

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2013に準拠して作成

潰瘍性大腸炎・クローン病治療剤
日本薬局方 メサラジン徐放錠
メサラジン錠 250mg「日医工」
メサラジン錠 500mg「日医工」
Mesalazine

剤形	素錠（徐放錠）		
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	錠 250mg：1錠中メサラジン 250mg を含有する。 錠 500mg：1錠中メサラジン 500mg を含有する。		
一般名	和名：メサラジン 洋名：Mesalazine		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日		錠 250mg	錠 500mg
	承認年月日	2009年 1月 8日	2012年 2月 15日
	薬価基準収載	2009年 5月 15日	2012年 6月 22日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ http://www.nichiiko.co.jp/		

本IFは2018年6月改訂（第10版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ

<http://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、（独）医薬品医療機器総合機構のホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公式サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」（以下、「IF記載要領2013」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

【IFの発行】

- ① 「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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

IFを薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	VI. 薬効薬理に関する項目	14
1. 開発の経緯	1	1. 薬理学的に関連のある化合物又は化合物群	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 薬理作用	14
II. 名称に関する項目	2	VII. 薬物動態に関する項目	16
1. 販売名	2	1. 血中濃度の推移・測定法	16
2. 一般名	2	2. 薬物速度論的パラメータ	18
3. 構造式又は示性式	2	3. 吸収	18
4. 分子式及び分子量	2	4. 分布	18
5. 化学名（命名法）	2	5. 代謝	18
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	2	6. 排泄	19
7. CAS 登録番号	2	7. トランスポーターに関する情報	19
III. 有効成分に関する項目	3	8. 透析等による除去率	19
1. 物理化学的性質	3	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	20
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	1. 警告内容とその理由	20
3. 有効成分の確認試験法	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	20
4. 有効成分の定量法	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	20
IV. 製剤に関する項目	4	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	20
1. 剤形	4	5. 慎重投与内容とその理由	20
2. 製剤の組成	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	20
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	4	7. 相互作用	21
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	8. 副作用	21
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	9. 高齢者への投与	22
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	23
7. 溶出性	8	11. 小児等への投与	23
8. 生物学的試験法	11	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	23
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	11	13. 過量投与	23
10. 製剤中の有効成分の定量法	11	14. 適用上の注意	23
11. 力価	11	15. その他の注意	23
12. 混入する可能性のある夾雑物	11	16. その他	23
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	11	IX. 非臨床試験に関する項目	24
14. その他	11	1. 薬理試験	24
V. 治療に関する項目	12	2. 毒性試験	24
1. 効能又は効果	12	X. 管理的事項に関する項目	25
2. 用法及び用量	12	1. 規制区分	25
3. 臨床成績	12		

2. 有効期間又は使用期限	25
3. 貯法・保存条件	25
4. 薬剤取扱い上の注意点	25
5. 承認条件等	25
6. 包装	25
7. 容器の材質	25
8. 同一成分・同効薬	25
9. 国際誕生年月日	25
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	25
11. 薬価基準収載年月日	25
12. 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	26
13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	26
14. 再審査期間	26
15. 投与期間制限医薬品に関する情報	26
16. 各種コード	26
17. 保険給付上の注意	26
X I. 文献	27
1. 引用文献	27
2. その他の参考文献	27
X II. 参考資料	27
1. 主な外国での発売状況	27
2. 海外における臨床支援情報	27
X III. 備考	27
付表 1—1	28
付表 1—2	29
付表 1—3	30

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、メサラジンを有効成分とする潰瘍性大腸炎（重症を除く）、クローン病の治療剤である。

「メサラジン錠 250mg「日医工」」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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、2009年1月8日に承認を取得、2009年5月15日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

「メサラジン錠 250mg「日医工」」は2010年1月15日に「潰瘍性大腸炎における活動期」及び「潰瘍性大腸炎における小児」及び「クローン病における小児」に関する用法・用量が追加された。

又、規格揃えとして「メサラジン錠 500mg「日医工」」の開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験等を実施し、2012年2月15日に承認を取得、2012年6月22日から販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤はメサラジンを有効成分とするマルチプルユニット型の徐放性製剤である。
- (2) 重大な副作用（頻度不明）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、急性腎不全、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、膵炎が報告されている。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

メサラジン錠 250mg「日医工」

メサラジン錠 500mg「日医工」

(2) 洋名

Mesalazine

(3) 名称の由来

一般名より

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

メサラジン (JAN)

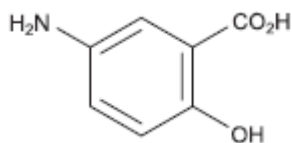
(2) 洋名 (命名法)

Mesalazine (JAN)

(3) ステム

サリチル酸誘導体の潰瘍性大腸炎治療薬：-salazine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₇H₇NO₃

分子量：153.14

5. 化学名 (命名法)

5-Amino-2-hydroxybenzoic acid (IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

別名：Mesalamine

略号：5-ASA

7. CAS 登録番号

89-57-6

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。

(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

該当資料なし

(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

(1) 紫外可視吸光度測定法

本品の塩酸試液溶液につき吸収スペクトルを測定し，本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき，両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

(2) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い，本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき，両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

4. 有効成分の定量法




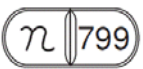


電位差滴定法

本品を熱湯に溶かし，水酸化ナトリウム液で滴定する。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別, 外観及び性状

販売名	色調 剤形	形 状			本体コード 包装コード
		質量(mg)	直径(mm)	厚さ(mm)	
メサラジン錠 250mg「日医工」	灰白色～淡灰黄色の 斑点入りの白色～淡 黄色の素錠で、片面に 割線を有する。	 375	 9.5	 4.6	本体： n 766 包装： n 766
メサラジン錠 500mg「日医工」	灰白色～淡灰黄色の 斑点入りの白色～淡 黄色の素錠で割線を 有する。	 750	 7.3×17.1	 5.5	本体： n 799 包装： n 799

