

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019年更新版）に準拠して作成

## 潰瘍性大腸炎治療剤

### メサラジン注腸 1%製剤

## メサラジン注腸 1g「JG」

### Mesalazine Enema

剤形	注腸剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1個 100mL 中 日局 メサラジン 1g 含有
一般名	和名：メサラジン（JAN） 洋名：Mesalazine（JAN、INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2012年2月15日 薬価基準収載年月日：2012年6月22日 販売開始年月日：2012年6月22日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本ジェネリック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 TEL 0120 - 893 - 170 FAX 0120 - 893 - 172 医療関係者向けホームページ： <a href="https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/">https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/</a>

本 IF は 2024 年 5 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

(2020年4月改訂)

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

## 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、  
「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには  
十分留意すべきである。

#### 4. 利用に際しての留意点

I Fを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I Fは  
日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正  
使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性  
及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オ  
ブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承  
認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うこ  
とは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自ら  
がI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得ら  
れる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは  
薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目次

I. 概要に関する項目	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	7
1. 開発の経緯	1	9. 溶出性	7
2. 製品の治療学的特性	1	10. 容器・包装	8
3. 製品の製剤学的特性	1	(1)注意が必要な容器・包装、外観が特殊な 容器・包装に関する情報	8
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(2)包装	8
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(3)予備容量	8
(1)承認条件	1	(4)容器の材質	8
(2)流通・使用上の制限事項	1	11. 別途提供される資材類	8
6. RMPの概要	1	12. その他	9
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	10
1. 販売名	2	1. 効能又は効果	10
(1)和名	2	2. 効能又は効果に関連する注意	10
(2)洋名	2	3. 用法及び用量	10
(3)名称の由来	2	(1)用法及び用量の解説	10
2. 一般名	2	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	10
(1)和名（命名法）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	10
(2)洋名（命名法）	2	5. 臨床成績	10
(3)ステム（stem）	2	(1)臨床データパッケージ	10
3. 構造式又は示性式	2	(2)臨床薬理試験	10
4. 分子式及び分子量	2	(3)用量反応探索試験	10
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(4)検証的試験	11
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1)有効性検証試験	11
III. 有効成分に関する項目	3	2)安全性試験	11
1. 物理化学的性質	3	(5)患者・病態別試験	11
(1)外観・性状	3	(6)治療的使用	11
(2)溶解性	3	1)使用成績調査（一般使用成績調査、特 定使用成績調査、使用成績比較調査）、 製造販売後データベース調査、製造販 売後臨床試験の内容	11
(3)吸湿性	3	2)承認条件として実施予定の内容又は実 施した調査・試験の概要	11
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点	3	(7)その他	11
(5)酸塩基解離定数	3	VI. 薬効薬理に関する項目	12
(6)分配係数	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	12
(7)その他の主な示性値	3	2. 薬理作用	12
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(1)作用部位・作用機序	12
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	12
IV. 製剤に関する項目	4	(3)作用発現時間・持続時間	12
1. 剤形	4	VII. 薬物動態に関する項目	13
(1)剤形の区別	4	1. 血中濃度の推移	13
(2)製剤の外観及び性状	4	(1)治療上有効な血中濃度	13
(3)識別コード	4	(2)臨床試験で確認された血中濃度	13
(4)製剤の物性	4	(3)中毒域	14
(5)その他	4	(4)食事・併用薬の影響	14
2. 製剤の組成	4	2. 薬物速度論的パラメータ	14
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	4	(1)解析方法	14
(2)電解質等の濃度	4	(2)吸収速度定数	14
(3)熱量	4	(3)消失速度定数	14
3. 添付溶解液の組成及び容量	4		
4. 力価	5		
5. 混入する可能性のある夾雑物	5		
6. 製剤の各種条件下における安定性	5		
7. 調製法及び溶解後の安定性	7		

(4)クリアランス	14	(1)臨床使用に基づく情報	20
(5)分布容積	14	(2)非臨床試験に基づく情報	20
(6)その他	14		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	14	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	21
(1)解析方法	14	1. 薬理試験	21
(2)パラメータ変動要因	14	(1)薬効薬理試験	21
4. 吸収	14	(2)安全性薬理試験	21
5. 分布	14	(3)その他の薬理試験	21
(1)血液－脳関門通過性	14	2. 毒性試験	21
(2)血液－胎盤関門通過性	15	(1)単回投与毒性試験	21
(3)乳汁への移行性	15	(2)反復投与毒性試験	21
(4)髄液への移行性	15	(3)遺伝毒性試験	21
(5)その他の組織への移行性	15	(4)がん原性試験	21
(6)血漿蛋白結合率	15	(5)生殖発生毒性試験	21
6. 代謝	15	(6)局所刺激性試験	21
(1)代謝部位及び代謝経路	15	(7)その他の特殊毒性	21
(2)代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率	15	<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	22
(3)初回通過効果の有無及びその割合	15	1. 規制区分	22
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	15	2. 有効期間	22
7. 排泄	15	3. 包装状態での貯法	22
8. トランスポーターに関する情報	15	4. 取扱い上の注意	22
9. 透析等による除去率	15	5. 患者向け資材	22
10. 特定の背景を有する患者	15	6. 同一成分・同効薬	22
11. その他	15	7. 国際誕生年月日	22
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	16	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	22
1. 警告内容とその理由	16	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	23
2. 禁忌内容とその理由	16	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	23
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	16	11. 再審査期間	23
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	16	12. 投薬期間制限に関する情報	23
5. 重要な基本的注意とその理由	16	13. 各種コード	23
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	17	14. 保険給付上の注意	23
(1)合併症・既往歴等のある患者	17	<b>X I. 文献</b>	24
(2)腎機能障害患者	17	1. 引用文献	24
(3)肝機能障害患者	17	2. その他の参考文献	25
(4)生殖能を有する者	17	<b>X II. 参考資料</b>	26
(5)妊婦	17	1. 主な外国での発売状況	26
(6)授乳婦	17	2. 海外における臨床支援情報	26
(7)小児等	17	<b>X III. 備考</b>	27
(8)高齢者	17	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	27
7. 相互作用	18	(1)粉碎	27
(1)併用禁忌とその理由	18	(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	27
(2)併用注意とその理由	18	2. その他の関連資料	27
8. 副作用	18		
(1)重大な副作用と初期症状	18		
(2)その他の副作用	19		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	20		
10. 過量投与	20		
11. 適用上の注意	20		
12. その他の注意	20		

