

消炎性抗潰瘍剤

**トワズレン® 配合顆粒**

《アズレンスルホン酸ナトリウム・L-グルタミン顆粒》  
 TOWAZUREN® COMBINATION GRANULES

貯 法：遮光・室温保存、気密容器  
 使用期限：外箱、ラベルに記載

日本標準商品分類番号 872329			
承認番号	薬価収載	販売開始	再評価(品質)
22100AMX01077	2009年9月	1990年7月	2001年12月

【組成・性状】

1g中の有効成分	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	ポリビニルアルコール（完全けん化物）、メチルセルロース
性状	淡青色の顆粒剤。1包0.67gの分包品もある。

【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、症状に応じて適宜増減する。

【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 <sup>2)</sup>	発疹、蕁麻疹、そう痒感
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、LDH上昇、Al-P上昇、 $\gamma$ -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女性には、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

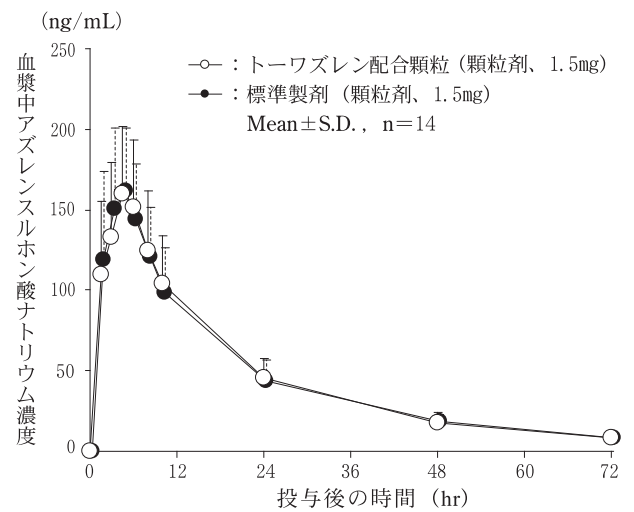
低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。(使用経験がない)

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

トワズレン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0.5g(アズレンスルホン酸ナトリウム水和物として1.5mg)健康成人男子(n=14)に絶食単回経口投与して血漿中未

変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された(昭和55年5月30日 薬審第718号に基づく)<sup>1)</sup>。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>72</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
トワズレン配合顆粒 (顆粒剤、1.5mg)	3347.9±858.8	167.3±42.0	4.39±1.10	19.49±3.43
標準製剤 (顆粒剤、1.5mg)	3296.5±829.7	170.1±41.7	4.29±0.99	21.49±7.77

(Mean±S. D., n=14)

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

トワズレン配合顆粒は、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<sup>2)</sup>。

【薬効薬理】

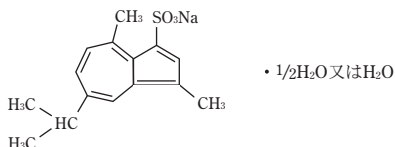
薬力学的試験

SD系雄性ラット(1群20匹)による各種病態モデル(ストレス潰瘍モデル、インドメタシン潰瘍モデル、幽門結紮潰瘍モデル及び幽門結紮-アスピリン潰瘍モデル)にトワズレン配合顆粒と標準製剤(体重1kgあたり製剤1g)を胃内に投与した結果、両製剤はそれぞれ抗潰瘍作用を示し、生物学的に同等であると判断された<sup>3)</sup>。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

### 1. アズレンスルホン酸ナトリウム水和物

構造式：



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

別名：アズレンスルホン酸ナトリウム、水溶性アズレン

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

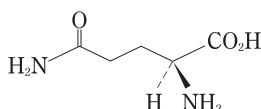
分子式： $\text{C}_{15}\text{H}_{17}\text{NaO}_3\text{S} \cdot \frac{1}{2}\text{H}_2\text{O}$ 又は $\text{C}_{15}\text{H}_{17}\text{NaO}_3\text{S} \cdot \text{H}_2\text{O}$

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。

### 2. L-グルタミン

構造式：



一般名：L-グルタミン (L-Glutamine)

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

分子式： $\text{C}_5\text{H}_{10}\text{N}_2\text{O}_3$

分子量：146.14

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、わず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加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、トーフズレン配合顆粒は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された<sup>4)</sup>。

### ※※【包装】

\*トーフズレン配合顆粒：0.67g×210包、0.67g×1050包  
500g、1kg(バラ)

※※(5kg(バラ)：製造中止)

### 【主要文献】

- 1) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：薬力学的試験
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験

## 【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター(24時間受付対応)

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL06-6900-9108 FAX06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>



製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号