(2) 製剤の物性

(「IV-4.製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

(3) 識別コード

(「IV-1.(1)剤形の区別, 外観及び性状」の項参照)

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

メサラジン錠 250mg「日医工」：1錠中メサラジン 250mg を含有する。

メサラジン錠 500mg「日医工」：1錠中メサラジン 500mg を含有する。

(2) 添加物

メサラジン錠 250mg「日医工」, メサラジン錠 500mg「日医工」

添加目的	添 加 物
賦形剤	セルロース
結合剤	ポビドン
コーティング剤	エチルセルロース
滑沢剤	タルク, ステアリン酸マグネシウム
その他	その他 1 成分

(3) その他

該当記載事項なし

3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

(1) 加速試験

本品につき加速試験（40℃，75%RH，6 ヶ月）を行った結果，メサラジン錠 250mg「日医工」及びメサラジン錠 500mg「日医工」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。

◇メサラジン錠 250mg「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目<規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <灰白色～淡灰黄色の斑点入りの白色～淡黄色の素錠で、割線を有する>	MES250TR-1 MES250TR-2 MES250TR-3	適合	同左	同左	同左
確認試験 (呈色反応，呈色沈殿反応， 紫外可視吸光度測定法)	MES250TR-1 MES250TR-2 MES250TR-3	適合	同左	同左	同左
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) <15.0%以下>	MES250TR-1 MES250TR-2 MES250TR-3	4.2 3.5 5.5	—	—	5.4 6.8 3.9
溶出性(%)① <3 時間，10～40%>	MES250TR-1 MES250TR-2 MES250TR-3	23.9～32.4 17.9～26.9 16.7～29.2	25.3～36.5 15.9～32.4 20.0～29.8	21.4～35.8 18.6～32.2 17.8～34.2	24.1～32.6 18.6～26.5 19.8～25.6
溶出性(%)② <6 時間，30～60%>	MES250TR-1 MES250TR-2 MES250TR-3	43.8～59.3 31.7～44.8 33.0～48.9	45.6～59.9 35.9～50.2 35.0～50.4	43.5～58.7 33.7～51.2 32.8～55.2	43.7～57.9 31.9～45.1 33.4～43.4
溶出性(%)③ <24 時間，80%以上>	MES250TR-1 MES250TR-2 MES250TR-3	89.7～107.3 80.6～ 95.7 84.1～ 99.0	93.1～105.4 82.6～ 95.9 86.0～ 97.9	92.4～103.0 81.9～ 95.9 80.3～102.4	92.4～103.6 80.1～ 96.9 82.1～ 94.1
含量 (%) ※ <95.0～105.0%>	MES250TR-1 MES250TR-2 MES250TR-3	100.1 99.9 100.0	100.0 100.3 99.8	101.0 100.0 100.5	100.7 99.5 101.2

※：表示量に対する含有率 (%)

◇メサラジン錠 500mg「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目<規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <灰白色～淡灰黄色の斑点入りの白色～淡黄色の素錠で、割線を有する>	KK0201 A014 AP1101	適合	同左	同左	同左
確認試験 (定性反応, 定性反応, 紫外可視吸光度測定法)	KK0201 A014 AP1101	適合	—	—	適合
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) <15.0%以下>	KK0201 A014 AP1101	4.2 2.9 3.6	—	—	4.2 2.6 4.2
溶出性(%)① <3 時間, 10～40%>	KK0201 A014 AP1101	22.0～28.4 27.9～30.2 25.9～34.0	21.3～28.6 23.2～32.7 23.4～31.2	25.8～27.6 26.3～30.4 21.4～29.7	23.5～28.2 25.7～31.0 26.4～30.1
溶出性(%)② <6 時間, 30～60%>	KK0201 A014 AP1101	37.9～46.6 46.6～49.7 43.3～55.4	37.1～48.9 39.9～55.3 40.6～54.8	43.4～47.3 44.5～50.6 37.0～49.3	40.2～45.5 43.4～52.2 44.4～50.6
溶出性(%)③ <24 時間, 80%以上>	KK0201 A014 AP1101	81.8～89.2 84.4～88.5 83.0～90.8	76.7 ^{※2} ～90.1 78.4 ^{※3} ～98.1 80.1～95.4	87.3～92.3 84.5～92.0 80.1～91.6	82.8～91.1 82.7～91.7 84.6～91.7
含量 (%) ^{※1} <95.0～105.0%>	KK0201 A014 AP1101	98.0 98.2 103.3	96.8 99.0 102.0	99.1 98.5 100.7	100.9 97.3 101.4

※1: 表示量に対する含有率 (%)

※2: 10/12 錠適合のため, 規格に適合

※3: 11/12 錠適合のため, 規格に適合

(2) 無包装の安定性試験

◇メサラジン錠 500mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光, 気密容器]

測定項目	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 <灰白色～淡灰黄色の斑点入りの白色～淡黄色の素錠で、割線を有する>	IN150	適合	同左	同左	同左	わずかに斑点の 灰色が濃くなる (規格内) ^{※2}
溶出性 (%) <3 時間: 10～40%> <6 時間: 30～60%> <24 時間: 80%以上>	IN150	23.8～33.2 42.4～55.6 86.2～99.9	24.3～31.5 43.0～52.7 90.1～97.3	24.1～29.1 42.7～49.6 82.7～91.0	24.3～30.4 43.4～51.4 85.2～96.3	23.4～27.1 41.0～47.6 82.7～92.3
含量 (%) ^{※1} <95.0～105.0%>	IN150	100.8	99.4	100.7	99.6	99.4
(参考値) 硬度 (N) <19.6N 以上>	IN150	196	178	196	177	184