## 略語表

略語	略語内容
Al-P	アルカリホスファターゼ (Alkaline phosphatase)
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ (Alanine aminotransferase)
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (Aspartate aminotransferase)
AUC	血漿中濃度-時間曲線下面積 (Area under the plasma concentration-time curve)
AUC <sub>0-24</sub>	投与 24 時間後までの AUC (AUC from zero to 24 hours)
Cmax	最高血漿中濃度 (Maximum plasma concentration)
CK	クレアチンキナーゼ (Creatine kinase)
CRP	C 反応性蛋白 (C-reactive protein)
DPPHL	2,2-ジフェニル-1-ピクリルヒドラジル (1,1-Diphenyl-2-picrylhydrazyl)
$\gamma$ -GTP	$\gamma$ -グルタミルトランスぺプチターゼ ( $\gamma$ -Glutamyl transpeptidase)
kel	消失速度定数 (Elimination rate constant)
NAG	N-アセチル- $\beta$ -D-グルコサミニダーゼ (N-Acetyl- $\beta$ -D-glucosaminidase)
RH	相対湿度 (Relative humidity)
S.D.	標準偏差 (Standard deviation)
T <sub>1/2</sub>	消失半減期 (Elimination half-life)
Tmax	最高血漿中濃度到達時間 (Time to maximum plasma concentration)
TNBS	2,4,6-トリニトロベンゼンスルホン酸 (2,4,6-Trinitrobenzenesulfonic acid)

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

メサラジン注腸 1g「JG」は、メサラジンを含有する潰瘍性大腸炎治療剤である。

本邦でのメサラジンの注腸剤は、2003年に発売されている。

本剤は日本ジェネリック株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成17年3月31日 薬食発第0331015号）」に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2012年2月に製造販売承認を取得した。

## 2. 製品の治療学的特性

重大な副作用として、間質性肺疾患、心筋炎、心膜炎、胸膜炎、間質性腎炎、ネフローゼ症候群、腎機能低下、急性腎障害、再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少症、肝炎、肝機能障害、黄疸、膵炎、中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）、薬剤性過敏症症候群が報告されている。（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 - 8. 副作用（1）重大な副作用と初期症状」の項参照）

## 3. 製品の製剤学的特性

特になし

## 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

## 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

### (1) 承認条件

該当しない

### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

## 6. RMPの概要

該当しない

## II. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

#### (1) 和名

メサラジン注腸 1g 「JG」

#### (2) 洋名

Mesalazine Enema 1g “JG”

#### (3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」 より命名  
〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号) に基づく〕

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

メサラジン (JAN)

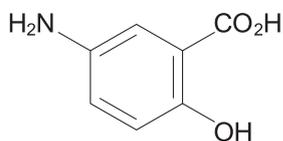
#### (2) 洋名 (命名法)

Mesalazine (JAN、INN、EP)

#### (3) ステム (s t e m)

サリチル酸誘導体: -sal

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式:  $C_7H_7NO_3$

分子量: 153.14

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

5-Amino-2-hydroxybenzoic acid (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

### III. 有効成分に関する項目

---

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色、淡灰色又は帯赤白色の結晶又は結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

水に極めて溶けにくく、エタノール（99.5）にほとんど溶けない。  
希塩酸に溶ける。

溶解度 (37°C) <sup>1)</sup>	pH1.2 : 8.9mg/mL pH4.0 : 1.6mg/mL pH6.8 : 4.6mg/mL pH7.5 : 12.4mg/mL 水 : 1.4mg/mL
-----------------------------	-----------------------------------------------------------------------------------------------

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

##### (5) 酸塩基解離定数 <sup>1)</sup>

$pK_{a1}$  : 2.6 (カルボキシル基、滴定法)

$pK_{a2}$  : 5.8 (アミノ基、滴定法)

$pK_{a3}$  : 12.0 (フェノール性水酸基、滴定法)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

##### 有効成分の確認試験法

日局「メサラジン」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

##### 有効成分の定量法

日局「メサラジン」の定量法による。

電位差滴定法（0.1mol/L 水酸化ナトリウム液 1mL = 15.31mg  $C_7H_7NO_3$ ）

# IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

### (1) 剤形の区別

注腸剤

### (2) 製剤の外観及び性状

性 状	白色～微黄色の懸濁液で、放置するとき、白色の沈殿物と無色～微黄色の上澄液に分離し、この沈殿物は穏やかに振り混ぜるとき、再び容易に懸濁状となる。
外形 (容器)	<p style="text-align: center;">ノズルキャップ 薬液ボトル (単位: mm)</p> <p style="text-align: center;">ノズル延長用カテーテル ストッパー</p>

### (3) 識別コード

該当しない

### (4) 製剤の物性

該当資料なし

### (5) その他

該当しない

## 2. 製剤の組成

### (1) 有効成分 (活性成分) の含量及び添加剤

有効成分 (活性成分) の含量

1 個 100mL 中 日局 メサラジン 1g 含有

添加剤

酢酸ナトリウム水和物、エデト酸ナトリウム水和物、ピロ亜硫酸ナトリウム、pH 調節剤

### (2) 電解質等の濃度

該当しない

### (3) 熱量

該当しない

## 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

#### 4. 力価

該当しない

#### 5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

#### 6. 製剤の各種条件下における安定性

##### ◎加速試験<sup>2)</sup>

包装形態：被験物質をポリエチレン容器に充填し、ヒートシールで気密としたものを脱酸素剤とともにアルミ製外袋に封入し、さらに紙箱に入れたもの

保存条件：40±1℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、pH、純度試験、製剤均一性試験、放出性、懸濁液の特性、抗酸化剤含量、平均容量、微生物限度試験、定量試験

