正に伴う改訂）
※2003年 4 月改訂

日本標準商品分類番号
8 7 2 3 2 3

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

胃炎・胃潰瘍治療剤

アズノール®細粒(0.4%)
アズノール®細粒(1%)

Azunol® Fine Granules
＜アズレンスルホン酸ナトリウム水和物細粒＞

	0.4%	1 %
承認番号	(61AM) 4737	(61AM) 4738
薬価収載	1987年10月	
販売開始	1987年11月	

組成・性状

※ 1. 組成

アズノール細粒(0.4%)：1 g 中にアズレンスルホン酸ナトリウム水和物 4 mg を含有する。
添加物として乳糖水和物、炭酸水素ナトリウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、香料、アラビアゴム、デキストリン、含水二酸化ケイ素を含有する。

アズノール細粒（1％）：1 g 中にアズレンスルホン酸ナトリウム水和物10mg を含有する。
添加物として乳糖水和物、炭酸水素ナトリウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、香料、アラビアゴム、デキストリン、含水二酸化ケイ素を含有する。

2. 製剤の性状

アズノール細粒(0.4%)：本剤は明るい淡青色の細粒で、においはないか、又はわずかにそう快な芳香があり、味は清涼で、わずかに甘い。
識別コード：㊀235（分包）

アズノール細粒（1％）：本剤は淡青色の細粒で、においはないか、又はわずかにそう快な芳香があり、味は清涼で、わずかに甘い。
識別コード：㊀236（分包）

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 2 mg〔アズノール細粒（0.4％）として0.5g、アズノール細粒（1％）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。

種類	頻度	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

＜参考＞

³⁵S 標識アズレンスルホン酸ナトリウム水和物を Wistar 系雄性ラットに経口投与した結果、投与後 2 時間までに胃で10%、小腸で36%の吸収率を示した。投与24時間後には、尿中に約35%、72時間後には糞尿中に80%以上が排泄される。オートラジオグラフィーによる体内分布は、投与24時間後、消化管内に未吸収及び胆汁排泄による放射活性が残存している他に、肝、腎に僅少の残存が見られた¹⁾。

薬効薬理

1. 実験的胃炎に対する効果

エタノール経口投与により発生した胃炎に伴う胃液分泌亢進は、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 0.3mg～1.0mg/kg× 3 /日 2 日間以上の経口投与により有意に抑制され、組織学的には炎症像の軽減傾向、粘膜出血像の発現頻度の減少が認められた。一方、本品はエタノール非投与動物の胃液分泌に影響を与えないことから、本品の胃液分泌抑制効果は胃炎症状緩解の結果であると考えられる (Sprague-Dawley 系ラット)²⁾。

更に *in vitro* での抗ペプシン作用も報告されている³⁾。

2. 消炎作用

(1) カラゲニン浮腫抑制作用

Sprague-Dawley 系ラット足蹠皮下に カラゲニン溶液を投与することにより発生する浮腫は、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 2μg/mL 以上の同時投与により、有意の抑制を示す。対照として用いたインドメタシンでも浮腫抑制傾向を認めるが、別途に羊精囊ミクロソームを用いたアラキドン酸→PGE₂ 生成に及ぼす両成分の作用は全く異なり、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物は PGE₂ 生成を阻害せず、インドメタシンと消炎作用機作の異なることも認められている⁴⁾。

(2) ヒスタミン遊離抑制作用

Sprague-Dawley 系ラット腹腔内より採取した肥満細胞を用い、Compound 48/80添加で遊離するヒスタミンは、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物前投与で抑制される⁴⁾。その作用機序は、下垂体－副腎系を介するものでなく、直接的な作用であると考えられている⁵⁾。

有効成分に関する理化学的知見

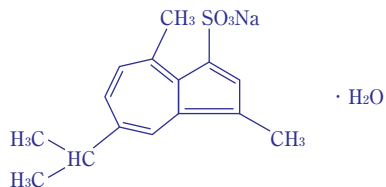
一般名：アズレンスルホン酸ナトリウム水和物
(Sodium Gualenate Hydrate)

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

分子式： $C_{15}H_{17}NaO_3S \cdot H_2O$

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

アズノール細粒（0.4%）：500g、0.5g×1200包

アズノール細粒（1%）：500g、0.2g×1200包

主要文献

- 1) 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)
- 2) 上田房雄ほか：薬理と治療, 15, 3667 (1987)
- 3) Thiemer, K. et al.: Arzneimittel-Forsch., 22, 1086 (1972)
- 4) 柴田芳久ほか：薬理と治療, 14(3), 1303 (1986)
- 5) 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 医薬情報センター

〒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