

**2019年3月改訂（第3版）
*2015年7月改訂

日本標準商品分類番号
8 7 2 3 9 9

貯 法：遮光保存、室温保存、気密容器

使用期限：外箱等に表示

注 意：「取扱い上の注意」の項参照

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

承認番号	22400AMX00550000
薬価収載	2012年6月
販売開始	2012年6月

潰瘍性大腸炎治療剤

メサラジン注腸 1g「JG」

【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（「2. 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】

(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（「2. 重要な基本的注意(2)」の項参照）

2. 重要な基本的注意

(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、潰瘍性大腸炎が悪化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)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、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)メサラジン錠において、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)本剤をメサラジン錠を含む5-アミノサリチル酸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。

3. 相互作用

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。

**【組成・性状】

販 売 名	メサラジン注腸 1g「JG」
成分・含量	(1個100mL中) 日局 メサラジン 1g
添 加 物	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
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 器	

【効能・効果】

潰瘍性大腸炎（重症を除く）

<効能・効果に関連する使用上の注意>

脾彎曲部より口側の炎症には効果が期待できない。

【用法・用量】

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。

【使用上の注意】

1. 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】

*4. 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。

(1) 重大な副作用 (頻度不明)

1) 間質性肺疾患

間質性肺疾患 (好酸球性肺炎、肺胞炎、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。

(2) 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、丘疹、蕁麻疹、紅斑、脱毛、痒痒感
消化器	下痢、腹痛、嘔気、嘔吐、血便、下血、アミラーゼ上昇、腹部膨満感、便秘、粘液便、食欲不振、口内炎
肝臓	AST (GOT)・ALT (GPT)・ γ -GTP・ALP・ビリルビンの上昇等の肝機能異常
腎臓	尿着色、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
その他	頭痛、CK上昇、筋肉痛、関節痛、ループス様症候群、発熱、浮腫、全身倦怠感、めまい、末梢神経障害、肛門部位のかゆみ、不快感、便秘切迫、胸部痛、頸部痛

5. 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、減量するなど慎重に投与すること。

6. 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。[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が、妊娠中の投与に関する安全性は確立していない]

(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]

7. 小児等への投与

小児に対する安全性は確立していない (使用経験が少ない)。

8. 適用上の注意

(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こと。

(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。

(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。

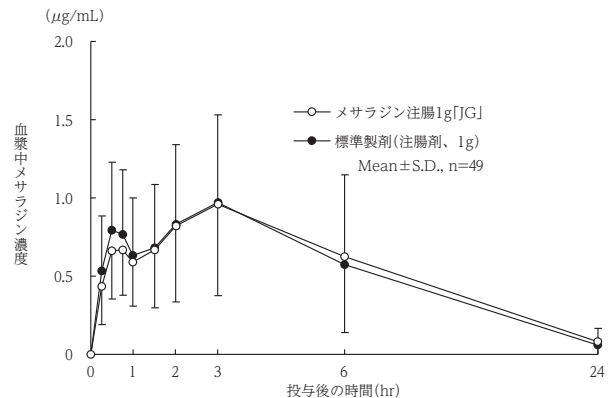
(4) 本品は白色～微黄色の懸濁液である。メサラジンは酸化により分解されやすく有色の分解物を生成するため、上澄液が無色～微黄色の範囲を超えて着色したものは使用しないこと。

【薬物動態】

生物学的同等性試験

メサラジン注腸 1g [JG]

メサラジン注腸 1g [JG] と標準製剤を、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) 健康成人男子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。¹⁾



薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (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 [※]
標準製剤 (注腸剤、1g)	10.21±5.82	1.14±0.51	2.5±1.8	6.1±3.8 ^{※※}

(Mean±S.D., n=49, T_{1/2}; ※: n=47, ※※: n=46)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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。

**【有効成分に関する理化学的知見】

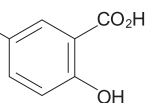
一般名：メサラジン (Mesalazine)

化学名：5-Amino-2-hydroxybenzoic acid

分子式：C₇H₇NO₃

分子量：153.14

構造式：H₂N



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。

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。

【取扱い上の注意】

(1)アルミ袋開封後は速やかに使用すること。(「8. 適用上の注意」の項参照)

(2)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、メサラジン注腸 1g [JG] 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。²⁾

【包装】

メサラジン注腸 1g [JG]

ポリエチレンボトル：100mL×7

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

1) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；

生物学的同等性試験 (2012)

2) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；

安定性試験 (2012)

〈文献請求先・お問合せ先〉

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ください。

日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室

〒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