試験項目	性状	確認試験		pH	純度試験		製剤均一性試験	放出性
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)
試験開始時	適合 (白色懸濁液、無色上澄液)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
1 ヶ月後	—	適合	適合	適合	—	適合	—	適合
3 ヶ月後	—	適合	適合	適合	—	適合	—	適合
6 ヶ月後	適合 (白色懸濁液、無色上澄液)	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合

試験項目	懸濁液の特性	抗酸化剤含量		平均容量	微生物限度試験	定量試験 (%)
規格	(9)	(10)	(11)	(12)	(13)	(14)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	101.8
1 ヶ月後	—	—	—	—	—	99.5
3 ヶ月後	—	—	—	—	—	100.8
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	100.9

(1) 白色～微黄色の懸濁液で、放置するとき、白色の沈殿物と無色～微黄色の上澄液に分離し、この沈殿物は穏やかに振り混ぜるとき、再び容易に懸濁状となる。

(2) 紫外可視吸光度測定法：波長 227～231nm 及び 298～302nm に吸収の極大を示し、256～260nm に吸収の極小を示す。

(3) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）：波数 1650cm<sup>-1</sup>、1621cm<sup>-1</sup>、1488cm<sup>-1</sup>、1382cm<sup>-1</sup>、1355cm<sup>-1</sup>、1316cm<sup>-1</sup>、1268cm<sup>-1</sup>、1245cm<sup>-1</sup>、810cm<sup>-1</sup> 及び 774cm<sup>-1</sup> 付近に吸収を認める。

(4) pH4.4～5.0

- (5) 3000rpm で5分間遠心分離するとき、上澄液の色は色の比較液（色の比較液 C3mL に水 3mL）より濃くない。
- (6) 類縁物質：試料溶液の 2,5-ジヒドロキシ安息香酸のピーク面積は、標準溶液のピーク面積の 1.5 倍より大きくない (0.15%以下)。また、その他の類縁物質はメサラジン、2,5-ジヒドロキシ安息香酸及びプラセボ由来のピーク以外の個々のピーク面積は 0.1%以下、それらのピークの合計面積は 0.5%以下である。
- (7) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。
- (8) 5分間、90%以上（水 900mL、パドル法、50rpm）
- (9) 30 秒以内に均一な懸濁液となり、静置するとき、完全な沈殿は 5 分以内には生じない。
- (10) 本品 1 個中のピロ亜硫酸ナトリウムの量は 80~100mg である。
- (11) 本品 1 個中のエデト酸ナトリウム水和物の量は 18~22mg である。
- (12) 本品 10 個をとり、メスシリンダーを用いて容量を測定するとき、平均容量は表示量（100mL）以上である。
- (13) 総好気性微生物数は  $10^3$ CFU/mL 以下、総真菌数は  $10^2$ CFU/mL 以下である。
- (14) 表示量の 95.0~105.0%

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、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。

◎無包装状態での安定性試験<sup>3)</sup>

試験条件：①室温に対する安定性試験：25±1℃/60±5%RH、30 日（遮光）

②光に対する安定性試験：総照度 33.6 万 lx・hr/25±1℃/60±5%RH (2000lx/hr)

試験項目：性状、pH、純度試験、懸濁液の特性、定量試験

試験項目	性状	pH	純度試験 (%)			懸濁液の特性	定量試験 (%)	
			(3)	(4)	(5)			
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	
試験開始時	適合	適合	適合	0.1	0.1	適合	101.7	
① 温度	1 日後	適合	適合	適合	0.0	0.1	適合	100.3
	7 日後	適合	適合	適合	0.0	0.1	適合	102.0
	30 日後	適合	適合	適合	0.1	0.4	適合	101.0
② 光	1 日後 (4.8 万 lx・hr)	不適合	適合	適合	0.0	0.0	適合	98.0
	7 日後 (33.6 万 lx・hr)	不適合	適合	適合	6.1 (不適合)	7.1 (不適合)	適合	100.9

- (1) 白色～微黄色の懸濁液で、放置するとき、白色の沈殿物と無色～微黄色の上澄液に分離し、この沈殿物は穏やかに振り混ぜるとき、再び容易に懸濁状となる。
- (2) pH4.4~5.0
- (3) 類縁物質：試料溶液の 2,5-ジヒドロキシ安息香酸のピーク面積は、標準溶液のピーク面積の 1.5 倍より大きくない (0.15%以下)。

- (4) その他の類縁物質はメサラジン、2,5-ジヒドロキシ安息香酸及びプラセボ由来のピーク以外の個々のピーク面積は 0.1%以下。
- (5) 個々のピーク面積の合計面積は 0.5%以下である。
- (6) 振り混ぜるとき、30 秒以内に均一な懸濁液となり、静置するとき、完全な沈殿は 5 分以内には生じない。
- (7) 表示量の 95.0~105.0%

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 9. 溶出性

【放出試験】<sup>4)</sup>

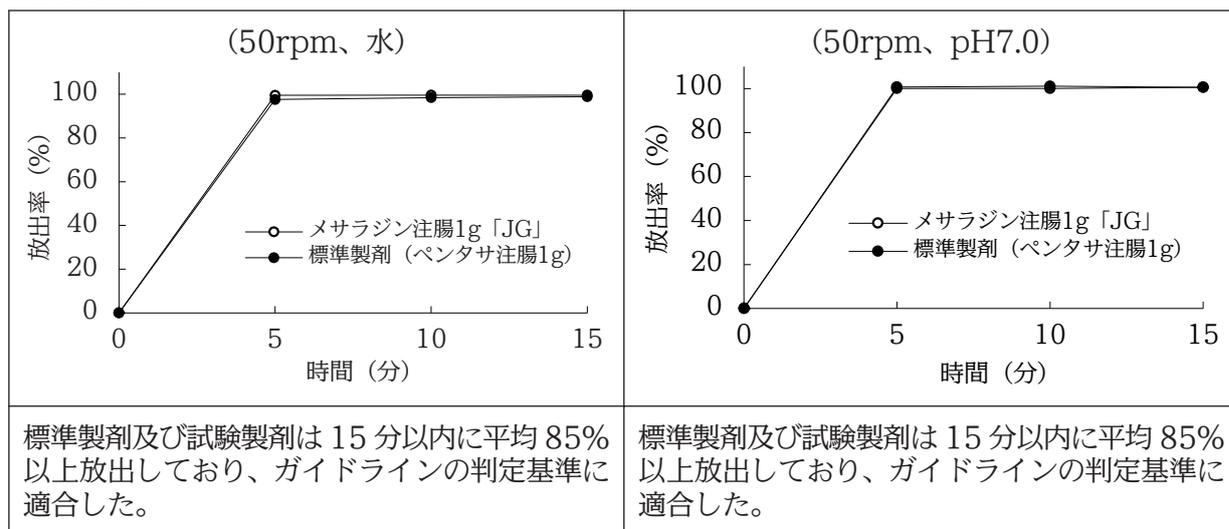
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）」に準じる。