※1: 表示量に対する含有率 (%)

※2: 外観変化を認めたが規格の範囲内であった。 変化あり: 太字

◇メサラジン錠 500mg「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光, 開放]

測定項目	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2週	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 <灰白色～淡灰黄色の斑点入りの白色 ～淡黄色の素錠で、割線を有する>	IN150	適合	斑点の灰黄色 が濃くなる (規格内) ※2	斑点の灰黄色 が濃くなる (規格内) ※2	斑点の灰黄色 が濃くなる (規格内) ※2	斑点の灰黄色 が濃くなる (規格外)
溶出性 (%) <3時間: 10～40%> <6時間: 30～60%> <24時間: 80%以上>	IN150	23.8～33.2 42.4～55.6 86.2～99.9	21.2～24.9 38.6～44.1 83.2～90.4	23.2～33.2 41.2～56.0 83.0～99.2	21.5～32.3 37.2～53.4 79.9～94.4	18.5～25.5 32.6～42.4 78.5～90.4
含量 (%) ※1 <95.0～105.0%>	IN150	100.8	99.7	98.7	100.3	101.0
(参考値) 硬度 (N) <19.6N 以上>	IN150	196	92 (規格内) ※3	63 (規格内) ※3	65 (規格内) ※3	73 (規格内) ※3

※1: 表示量に対する含有率 (%) ※2: 外観変化を認めたが規格の範囲内であった。

※3: 30%以上の硬度変化を認めたが参考値(19.6N)以上であった。 変化あり: 太字

◇メサラジン錠 500mg「日医工」 無包装 室温・曝光 [D65光源, 気密容器]

測定項目	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40万 Lx・hr	80万 Lx・hr	120万 Lx・hr
性状 <灰白色～淡灰黄色の斑点入りの白色 ～淡黄色の素錠で、割線を有する>	IN150	適合	斑点が茶色 になる (規格内) ※2	斑点が茶色 になる (規格外)	斑点が茶色 になる (規格外)
溶出性 (%) <3時間: 10～40%> <6時間: 30～60%> <24時間: 80%以上>	IN150	23.8～33.2 42.4～55.6 86.2～99.9	23.4～29.1 42.3～50.8 86.2～95.1	24.1～27.7 41.5～46.6 90.0～95.8	22.0～ 32.2 39.1～ 55.6 82.2～100.3
含量 (%) ※1 <95.0～105.0%>	IN150	100.8	100.6	101.5	99.7
(参考値) 硬度 (N) <19.6N 以上>	IN150	196	186	196	192

※1: 表示量に対する含有率 (%) ※2: 外観変化を認めたが規格の範囲内であった。 変化あり: 太字

本試験は、「(社)日本病院薬剤師会:錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申),平成11年8月20日」を参考に実施した。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当しない

7. 溶出性

(1) 溶出規格

メサラジン錠 250mg「日医工」及びメサラジン錠 500mg「日医工」は、日本薬局方医薬品各条に定められたメサラジン徐放錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

(試験液に溶出試験第2液 900mLを用い、パドル法により、50rpmで試験を行う。)

溶出規格

規定時間	溶出率
3 時間	10～40%
6 時間	30～60%
24 時間	80%以上

(2) 溶出試験²⁾

<メサラジン錠 250mg「日医工」>

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)

試験条件

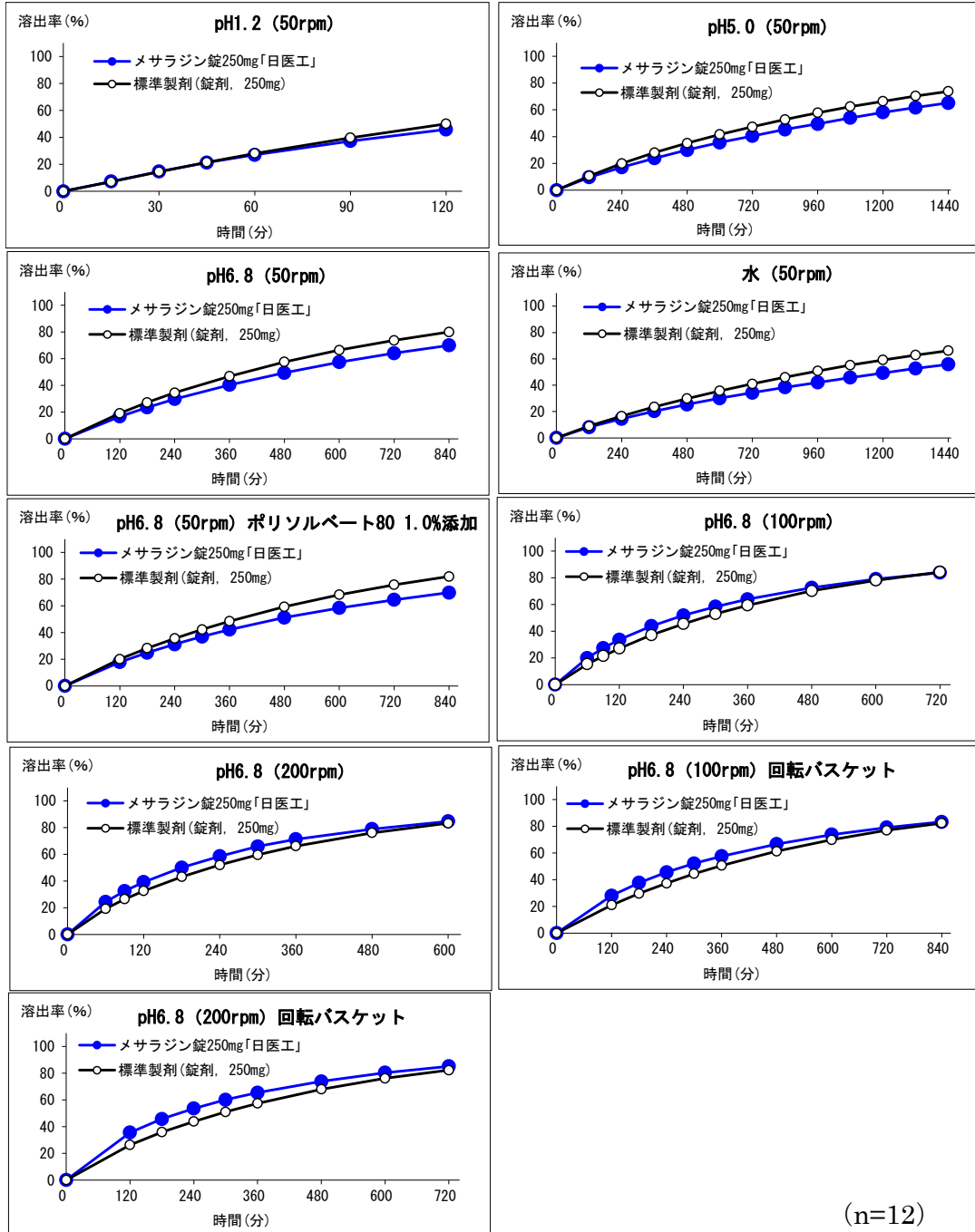
装置	回転数 (rpm)	試験液 (pH)
パドル法	50	1.2, 5.0, 6.8, 水 6.8 ポリソルベート 80, 1.0(W/V)%添加
	100	6.8
	200	6.8
回転バスケット法	100	6.8
	200	6.8

