

承認番号	22100AMX01162000
薬価収載	2009年9月
販売開始	1988年7月

消炎性抗潰瘍剤

アズクレニン[®]S配合顆粒

AZUCURENIN[®]S COMBINATION GRANULES

〔貯法〕
遮光・気密容器保存
〔使用期限〕
外箱に表示の
期限内に使用すること。

**【組成・性状】

販売名	アズクレニンS配合顆粒	
成分・含量 (1g中)	アズレンスルホン酸ナトリウム水和物	3mg
	日局 L-グルタミン	990mg
添加物	メチルセルロース、軽質無水ケイ酸	
剤形・性状	淡青色の顆粒剤	

【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
胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃炎

【用法・用量】

通常成人1日1.5~2.0gを3~4回に分割経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 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。

その他の副作用

以下の副作用が認められた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、そう痒感
肝臓	AST (GOT)、ALT (GPT)、LDH、Al-P、 γ -GTP上昇等の肝機能障害
消化器	悪心、嘔吐、便秘、下痢、腹痛、膨満感、嘔気、胃部不快感
その他	顔面紅潮

注) このような場合には投与を中止すること。

2. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。(使用経験がない)

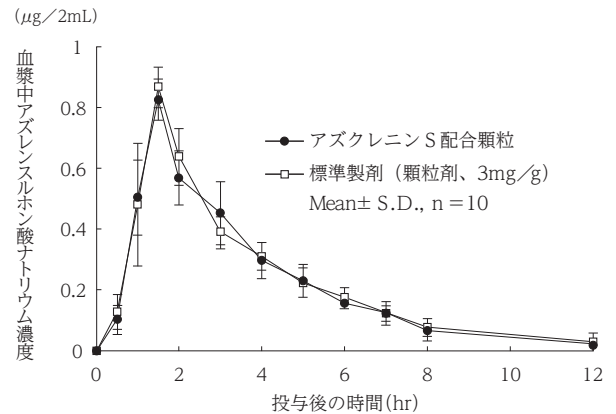
【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

(1) アズレンスルホン酸ナトリウム水和物

アズクレニンS配合顆粒と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ4g (アズレンスルホン酸ナトリウム水和物として12mg) 健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中アズレンスルホン酸ナトリウム濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log (0.80)~log (1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

注) 本剤の承認された1回用量は1日1.5~2.0gを3~4回に分割経口投与である。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/2\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/2\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
アズクレニンS 配合顆粒	2.58 ±0.24	0.82 ±0.07	1.50 ±0.00	2.45 ±1.76
標準製剤 (顆粒剤、3mg/g)	2.65 ±0.26	0.86 ±0.07	1.50 ±0.00	2.28 ±0.85

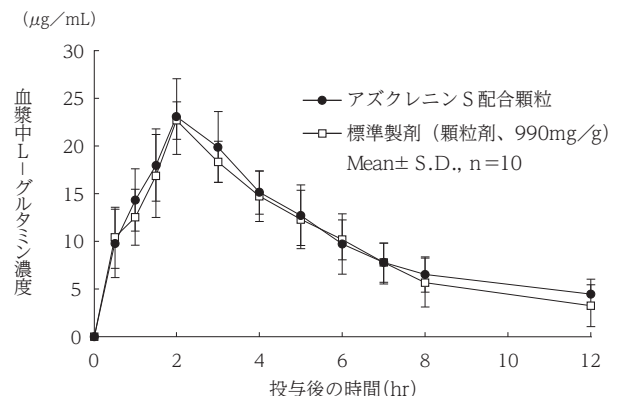
(Mean ± S.D., n=10)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2) L-グルタミン

アズクレニンS配合顆粒と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1g (L-グルタミンとして990mg) 健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中L-グルタミン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log (0.80)~log (1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

注) 本剤の承認された1回用量は1日1.5~2.0gを3~4回に分割経口投与である。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
アズクレニンS 配合顆粒	129.06 ±21.66	24.37 ±2.93	2.10 ±0.32	6.77 ±3.16
標準製剤 (顆粒剤、990mg/g)	121.13 ±20.35	22.71 ±1.98	2.00 ±0.00	4.05 ±2.85

(Mean ± S.D., n=10)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

アズクレニンS配合顆粒は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアズレンスルホン酸ナトリウム3mg/g・L-グルタミン990mg/g顆粒の溶出規格に適合していることが確認されている。²⁾

【薬効薬理】

薬力学的試験

雄性ラットによる各種実験潰瘍病態モデル（塩酸エタノール、エタノール及びインドメタシン潰瘍）にアズクレニンS配合顆粒と標準製剤を体重1kgあたり500mg及び1000mgを投与した結果、両剤は、同様の潰瘍抑制効果を示し、生物学的に同等であることが確認された。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

〈アズレンスルホン酸ナトリウム水和物〉

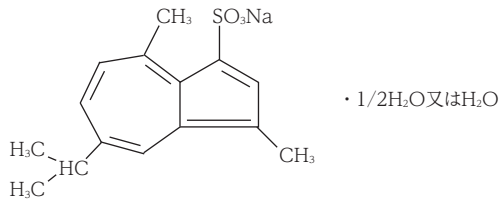
一般名：アズレンスルホン酸ナトリウム水和物
(Sodium Gualenate Hydrate)

化学名：Sodium 1,4-dimethyl-7-isopropylazulene-3-sulfonate hemihydrate or hydrate

分子式：C₁₅H₁₇NaO₃S・1/2H₂O又はH₂O

分子量：309.36又は318.36

構造式：



性状：アズレンスルホン酸ナトリウム水和物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。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。

〈L-グルタミン〉

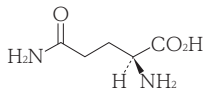
一般名：L-グルタミン（L-Glutamine）

化学名：(2S)-2,5-Diamino-5-oxopentanoic acid

分子式：C₅H₁₀N₂O₃

分子量：146.14

構造式：



性状：L-グルタミンは白色の結晶又は結晶性の粉末で、僅かに特異な味がある。ギ酸に溶けやすく、水にやや溶けやすく、エタノール（99.5）にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、アズクレニンS配合顆粒の室温保存における3年間の安定性が確認された。⁴⁾

**【包装】

アズクレニンS配合顆粒

バラ：1kg

〈本品は多少の色調幅がありますが、成分等に影響はありません。〉

【主要文献】


- 1)長生堂製薬株式会社 社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）
- 2)長生堂製薬株式会社 社内資料（溶出試験に関する資料）
- 3)長生堂製薬株式会社 社内資料（生物学的同等性試験（薬力学的試験）に関する資料）
- 4)長生堂製薬株式会社 社内資料（安定性試験に関する資料）

*【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下さい。
日本ジェネリック株式会社 お客様相談室
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

®登録商標

*販売元

 日本ジェネリック株式会社
東京都千代田区丸の内一丁目9番1号

製造販売元

 長生堂製薬株式会社
徳島市国府町府中92番地