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	水	日本薬局方 精製水
			pH7.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
		試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル		
分析法	紫外可視吸光度測定法			

### ・判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	水	試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上放出するか、又は 15 分における試験製剤の平均放出率が標準製剤の平均放出率±15%の範囲にある。
	pH7.0	

・試験結果



・放出挙動の類似性の判定 (平均放出率)

回転数 (rpm)	試験液	判定時点 (min)	平均放出率 (%)		判定
			標準製剤 (ペンタサ注腸 1g)	試験製剤 (メサラジン注腸 1g「JG」)	
50	水	15	98.83	99.56	適合
	pH7.0	15	100.53	100.58	適合

・結論

試験製剤と標準製剤の放出性を比較したところ、水及び pH7.0 共に 15 分以内に平均 85% 以上放出し、両製剤の放出挙動は類似していることが確認された。

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

「IV. 製剤に関する項目、-1. 剤形、(2) 製剤の外観及び性状」、「VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目、-11. 適用上の注意」の項参照

(2) 包装

100mL [プラスチック容器、脱酸素剤入り] ×7

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

アルミ袋 (ポリエチレン、アルミニウム)、薬液ボトル (ポリエチレン) / シール (アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム)、ノズルキャップ (ポリエチレン、ポリプロピレン)、ノズル延長用カテーテル (ポリ塩化ビニル、ポリプロピレン、ポリエチレン)、ストッパー (ポリエチレン)、脱酸素剤、紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

## 12. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

---

### 1. 効能又は効果

潰瘍性大腸炎（重症を除く）

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### 5. 効能又は効果に関連する注意

脾彎曲部より口側の炎症には効果が期待できない。[16.8 参照]

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

通常、成人には1日1個（メサラジンとして1g）を、直腸内注入する。なお、年齢、症状により適宜減量する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

#### 7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 本剤をメサラジン経口剤と併用する場合には、メサラジンとしての総投与量が増加することを考慮し、特に肝又は腎機能の低下している患者並びに高齢者等への投与に際しては十分に注意すること。併用時に異常が認められた場合には、減量又は中止する等の適切な処置を行うこと。[9.2.2、9.3.2、9.8 参照]

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

##### 用量（濃度）比較試験（海外第Ⅱ相試験）

アメリカの18施設で活動期の軽～中等症の潰瘍性大腸炎患者を対象に、プラセボ対照の二重盲検比較試験（解析症例計287例）が実施された。メサラジン注腸剤の用量は1、2、4g/100mL<sup>注</sup>で、1日1回、8週間投与した<sup>5,6)</sup>。

##### ① 有効性

・医師による概括判定

改善効果を認めた患者がプラセボ群では27%であったのに対し、1g/100mL群では67%、2g/100mL群では65%、4g/100mL群では75%であり、いずれの用量でもプラセボに対し有意に高い治療効果を示した。しかし、メサラジン注腸剤群間での有意な差は認められなかった。

・内視鏡スコア

プラセボ群では 1.8 ポイントの改善であったのに対し、1g/100mL 群では 5.8 ポイント、2g/100mL 群では 5.9 ポイント、4g/100mL 群では 6.4 ポイントの改善といずれも有意な改善効果を示した。しかし、メサラジン注腸剤群間には有意な差は認められなかった。

② 安全性

副作用がプラセボ群で 10%に見られたのに対し、メサラジン注腸剤群では 14%であり、用量依存的な変動も認められなかった。

注) 本剤の承認用量は 1 日 1 個 (メサラジンとして 1g) である。

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

ステロイド注腸剤との比較試験 (海外第Ⅲ相試験)

デンマークの 7 施設で活動期の軽～中等症の潰瘍性大腸炎患者を対象に、プレドニゾロン注腸剤との二重盲検比較試験 (解析症例 114 例) が実施された。メサラジン注腸剤の用量は 1g/100mL、プレドニゾロン注腸剤は 25mg/100mL で 1 日 1 回、4 週間投与した<sup>7)</sup>。

① 有効性

臨床判定及び S 状結腸鏡判定を総合した概括判定において、寛解又は改善率はメサラジン群 77%、プレドニゾロン群 72%であり、両薬剤間の有効性は同等であった。

② 安全性

本臨床試験に参加した 123 例において、メサラジン群 13 例 (21.3%)、プレドニゾロン群 6 例 (9.7%) に副作用が報告されたが、この差異は統計学的に有意ではなかった。メサラジン群で発現した副作用では腹部膨満及び仙痛が各 3 例 (4.9%) と高頻度であった。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査 (一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

## VI. 薬効薬理に関する項目

---

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

サラゾスルファピリジン

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

本剤の主な作用機序として炎症性細胞から放出される活性酸素を消去し、炎症の進展と組織の障害を抑制すること、及びロイコトリエン B<sub>4</sub> (LTB<sub>4</sub>) の生合成を抑制し、炎症性細胞の組織への浸潤を抑制することが考えられる<sup>8)</sup>。

また、その他の作用機序として、肥満細胞からのヒスタミン遊離抑制作用、血小板活性化因子 (PAF) の生合成抑制作用、インターロイキン-1 $\beta$  (IL-1 $\beta$ ) の産生抑制作用が一部関与している可能性が推察される<sup>9)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### ① 活性酸素に対する作用