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤が 120 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。
- ・ pH5.0 (50rpm) では、f2 関数の値は 55 以上であった。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 30%, 50%, 80%付近の 3 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。
- ・ 水 (50rpm) では、f2 関数の値は 55 以上であった。
- ・ pH6.8 (50rpm, ポリソルベート 80 1.0%添加) では、f2 関数の値は 50 以上であった。
- ・ pH6.8 (100rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 30%, 50%, 80%付近の 3 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (200rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 30%, 50%, 80%付近の 3 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (100rpm, 回転バスケット法) では、標準製剤の平均溶出率が 30%, 50%, 80%付近の 3 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (200rpm, 回転バスケット法) では、標準製剤の平均溶出率が 30%, 50%, 80%付近の 3 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。

以上の結果より、本品は標準製剤の平均溶出率と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

(3) 含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験³⁾

<メサラジン錠 500mg「日医工」>

メサラジン錠 500mg「日医工」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）」に基づき、メサラジン錠 250mg「日医工」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

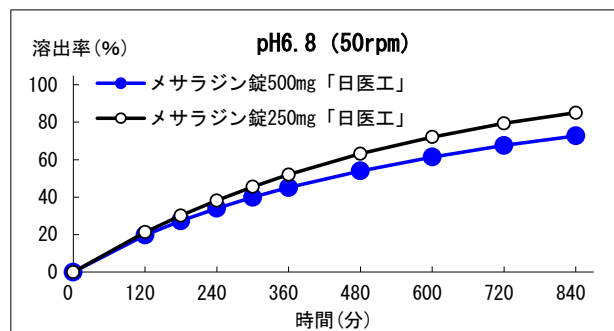
回転数及び試験液：50rpm (pH6.8)

[判定]

f2 関数の値は 50 以上であった。また、最終比較時点（720 分）における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 20\%$ の範囲を超えるものがなかった。

以上、メサラジン錠 500mg「日医工」の溶出挙動を標準製剤（メサラジン錠 250mg「日医工」）と比較した結果、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合したことから、生物学的に同等とみなされた。

(溶出曲線)



(n=12)

8. 生物学的試験法

該当資料なし

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

紫外可視吸光度測定法

本品を粉末とし、リン酸を加えて攪拌してろ過する。ろ液につき吸収スペクトルを測定する時、波長 227～231nm 及び 298～302nm に吸収の極大を示す。

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：メタノール，リン酸，ラウリル硫酸ナトリウム，テトラブチルアンモニウム硫酸水素塩，水混液

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

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），クローン病

2. 用法及び用量

潰瘍性大腸炎

通常，成人にはメサラジンとして1日1500mgを3回に分けて食後経口投与するが，寛解期には，必要に応じて1日1回の投与とすることができる。なお，年齢，症状により適宜増減するが，1日2250mgを上限とする。ただし，活動期には，必要に応じて1日4000mgを2回に分けて投与することができる。

通常，小児にはメサラジンとして1日30～60mg/kgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減するが，1日2250mgを上限とする。

クローン病

通常，成人にはメサラジンとして1日1500mg～3000mgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜減量する。

通常，小児にはメサラジンとして1日40～60mg/kgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

- (1) 1日4000mgへの増量は，再燃寛解型で中等症の潰瘍性大腸炎患者（直腸炎型を除く）に対して行うよう考慮すること。
- (2) 1日4000mgを，8週間を超えて投与した際の有効性は確立していないため，患者の病態を十分観察し，漫然と1日4000mgの投与を継続しないこと。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

サラゾスルファピリジン等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁴⁾

作用機序は未確定であるが、*in vitro*において、過酸化水素消去作用、一重項酸素消去作用、1,1-ジフェニル-2-ピクリルヒドラジルラジカル還元能、脂質過酸化抑制作用及びロイコトリエン B₄ 産生抑制作用が認められたという。

