

貯 法：室温保存
有効期間：3年

承認番号	30100AMX00155000
販売開始	2005年7月

アズレン含嗽液

アズレンスルホン酸ナトリウム水和物製剤

アズレンうがい液4%「TOA」

Azulene Gargle Liquid 4% "TOA"

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	アズレンうがい液4%「TOA」
有効成分	1mL中 アズレンスルホン酸ナトリウム水和物 40mg
添加剤	プロピレングリコール、マクロゴール400、エタノール、ベンゼトニウム塩化物、リン酸水素ナトリウム、l-メントール、ウイキョウ油、pH調節剤

3.2 製剤の性状

販売名	アズレンうがい液4%「TOA」
pH	7.0~9.0
性状	濃青色の液剤で、芳香がある。

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

アズレンスルホン酸ナトリウム水和物として、1回4~6mg（4~5滴）を、適量（約100mL）の水又は微温湯に溶解し、1日数回含嗽する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

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

	頻度不明
口腔	口中のあれ、口腔・咽頭の刺激感

14. 適用上の注意

14.1 薬剤使用時の注意

拔牙後等の口腔創傷の場合、血餅の形成が阻害されると思われる時期には、激しい洗口を避けさせること。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

アズレンスルホン酸ナトリウム水和物の抗炎症作用は、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、PGE₂生成阻害作用を示さない。このことから、アズレンスルホン酸ナトリウム水和物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^{1)、2)}。

18.2 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40μg/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）³⁾。

18.3 消炎作用

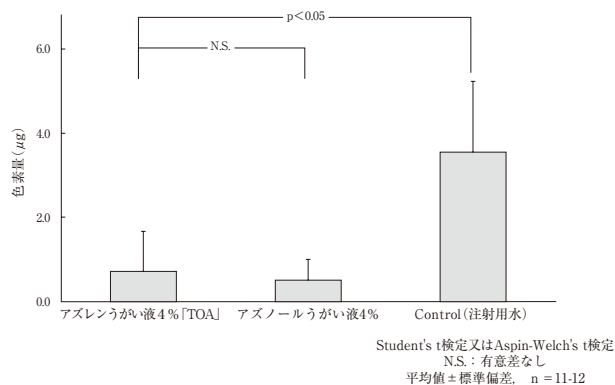
アズレンスルホン酸ナトリウム水和物は、*in vitro*において白血球遊走阻止作用を認めるとともに、肥満細胞からのヒスタミン遊離抑制作用を示し、またカラゲニン、デキストラン等の各種起炎物質による浮腫、カラゲニン胸膜炎等、種々の実験的炎症を抑制することが知られている（ラット）^{1)、4)}。

18.4 生物学的同等性試験

18.4.1 ラット口腔内毛細血管透過性抑制作用

ラット口腔内毛細血管透過性モデルに対して、アズレンうがい液4%「TOA」とアズノールうがい液4%の20倍希釈液を口腔内に注入後、注入した色素の口腔内毛細血管からの漏出色素量を指標にして消炎作用を比較した。その結果、両剤ともControl（注射用水）に対して有意な色素量の減少が認められ、両剤間では有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された⁵⁾。

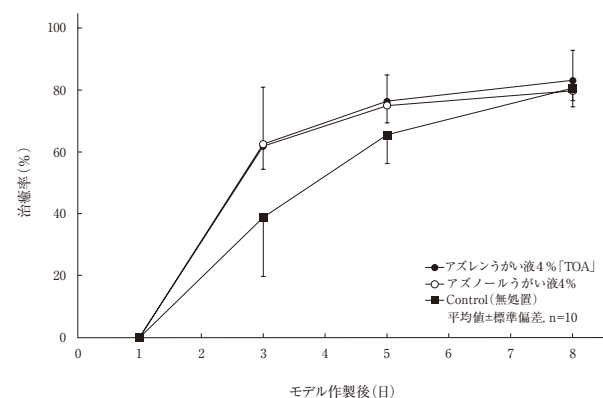
ラット口腔内毛細血管透過性抑制作用



18.4.2 ハムスター口内炎治癒効果

ハムスター口内炎モデルに対して、アズレンうがい液4%「TOA」とアズノールうがい液4%の800倍希釈液を頬嚢内に注入投与（含嗽）し、創傷部面積を指標として治癒率を比較した。その結果、両剤ともControl（無処置）に対して治癒率に有意な差が認められ、両剤間では有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された⁵⁾。

ハムスター口内炎治癒効果



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

分子式： $C_{15}H_{17}NaO_3S \cdot 1/2H_2O$ 又は $C_{15}H_{17}NaO_3S \cdot H_2O$

分子量：309.36又は318.36

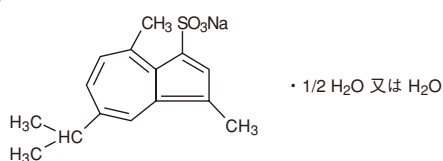
性状：暗青色の結晶又は結晶性の粉末で、におい及び味はない。

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。

水溶液（1→200）のpHは6.0～9.0である。

光により変化する。

化学構造式：



20. 取扱い上の注意

火気に近づけないこと。

22. 包装

プラスチック容器：10mL×10本

23. 主要文献

- 1) 柴田芳久他：薬理と治療．1986；14（3）：1303-1311
- 2) 山崎英正他：日薬理誌．1958；54（2）：362-377
- 3) 吉田博次他：薬理と治療．1986；14（3）：1313-1320
- 4) 宇田昭夫：日薬理誌．1960；56（5）：1151-1163
- 5) 東亜薬品株式会社：生物学的同等性に関する資料（社内資料）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本ケミファ株式会社 安全管理部

〒101-0032 東京都千代田区岩本町2丁目2-3

TEL 0120-47-9321 03-3863-1225

FAX 03-3861-9567

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

TOA 東亜薬品株式会社

富山県富山市水橋開発277番10

26.2 販売元

 **日本ケミファ株式会社**
東京都千代田区岩本町2丁目2-3