*in vitro*においてフリーラジカル (DPPHL) 還元作用、過酸化水素消去作用、次亜塩素酸イオン消去作用、過酸化脂質抑制作用 (*in vitro*, *in vivo*) が認められた<sup>8)</sup>。

##### ② LTB<sub>4</sub>に対する作用

ラット好中球での LTB<sub>4</sub> 生合成を抑制した<sup>8)</sup> (*in vitro*)。

##### ③ 動物モデルに対する効果

ラットの酢酸誘発潰瘍性大腸炎モデルにおいてメサラジンの注腸投与をしたところ、6.25mg/kg から有意な潰瘍面積の抑制効果が認められた<sup>10)</sup>。

ラットの TNBS 誘発大腸炎モデルにおいてメサラジンの注腸投与をしたところ、25.0mg/kg で有意な障害抑制効果が認められた<sup>11)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

# VII. 薬物動態に関する項目

## 1. 血中濃度の推移

### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

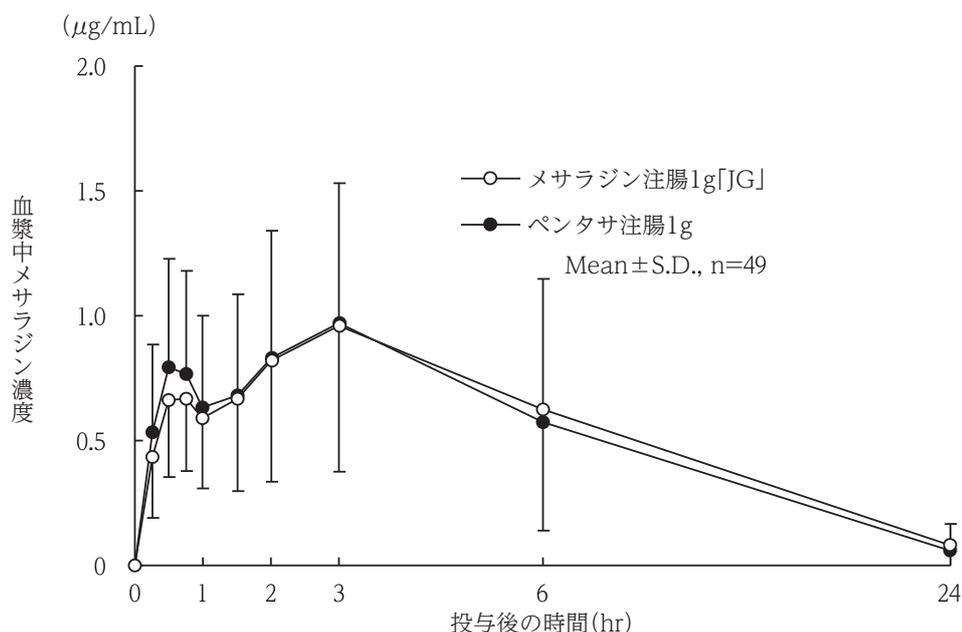
#### 【単回投与】

潰瘍性大腸炎患者 9 例にメサラジン注腸剤 100mL (メサラジンとして 1g 含有) を単回経直腸投与したとき、血漿中未変化体及び代謝物である N-アセチルメサラジン (アセチル体) は投与後 3 時間にそれぞれ  $0.35 \mu\text{g}/\text{mL}$  (中央値、範囲  $0.1 \sim 1.77 \mu\text{g}/\text{mL}$ ) 及び  $0.55 \mu\text{g}/\text{mL}$  (中央値、範囲  $0.33 \sim 1.49 \mu\text{g}/\text{mL}$ ) の最高血漿中濃度に達した<sup>12)</sup> (外国人データ)。

#### 【生物学的同等性試験】

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について (平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号)」に従う。

メサラジン注腸 1g 「JG」とペンタサ注腸 1g を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 個 (メサラジンとして 1g) 健康成人男性に絶食単回直腸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 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log (0.80) \sim \log (1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>13)</sup>。



#### <薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-24</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
メサラジン注腸 1g 「JG」	10.81 ± 6.91	1.12 ± 0.54	2.5 ± 1.8	6.3 ± 3.6*
ペンタサ注腸 1g	10.21 ± 5.82	1.14 ± 0.51	2.5 ± 1.8	6.1 ± 3.8**

(Mean ± S.D., n=49、T<sub>1/2</sub>; \*: n=47、\*\*: n=46)

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。

<同等性の判定結果>

	AUC <sub>0-24</sub>	Cmax
2 製剤の平均値の差	log (0.96369)	log (0.97545)
90%信頼区間	log (0.80702) ~log (1.15078)	log (0.87176) ~log (1.09147)

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 7. 相互作用」の項参照

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

健康成人男性

薬剤名	投与量	投与方法	kel (hr <sup>-1</sup> )
メサラジン注腸 1g 「JG」	1 個 (メサラジンとして 1 g)	絶食単回 直腸投与	0.19314±0.23727

(Mean±S.D., n=47)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

## (2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

## (3) 乳汁への移行性

該当資料なし

## (4) 髄液への移行性

該当資料なし

## (5) その他の組織への移行性

該当資料なし

## (6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

メサラジンは全身に分布する N-アセチルトランスフェラーゼによって生体内でアセチル体に代謝される<sup>14)</sup>。

### (2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

該当資料なし

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

## 7. 排泄

潰瘍性大腸炎患者 9 例にメサラジン注腸剤 100mL（メサラジンとして 1g 含有）を単回経直腸投与したときの投与後 48 時間までの排泄率は、尿中では未変化体は検出せず、アセチル体が 35%（中央値、範囲 20～79%）であり、糞中では未変化体が 26%（中央値、範囲 18～43%）、アセチル体が 2%（中央値、範囲 0.1～6%）であった<sup>12)</sup>（外国人データ）。

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

該当資料なし

## 10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

## 11. その他

<sup>99m</sup>Tc で標識したメサラジン注腸剤 1g/100mL を健康成人 8 名に経直腸投与したときの腸内での最遠到達部位と移行量を調べた。1 名では直腸と S 状結腸に滞留し、7 名では脾彎曲部まで達し、そのうち 4 名は横行結腸まで到達した<sup>15)</sup>（外国人データ）。