(2) 薬効を裏付ける試験成績⁵⁾

生物学的同等性試験

酢酸誘発潰瘍性大腸炎モデル及び TNB^{*}誘発大腸炎モデル（いずれもラット，1 群 15 匹）を用いて肛門～結腸部における障害抑制作用を検討し，統計解析を行った結果，メサラジン錠 250mg「日医工」は標準製剤（錠剤，250mg）と生物学的同等性が確認された。

(※TNB：2,4,6-trinitrobenzenesulfonic acid)

<酢酸誘発潰瘍性大腸炎モデル>

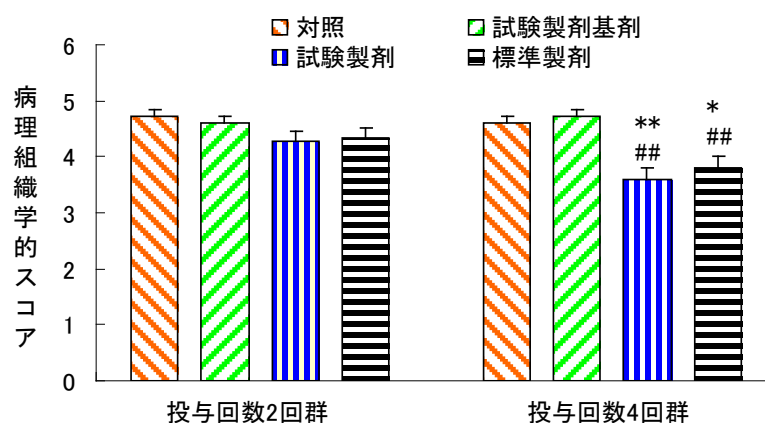


図1 酢酸誘発潰瘍性大腸炎ラットの病理組織学的スコア

表1 酢酸誘発潰瘍性大腸炎ラットの病理組織学的スコア

群	投与量 (mg/kg/day)	n 数	スコア	
			2 ³⁾	4 ³⁾
対照	—	15	4.73±0.12	4.60±0.13
試験製剤基剤	25 ¹⁾ (0 ²⁾)	15	4.60±0.13	4.73±0.12
試験製剤	75 ¹⁾ (50 ²⁾)	15	4.27±0.18	3.60±0.19**、##
標準製剤	75 ¹⁾ (50 ²⁾)	15	4.33±0.19	3.80±0.20*、##

それぞれの数値は，15 例の平均値±標準誤差を示す。

1) 製剤の投与量を示す。 2) メサラジンの投与量を示す。 3) 投与回数(回)を表す。

対照群と比較して試験製剤基剤群は Tukey の多重比較検定で有意差なし。

** p<0.01, * p<0.05, 対照群と比較して Tukey の多重比較検定で有意差あり。

p<0.01, 試験製剤基剤群と比較して Tukey の多重比較検定で有意差あり。

試験製剤及び標準製剤群間と Tukey の多重比較検定で有意差なし

<TNB 誘発大腸炎モデル>

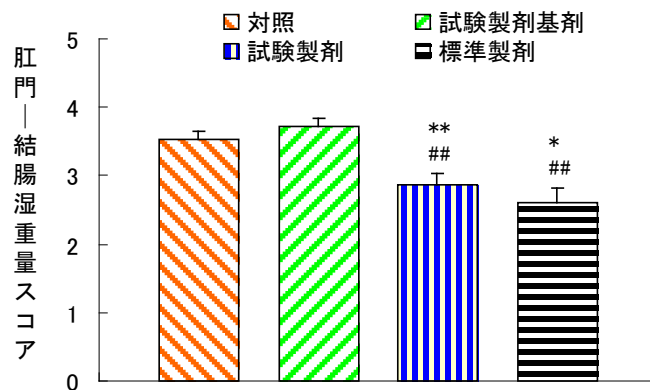


図2 TNB 誘発大腸炎ラットの腸管重量によるスコア

表2 TNB 誘発大腸炎ラットの腸管重量によるスコア

群	投与量 (mg/kg/day)	n 数	スコア
対照	—	15	3.53±0.13
試験製剤基剤	25 ¹⁾ (0 ²⁾)	15	3.73±0.12
試験製剤	75 ¹⁾ (50 ²⁾)	15	2.87±0.17**、##
標準製剤	75 ¹⁾ (50 ²⁾)	15	2.60±0.21*、##