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

#### 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 重篤な腎障害のある患者 [9.2.1 参照]

2.2 重篤な肝障害のある患者 [9.3.1 参照]

2.3 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 [8.1 参照]

2.4 サリチル酸エステル類又はサリチル酸塩類に対する過敏症の既往歴のある患者 [交叉アレルギーを発現するおそれがある。]

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目 - 2. 効能又は効果に関連する注意」の項参照

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目 - 4. 用法及び用量に関連する注意」の項参照

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8. 重要な基本的注意

8.1 メサラジンにより過敏症状（発熱<sup>16)</sup>、腹痛<sup>17~21)</sup>、下痢<sup>17, 19)</sup>、好酸球増多<sup>22)</sup>等）が発現することがあり、また、潰瘍性大腸炎が悪化<sup>23, 24)</sup>することがあるため、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。[2.3 参照]

8.2 メサラジン錠において、間質性腎炎<sup>25~27)</sup>が報告されているため、投与中はクレアチニン等の腎機能をモニターする等、患者の状態を十分に観察すること。[9.2.2、11.1.3 参照]

8.3 再生不良性貧血<sup>28)</sup>、汎血球減少<sup>29)</sup>、無顆粒球症、血小板減少症<sup>30~35)</sup>があらわれることがあるので、投与期間中は血液検査等を行うこと。[11.1.4 参照]

8.4 メサラジン錠において、肝炎<sup>36~38)</sup>、肝機能障害、黄疸が報告されているため、投与中はAST、ALT等の肝機能をモニターする等、患者の状態を十分に観察すること。[9.3.2、11.1.5 参照]

8.5 膵炎<sup>39, 40)</sup>があらわれることがあるので、投与期間中は血清アミラーゼの検査等を行うこと。[11.1.6 参照]

## 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

### (1) 合併症・既往歴等のある患者

#### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1.1 サラゾスルファピリジンに対する過敏症のある患者

メサラジン錠をサラゾスルファピリジンでアレルギー症状がみられた患者に投与したところ、国内の臨床試験で 39 例中 3 例（7.7%）<sup>16, 17, 20, 41)</sup>、外国において 43 例中 2 例（4.7%）<sup>42)</sup> に同様のアレルギー症状が認められた。そのため、サラゾスルファピリジンでアレルギー症状がみられた患者に本剤を投与する場合は注意すること。

### (2) 腎機能障害患者

#### 9.2 腎機能障害患者

##### 9.2.1 重篤な腎障害のある患者

投与しないこと。腎障害がさらに悪化するおそれがある。[2.1 参照]

##### 9.2.2 腎機能の低下している患者（重篤な腎障害のある患者を除く）

排泄が遅延し副作用があらわれるおそれがある。[7.1、8.2 参照]

### (3) 肝機能障害患者

#### 9.3 肝機能障害患者

##### 9.3.1 重篤な肝障害のある患者

投与しないこと。肝障害がさらに悪化するおそれがある。[2.2 参照]

##### 9.3.2 肝機能の低下している患者（重篤な肝障害のある患者を除く）

代謝が遅延し副作用があらわれるおそれがある。[7.1、8.4 参照]

### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

### (5) 妊婦

#### 9.5 妊婦

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。メサラジンの動物実験（ラット）では催奇形性は認められていない<sup>43)</sup>。

### (6) 授乳婦

#### 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

### (7) 小児等

#### 9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

### (8) 高齢者

#### 9.8 高齢者

減量するなど慎重に投与すること。一般に生理機能（腎機能、肝機能等）が低下している。[7.1 参照]

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

### (2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
利尿剤 フロセミド スピロラクトン トリクロルメチアジド等 ステロイド剤 プレドニゾロン デキサメタゾン ベタメタゾン等	臨床検査値（尿量、尿中ナトリウム、カリウム及び塩素イオン）の変動に注意する。	動物実験（ラット）で、メサラジンの大量投与（300mg/kg）により、尿量及びこれらイオンの排泄増加がみられる <sup>44)</sup> 。
アザチオプリン メルカプトプリン	骨髄抑制があらわれるおそれがある <sup>45)</sup> 。	本剤は、チオプリンメチルトランスフェラーゼ活性を抑制するなど、これらの薬剤の代謝を阻害するとの報告がある <sup>46, 47)</sup> 。

## 8. 副作用

### 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。

#### (1) 重大な副作用と初期症状

##### 11.1 重大な副作用

###### 11.1.1 間質性肺疾患（頻度不明）

間質性肺疾患（好酸球性肺炎<sup>48)</sup>、肺炎<sup>49, 50)</sup>、肺臓炎<sup>51)</sup>、間質性肺炎<sup>52)</sup>等<sup>53~55)</sup>が報告されているので、発熱、咳、呼吸困難、胸部 X 線異常等があらわれた場合には、投与を中止し適切な処置を行うこと。

###### 11.1.2 心筋炎<sup>56~58)</sup>、心膜炎<sup>57, 59~61)</sup>、胸膜炎<sup>60, 61)</sup>（いずれも頻度不明）

胸水、胸部痛、心電図異常等があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

###### 11.1.3 間質性腎炎、ネフローゼ症候群<sup>62)</sup>、腎機能低下、急性腎障害（いずれも頻度不明）

[8.2 参照]

###### 11.1.4 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少症（いずれも頻度不明）

[8.3 参照]

###### 11.1.5 肝炎、肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

肝炎、AST、ALT、 $\gamma$ -GTP の上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

[8.4 参照]

###### 11.1.6 膵炎（頻度不明）

[8.5 参照]

11.1.7 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）

11.1.8 薬剤性過敏症症候群（頻度不明）

初期症状として発疹、発熱がみられ、更に肝機能障害、リンパ節腫脹、白血球増加、好酸球増多、異型リンパ球出現等を伴う遅発性の重篤な過敏症状があらわれることがある。なお、ヒトヘルペスウイルス 6（HHV-6）等のウイルスの再活性化を伴うことが多く、投与中止後も発疹、発熱、肝機能障害等の症状が再燃あるいは遷延化することがあるので注意すること。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	1%以上	0.01～1%未満	0.01%未満	頻度不明
皮膚	発疹、丘疹、蕁麻疹、紅斑		脱毛 <sup>63)</sup>	そう痒感
消化器	下痢、腹痛、嘔気、嘔吐	血便 <sup>注)</sup> 、下血 <sup>注)</sup> 、アミラーゼ上昇、腹部膨満感 <sup>注)</sup> 、便秘 <sup>注)</sup> 、粘液便 <sup>注)</sup>		食欲不振、口内炎、便の変色(黒色等)
肝臓			AST・ALT・γ-GTP・ALP・ビリルビンの上昇等の肝機能異常	
腎臓		尿着色 <sup>注)</sup>	クレアチニン・尿中NAG・尿中ミクログロブリンの上昇・尿蛋白等の腎機能異常	
血液			白血球減少、貧血、好酸球増多 <sup>22)</sup>	
その他	頭痛	CK 上昇 <sup>注)</sup>	筋肉痛、関節痛、ループス様症候群 <sup>64, 65)</sup>	発熱、浮腫、全身倦怠感、めまい、末梢神経障害 <sup>66)</sup> 、肛門部位疼痛、肛門部位のかゆみ、不快感、便意切迫、胸部痛、頸部痛、CRP 上昇

副作用頻度は、国内のペンタサ錠 250mg・500mg の臨床成績及び市販後調査結果、又は外国における市販後調査結果（経口剤、注腸剤、坐剤を区別していない）

注) 国内でペンタサ錠 250mg・500mg において認められた副作用

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

## 10. 過量投与

設定されていない

## 11. 適用上の注意

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 本剤はポリエチレン製の容器に入った液剤で、脱酸素剤とともに窒素充填したアルミの袋に入っている。使用直前に袋から取り出して使用するよう指導すること。[20. 参照]

#### 14.1.2 使用方法

(1) アルミ袋から取り出し、容器を上下によく振り混ぜたのち、ノズルキャップを装着する（ノズルキャップ装着時に容器を強く握りしめると、薬液が飛び出すことがあるので、軽く包み込むように持つこと）。

(2) 左側臥位になり、肛門からノズルをゆっくりと挿入する（直腸粘膜を傷つけるおそれがあるので、慎重に挿入すること）。

(3) ノズルを挿入後、容器を徐々に握りしめながら、薬液をゆっくりと注入する。

(4) 薬液を注入後、容器を握りしめたままゆっくりとノズルを抜き取る。

14.1.3 メサラジンは光及び酸素の影響で分解されやすいため、アルミ袋を開封したものは保存できない。[20. 参照]

14.1.4 本品は白色～微黄色の懸濁液である。メサラジンは酸化により分解されやすく有色の分解物を生成するため、上澄液が無色～微黄色の範囲を超えて着色したものは使用しないこと。

#### 14.2 薬剤投与後の注意

メサラジン又はその代謝物を含む尿は、次亜塩素酸塩を含有する漂白剤と接触することにより赤褐色に変色することがある。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

# IX. 非臨床試験に関する項目

---

## 1. 薬理試験

### (1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし

### (3) その他の薬理試験

該当資料なし

## 2. 毒性試験

### (1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

### (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

### (3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

### (4) がん原性試験

該当資料なし

### (5) 生殖発生毒性試験

「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 特定の背景を有する患者に関する注意、(5) 妊婦」の項参照

### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

### (7) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤	メサラジン注腸 1g 「JG」	処方箋医薬品*
有 効 成 分	メサラジン	該当しない

※注意－医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間

3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

#### 20. 取扱い上の注意

アルミ袋開封後は、速やかに使用すること。[14.1.1、14.1.3 参照]

### 5. 患者向け資料

- ・くすりのしおり：有り
- ・患者様用指導箋：有り

メサラジン注腸 1g 「JG」 ご使用時の注意

[https://medical.nihon-generic.co.jp/uploadfiles/materials/MESAE\\_GUIDE2.pdf](https://medical.nihon-generic.co.jp/uploadfiles/materials/MESAE_GUIDE2.pdf)

メサラジン注腸 1g 「JG」 使用説明書

[https://medical.nihon-generic.co.jp/uploadfiles/materials/MESAE\\_GUIDE3\\_1.pdf](https://medical.nihon-generic.co.jp/uploadfiles/materials/MESAE_GUIDE3_1.pdf)

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：ペンタサ注腸 1g/坐剤 1g/錠 250mg/500mg/顆粒 94%、メサラジン徐放錠 250mg/500mg 「JG」

同 効 薬：コルチゾン酢酸エステル、サラゾスルファピリジン、デキサメタゾン、トリアムシノロン、ブデソニド、プレドニゾロン、プレドニゾロンリン酸エステルナトリウム、ベタメタゾン、メチルプレドニゾロン

### 7. 国際誕生年月日

該当しない

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
メサラジン注腸 1g 「JG」	2012年2月15日	22400AMX00550000	2012年6月22日	2012年6月22日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
メサラジン注腸 1g「JG」	2399715X1031	2399715X1031	121671401	622167101