それぞれの数値は、15 例の平均値±標準誤差を示す。

1) 製剤の投与量を示す。 2) メサラジンの投与量を示す。

対照群と比較して試験製剤基剤群は Tukey の多重比較検定で有意差なし。

** p<0.01, * p<0.05, 対照群と比較して Tukey の多重比較検定で有意差あり。

p<0.01, 試験製剤基剤群と比較して Tukey の多重比較検定で有意差あり。

試験製剤及び標準製剤群間と Tukey の多重比較検定で有意差なし

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

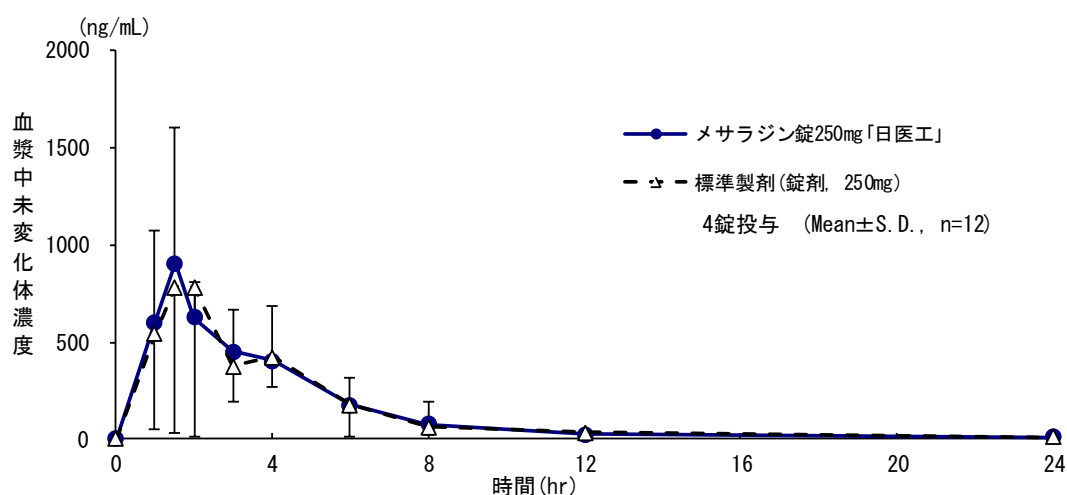
(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁵⁾

<メサラジン錠 250mg「日医工」>

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）

【絶食時投与】

メサラジン錠 250mg「日医工」及び標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 4 錠（メサラジンとして 1000mg）健康成人男子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 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。



[薬物速度論的パラメータ：絶食時投与]

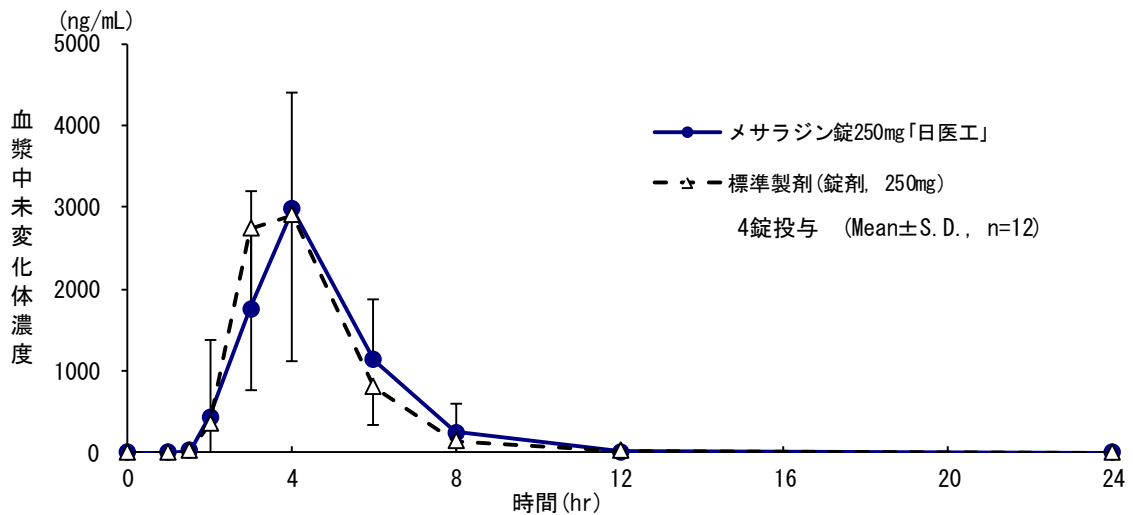
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
メサラジン錠 250mg「日医工」	3252±1155	1144±568	2.0±0.9	5.5±6.0
標準製剤 (錠剤, 250mg)	3278±1119	1257±799	2.2±1.2	5.4±3.2

(4 錠投与, Mean±S.D., n=12)

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。

【食後投与】

メサラジン錠 250mg「日医工」及び標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 4 錠（メサラジンとして 1000mg）健康成人男子に食後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 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。



[薬物速度論的パラメータ：食後投与]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
メサラジン錠 250mg「日医工」	9709±3558	3279±1270	3.9±0.8	1.1±0.3
標準製剤 (錠剤, 250mg)	9671±4769	3428±1776	3.6±0.5	1.5±1.4

(4 錠投与, Mean±S.D., n=12)

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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

(「VIII - 7. 相互作用」の項参照)

(6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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

(「VIII - 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」の項参照)

(3) 乳汁への移行性

(「VIII - 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」の項参照)

(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

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

該当資料なし

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

該当記載事項なし

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 重篤な腎障害のある患者 [腎障害がさらに悪化するおそれがある。]
- (2) 重篤な肝障害のある患者 [肝障害がさらに悪化するおそれがある。]
- (3) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者（「重要な基本的注意」の項参照）
- (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使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

（「Ⅴ. 治療に関する項目」を参照）

5. 慎重投与内容とその理由

【慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）】

- (1) 腎機能の低下している患者 [排泄が遅延し副作用があらわれるおそれがある。]
- (2) 肝機能の低下している患者 [代謝が遅延し副作用があらわれるおそれがある。]
- (3) サラゾスルファピリジンに対する過敏症のある患者（「重要な基本的注意」の項参照）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) メサラジンにより過敏症状（発熱，腹痛，下痢，好酸球増多等）が発現することがあり，また，潰瘍性大腸炎・クローン病が悪化することがあるため，異常が認められた場合には，減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- (2) 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したところ，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。
- (3) 間質性腎炎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。異常が認められた場合には減量又は投与を中止する等の適切な処置を行うこと。
- (4) 肝炎，肝機能障害，黄疸が報告されているため，投与中はAST(GOT)，ALT(GPT)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。異常が認められた場合には減量又は投与を中止する等の適切な処置を行うこと。
- (5) 本剤をメサラジン注腸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適宜減量するなど，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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