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品には該当しない。

# X I . 文献

---

## 1. 引用文献

- 1)ジェネリック医薬品品質情報検討会；医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）<http://www.nihs.go.jp/drug/ecqaged/bluebook/list.html>（2023/4/18 アクセス）
- 2)社内資料：加速試験
- 3)社内資料：無包装状態での安定性試験
- 4)社内資料：放出試験
- 5)Hanauer, S.B. : Inflamm. Bowel. Dis. 1998 ; 4 : 79-83
- 6)用量反応性及び比較試験（海外第Ⅱ相試験）（ペンタサ注腸：2002年10月8日承認、申請資料概要 ト.1. (2) 2)
- 7)Danish 5-ASA Group : Dig. Dis. Sci. 1987 ; 32 (6) : 598-602
- 8)中丸幸一 他：日本薬理学雑誌 1994 ; 104 : 447-457
- 9)藤原豊博：薬理と治療 2010 ; 38 (9) : 787-804
- 10)小島僚太郎 他：日本薬理学雑誌 2001 ; 118 : 123-130
- 11)動物モデルにおけるメサラジンの障害抑制効果（ペンタサ注腸：2002年10月8日承認、申請資料概要 ホ.1. (1)）
- 12)Bondesen, S. et al. : Scand. J. Gastroenterol. 1984 ; 19 : 677-682
- 13)社内資料：生物学的同等性試験
- 14)第十八改正 日本薬局方解説書 廣川書店 2021 ; C5626-C5633
- 15)Brown, J. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther. 1997 ; 11 : 685-691
- 16)棟方昭博 他：薬理と治療 1994 ; 22 (Suppl.10) : S2585-S2605
- 17)棟方昭博 他：薬理と治療 1994 ; 22 (Suppl.10) : S2509-S2530
- 18)棟方昭博 他：薬理と治療 1994 ; 22 (Suppl.10) : S2531-S2554
- 19)棟方昭博 他：薬理と治療 1994 ; 22 (Suppl.10) : S2555-S2583
- 20)棟方昭博 他：薬理と治療 1994 ; 22 (Suppl.10) : S2607-S2624
- 21)Miner, P. et al. : Dig. Dis. Sci. 1995 ; 40 (2) : 296-304
- 22)Morice, A.H. et al. : Lancet. 1997 ; 350 : 1105
- 23)Kapur, K.C. et al. : Gut. 1995 ; 37 : 838-839
- 24)竹下宗範 他：第74回日本消化器病学会九州支部例会抄録 1999 ; 74 : 65
- 25)Mehta, R.P. : CMAJ. 1990 ; 143 (10) : 1031-1032
- 26)Witte, T. et al. : Nephron. 1994 ; 67 : 481-482
- 27)Smilde, T.J. et al. : Ned. Tijdschr. Geneesk. 1994 ; 138 (51) : 2557-2561
- 28)Otsubo, H. et al. : Int. J. Hematol. 1998 ; 68 : 445-448
- 29)Kotanagi, H. et al. : J. Gastroenterol. 1998 ; 33 : 571-574
- 30)Casellas, F. et al. : J. Clin. Gastroenterol. 1996 ; 22 (2) : 160-161
- 31)Daneshmend, T.K. : Lancet. 1991 ; 337 : 1297-1298
- 32)Jick, H. et al. : Pharmacotherapy. 1995 ; 15 (2) : 176-181
- 33)Committee on Safety of Medicines : Current Problems in Pharmacovigilance. 1995 ; 21 : 5-6
- 34)Bodin, F. et al. : Therapie. 1991 ; 46 : 341
- 35)Wyatt, S. et al. : Lancet. 1993 ; 341 : 1476

- 36)Hautekeete, M.L. et al. : Gastroenterology. 1992 ; 103 : 1925-1927
- 37)Stoschus, B. et al. : J. Hepatol. 1997 ; 26 : 425-428
- 38)Deltenre, P. et al. : Gut. 1999 ; 44 : 886-888
- 39)Besseau, M. et al. : Gastroenterol. Clin. Biol. 1991 ; 15 : 174-175
- 40)Sachedina, B. et al. : Ann. Intern. Med. 1989 ; 110 (6) : 490-492
- 41)棟方昭博 他 : 薬理と治療 1994 ; 22 (Suppl.10) : S2625-S2638
- 42)Mulder, C.J.J. et al. : Ann. Intern. Med. 1988 ; 106 (6) : 911-912
- 43)太田隆雄 他 : 応用薬理 1994 ; 47 (6) : 513-522
- 44)田中和彦 他 : 応用薬理 1994 ; 48 (4) : 225-238
- 45)de Boer, N.K.H. et al. : Am. J. Gastroenterol. 2007 ; 102 : 2747-2753
- 46)Szumlanski, C.L. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol. 1995 ; 39 : 456-459
- 47)Dewit, O. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther. 2002 ; 16 : 79-85
- 48)Honeybourne, D. : BMJ. 1994 ; 308 : 533-534
- 49)Welte, T. et al. : Lancet. 1991 ; 338 : 1273
- 50)Lagler, U. et al. : Schweiz. Med. Wochenschr. 1992 ; 122 : 1332-1334
- 51)Bitton, A. et al. : Am. J. Gastroenterol. 1996 ; 91 : 1039-1040
- 52)Declerck, D. et al. : Rev. Mal. Respir. 1994 ; 11 : 292-293
- 53)Muzzi, A. et al. : Chest. 1995 ; 108 (4) : 1181
- 54)Reinoso, M.A. et al. : Chest. 1992 ; 101 (5) : 1469-1471
- 55)le Gros, V. et al. : BMJ. 1991 ; 302 : 970
- 56)Kristensen, K.S. et al. : Lancet. 1990 ; 335 : 605
- 57)Agnholt, J. et al. : Lancet. 1989 ; 1 : 1135
- 58)増谷学 他 : 日本消化器病学会雑誌 1999 ; 96 (5) : 524-529
- 59)Heresbach, D. et al. : Gastroenterol. Clin. Biol. 1994 ; 18 : 782-785
- 60)Gujral, N. et al. : Dig. Dis. Sci. 1996 ; 41 (3) : 624-626
- 61)Iaquinto, G. et al. : Ital. J. Gastroenterol. 1994 ; 26 : 145-147
- 62)Skhiri, H. et al. : Nephron. 1998 ; 79 : 236
- 63)Netzer, P. : Schweiz. Med. Wochenschr. 1995 ; 125 : 2438-2442
- 64)Dent, M.T. : BMJ. 1992 ; 305 : 159
- 65)Timsit, M.A. et al. : Rev. Rhum. Engl. Ed. 1997 ; 64 (10) : 586-588
- 66)Woodward, D.K. : BMJ. 1989 ; 299 : 1224

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当しない

## XIII. 備考

---

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

#### (1) 粉碎

該当資料なし

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

### 2. その他の関連資料

- ・メサラジン注腸 1g「JG」使用説明書（下敷き）

[https://medical.nihon-generic.co.jp/uploadfiles/materials/MESAE\\_GUIDE3\\_2.pdf](https://medical.nihon-generic.co.jp/uploadfiles/materials/MESAE_GUIDE3_2.pdf)

*Memo*

*Memo*