(2) 併用注意とその理由

併用注意（併用に注意すること）

文献による報告があるため、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 ステロイド剤	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。
アザチオプリン メルカプトプリン 水和物	骨髄抑制があらわれるおそれがある。	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。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状（頻度不明）

- 1) **間質性肺疾患**：間質性肺疾患（好酸球性肺炎，肺肺炎，肺臓炎，間質性肺炎等）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。
- 2) **心筋炎，心膜炎，胸膜炎**：心筋炎，心膜炎，胸膜炎があらわれることがあるので，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。
- 3) **間質性腎炎，ネフローゼ症候群，腎機能低下，急性腎不全**：間質性腎炎，ネフローゼ症候群，腎機能低下，急性腎不全があらわれることがあるので，投与期間中は腎機能検査値に注意するなど，患者の状態を十分に観察し，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。
- 4) **再生不良性貧血，汎血球減少，無顆粒球症，血小板減少症**：再生不良性貧血，汎血球減少，無顆粒球症，血小板減少症があらわれることがあるので，投与期間中は血液検査を行うなど患者の状態を十分に観察し，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。
- 5) **肝炎，肝機能障害，黄疸**：肝炎，AST (GOT)，ALT (GPT)， γ -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ので，投与期間中は肝機能検査値に注意するなど，患者の状態を十分に観察し，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。
- 6) **膵炎**：膵炎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を行うなど患者の状態を十分に観察し，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。

続き

(3) その他の副作用

以下のような副作用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。

	頻度不明
皮膚	発疹, そう痒感, 丘疹, 紅斑, 蕁麻疹, 脱毛
消化器	下痢, 腹痛, 血便, 下血, アミラーゼ上昇, 嘔気, 腹部膨満感, 食欲不振, 便秘, 口内炎, 粘液便, 嘔吐
肝臓	AST(GOT)・ALT(GPT)・ γ -GTP・Al-P・ビリルビンの上昇等の肝機能異常
腎臓	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, 尿着色
血液	白血球減少, 好酸球増多, 貧血
その他	発熱, 頭痛, 関節痛, 全身けん怠感, 浮腫, 筋肉痛, CK 上昇, ループス様症候群, むくみ, 末梢神経障害, めまい, 胸部痛, 頸部痛

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患, 合併症, 重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) **禁忌** : ①本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。②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には投与しないこと。 [交叉アレルギーを発現するおそれがある。]
- 2) **慎重投与** : サラゾスルファピリジンに対する過敏症のある患者には慎重に投与すること。
- 3) **重要な基本的な注意** : ①メサラジンにより過敏症状 (発熱, 腹痛, 下痢, 好酸球増多等) が発現することがあり, また, 潰瘍性大腸炎・クローン病が悪化することがあるため, 異常が認められた場合には, 減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。②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したところ, 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。
- 4) **その他の副作用** : 皮膚 (発疹, そう痒感, 丘疹, 紅斑, 蕁麻疹, 脱毛) 等の副作用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。

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能 (腎機能, 肝機能等) が低下しているため, 低用量 (例えば 750mg/日) から投与を開始するなど慎重に投与すること。

10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

- (1) 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。〔海外において新生児に血液疾患（白血球減少症，血小板減少症，貧血）が起きることが報告されており，妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。なお，メサラジンの動物実験では催奇形性は認められていない。〕
- (2) 授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが，やむを得ず投与する場合は授乳を避けること。〔ヒト母乳中へ移行することが報告されている。また，国内及び海外において乳児に下痢が起きることが報告されている。〕

11. 小児等への投与

小児等における使用経験は限られている。小児等では，専門医の管理下で安全性と治療の有益性を考慮した上で本剤を使用すること。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当記載事項なし

13. 過量投与

該当記載事項なし

14. 適用上の注意

- (1) **服用時**：本剤は二分割して服用可能であるが，放出調節製剤であることより，かまずに服用すること。また，乳鉢による混合粉碎は避けること。
- (2) **薬剤交付時**：PTP 包装の薬剤は，PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。（PTP シートの誤飲により，硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し，更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。）

15. その他の注意

- (1) 本剤は保存中わずかに着色することがあるが効力に変化はない。
- (2) 本剤のコーティング剤のエチルセルロースは水に不溶のため，糞便中に白いものがみられることがある。

16. その他

該当記載事項なし

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」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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	メサラジン錠 250mg「日医工」 メサラジン錠 500mg「日医工」	処方箋医薬品（注意—医師等の処方箋により使用すること）
有効成分	メサラジン	該当しない

2. 有効期間又は使用期限

外箱等に表示の使用期限内に使用すること。（3年：安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

気密容器で室温保存，遮光保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取り扱い上の留意点について

（「規制区分」，「貯法・保存条件」の項参照）

（2）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

くすりのしおり：有

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目）を参照）

（3）調剤時の留意点について

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目）を参照）

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

	PTP
メサラジン錠 250mg「日医工」	100錠（10錠×10），500錠（10錠×50）
メサラジン錠 500mg「日医工」	100錠（10錠×10）

7. 容器の材質

PTP：ポリプロピレンフィルム，アルミニウム箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ペントサ錠 250mg，ペントサ錠 500mg

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

	製造承認年月日	承認番号
メサラジン錠 250mg「日医工」	2009年 1月 8日	22100AMX00063000
メサラジン錠 500mg「日医工」	2012年 2月 15日	22400AMX00377000

11. 薬価基準収載年月日

	薬価基準収載年月日
メサラジン錠 250mg「日医工」	2009年 5月 15日
メサラジン錠 500mg「日医工」	2012年 6月 22日

12. 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

＜用法・用量の一部追加承認＞メサラジン錠 250mg「日医工」

用法・用量一部追加承認年月日：2010年1月15日

内容：

	一部追加承認後	一部追加承認前
用法 ・ 用量	潰瘍性大腸炎 通常，成人にはメサラジンとして1日1500mgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減するが，1日2250mgを上限とする。 <u>ただし，活動期には，必要に応じて1日4000mgを2回に分けて投与することができる。</u> 通常，小児にはメサラジンとして1日30～60mg/kgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減するが，1日2250mgを上限とする。	潰瘍性大腸炎 通常，成人にはメサラジンとして1日1500mgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減するが，1日2250mgを上限とする。
	クローン病 通常，成人にはメサラジンとして1日1500mg～3000mgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜減量する。 通常，小児にはメサラジンとして1日40～60mg/kgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜増減する。	クローン病 通常，成人にはメサラジンとして1日1500mg～3000mgを3回に分けて食後経口投与する。なお，年齢，症状により適宜減量する。

(__：一部変更承認箇所)

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は，投薬期間制限の対象となる医薬品ではない。

(「V. 治療に関する項目」を参照)

16. 各種コード

	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード	HOT(9桁) コード
メサラジン錠 250mg「日医工」	2399009F1130	620009441	119185101
メサラジン錠 500mg「日医工」	2399009F2145	622173401	121734601

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 日医工株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 日医工株式会社 社内資料 (溶出試験：錠 250mg)
- 3) 日医工株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験：錠 500mg)
- 4) 第十七改正日本薬局方 第一追補解説書 C-166, 廣川書店, 東京 (2018)
- 5) 中道 昇 他：医学と薬学, 62(1), 61(2009)

2. その他の参考文献

なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

なし

2. 海外における臨床支援情報

なし

X III. 備考

その他の関連資料

なし

付表 1—1

薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく承認申請時に添付する資料

別表 1 及び別表 2-（1）医療用医薬品より改変

添付資料の内容		新有効成分含有製剤（先発医薬品）	その他の医薬品（後発医薬品）	剤形追加に係る医薬品（後発医薬品）
イ 起源又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起源又は発見の経緯	○	×	○
	2 外国における使用状況	○	×	○
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ 製造方法並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定及び物理化学的性質等	○	×	×
	2 製造方法	○	△	○
	3 規格及び試験方法	○	○	○
ハ 安定性に関する資料	1 長期保存試験	○	×	△
	2 苛酷試験	○	×	△
	3 加速試験	○	○	○
ニ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 副次的薬理・安全性薬理	○	×	×
	3 その他の薬理	△	×	×
ホ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収	○	×	×
	2 分布	○	×	×
	3 代謝	○	×	×
	4 排泄	○	×	×
	5 生物学的同等性	×	○	○
	6 その他の薬物動態	△	×	×
ヘ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 単回投与毒性	○	×	×
	2 反復投与毒性	○	×	×
	3 遺伝毒性	○	×	×
	4 がん原性	△	×	×
	5 生殖発生毒性	○	×	×
	6 局所刺激性	△	×	×
	7 その他の毒性	△	×	×
ト 臨床試験の成績に関する資料	臨床試験成績	○	×	×

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される

付表 1 — 2

医薬発第 481 号（平成 11 年 4 月 8 日）に基づく承認申請時に添付する資料

別表 1 及び別表 2-（1）医療用医薬品より改変

添付資料の内容		新有効成分含有製剤（先発医薬品）	その他の医薬品（後発医薬品）	剤形追加に係る医薬品（後発医薬品）
イ 起源又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起源又は発見の経緯	○	×	○
	2 外国における使用状況	○	×	○
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ 物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定	○	×	×
	2 物理的・科学的性質等	○	×	×
	3 規格及び試験方法	○	○	○
ハ 安定性に関する資料	1 長期保存試験	○	×	△
	2 苛酷試験	○	×	△
	3 加速試験	○	○	○
ニ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 単回投与毒性	○	×	×
	2 反復投与毒性	○	×	×
	3 生殖発生毒性	○	×	×
	4 変異原性	○	×	×
	5 がん原性	△	×	×
	6 局所刺激性	△	×	×
	7 その他の毒性	△	×	×
ホ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 一般薬理	○	×	×
ヘ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収	○	×	×
	2 分布	○	×	×
	3 代謝	○	×	×
	4 排泄	○	×	×
	5 生物学的同等性	×	○	○
ト 臨床試験の成績に関する資料	臨床試験成績	○	×	×

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される

付表 1 — 3

薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づく承認申請時に添付する資料

別表 1 及び別表 2-（1）医療用医薬品より改変

添付資料の内容		新有効成分含有製剤（先発医薬品）	その他の医薬品（後発医薬品）	剤形追加に係る医薬品（後発医薬品）
イ 起源又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起源又は発見の経緯	○	×	○
	2 外国における使用状況	○	×	○
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ 物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定	○	×	×
	2 物理的・化学的性質等	○	×	×
	3 規格及び試験方法	○	○	○
ハ 安定性に関する資料	1 長期保存試験	○	×	×
	2 苛酷試験	○	×	×
	3 加速試験	×	○	○
ニ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 急性毒性	○	×	×
	2 亜急性毒性	○	×	×
	3 慢性毒性	○	×	×
	4 生殖に及ぼす影響	○	×	×
	5 依存性	△	×	×
	6 抗原性	△	×	×
	7 変異原性	△	×	×
	8 がん原性	△	×	×
	9 局所刺激	△	×	×
ホ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 一般薬理	○	×	×
ヘ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収	○	×	×
	2 分布	○	×	×
	3 代謝	○	×	×
	4 排泄	○	×	×
	5 生物学的同等性	×	○	○
ト 臨床試験の試験成績に関する資料	臨床試験の試験成績	○	×	○

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される