

# 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

## 潰瘍性大腸炎治療剤

# メサラジン注腸 1g「JG」

## Mesalazine Enema

剤形	懸濁注腸剤
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・ 発売年月日	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 発売年月日：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 受付時間：9時～18時（土、日、祝日を除く） TEL 0120 - 893 - 170 FAX 0120 - 893 - 172 医療関係者向けホームページ： <a href="http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html">http://www.nihon-generic.co.jp/medical/index.html</a>

本IFは2019年3月改訂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、(独)医薬品医療機器総合機構(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

# IF 利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

## 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。この変更に合わせて、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(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) 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 PMDA ホームページが公的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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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 PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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、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	9. 生物学的試験法	8
1. 開発の経緯	1	10. 製剤中の有効成分の確認試験法	8
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	11. 製剤中の有効成分の定量法	8
II. 名称に関する項目	2	12. 力価	8
1. 販売名	2	13. 混入する可能性のある夾雑物	8
(1)和名	2	14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に 関する情報	8
(2)洋名	2	15. 刺激性	8
(3)名称の由来	2	16. その他	8
2. 一般名	2	V. 治療に関する項目	9
(1)和名(命名法)	2	1. 効能又は効果	9
(2)洋名(命名法)	2	2. 用法及び用量	9
(3)ステム	2	3. 臨床成績	9
3. 構造式又は示性式	2	(1)臨床データパッケージ	9
4. 分子式及び分子量	2	(2)臨床効果	9
5. 化学名(命名法)	2	(3)臨床薬理試験	9
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(4)探索的試験	9
7. CAS登録番号	2	(5)検証的試験	9
III. 有効成分に関する項目	3	1)無作為化並行用量反応試験	9
1. 物理化学的性質	3	2)比較試験	9
(1)外観・性状	3	3)安全性試験	9
(2)溶解性	3	4)患者・病態別試験	9
(3)吸湿性	3	(6)治療的使用	9
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	3	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)	9
(5)酸塩基解離定数	3	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	9
(6)分配係数	3	VI. 薬効薬理に関する項目	10
(7)その他の主な示性値	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	2. 薬理作用	10
3. 有効成分の確認試験法	3	(1)作用部位・作用機序	10
4. 有効成分の定量法	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	10
IV. 製剤に関する項目	4	(3)作用発現時間・持続時間	10
1. 剤形	4	VII. 薬物動態に関する項目	11
(1)投与経路	4	1. 血中濃度の推移・測定法	11
(2)剤形の区別、外観及び性状	4	(1)治療上有効な血中濃度	11
(3)製剤の物性	4	(2)最高血中濃度到達時間	11
(4)識別コード	4	(3)臨床試験で確認された血中濃度	11
(5)pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨 及び安定なpH域等	4	(4)中毒域	12
(6)無菌の有無	4	(5)食事・併用薬の影響	12
2. 製剤の組成	4	(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	12
(1)有効成分(活性成分)の含量	4	2. 薬物速度論的パラメータ	12
(2)添加物	4	(1)解析方法	12
(3)添付溶解液の組成及び容量	4	(2)吸収速度定数	12
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	4	(3)バイオアベイラビリティ	12
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	(4)消失速度定数	12
5. 製剤の各種条件下における安定性	5		
6. 調製法及び溶解後の安定性	6		
7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	7		
8. 溶出性	7		



(5)クリアランス	12	15. その他の注意	18
(6)分布容積	12	16. その他	18
(7)血漿蛋白結合率	13		
3. 吸収	13	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	19
4. 分布	13	1. 薬理試験	19
(1)血液-脳関門通過性	13	(1)薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)	19
(2)血液-胎盤関門通過性	13	(2)副次的薬理試験	19
(3)乳汁への移行性	13	(3)安全性薬理試験	19
(4)髄液への移行性	13	(4)その他の薬理試験	19
(5)その他の組織への移行性	13	2. 毒性試験	19
5. 代謝	13	(1)単回投与毒性試験	19
(1)代謝部位及び代謝経路	13	(2)反復投与毒性試験	19
(2)代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種	13	(3)生殖発生毒性試験	19
(3)初回通過効果の有無及びその割合	13	(4)その他の特殊毒性	19
(4)代謝物の活性の有無及び比率	13		
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	13	<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	20
6. 排泄	13	1. 規制区分	20
(1)排泄部位及び経路	13	2. 有効期間又は使用期限	20
(2)排泄率	13	3. 貯法・保存条件	20
(3)排泄速度	13	4. 薬剤取扱い上の注意点	20
7. トランスポーターに関する情報	13	(1)薬局での取扱い上の留意点について	20
8. 透析等による除去率	14	(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)	20
		(3)調剤時の留意点について	20
<b>VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目</b>	15	5. 承認条件等	20
1. 警告内容とその理由	15	6. 包装	20
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	15	7. 容器の材質	20
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	15	8. 同一成分・同効薬	20
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	15	9. 国際誕生年月日	21
5. 慎重投与内容とその理由	15	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	21
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15	11. 薬価基準収載年月日	21
7. 相互作用	16	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	21
(1)併用禁忌とその理由	16	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
(2)併用注意とその理由	16	14. 再審査期間	21
8. 副作用	16	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	21
(1)副作用の概要	16	16. 各種コード	21
(2)重大な副作用と初期症状	16	17. 保険給付上の注意	21
(3)その他の副作用	17		
(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	17	<b>XI. 文献</b>	22
(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	17	1. 引用文献	22
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法	17	2. その他の参考文献	22
9. 高齢者への投与	17	<b>XII. 参考資料</b>	23
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18	1. 主な外国での発売状況	23
11. 小児等への投与	18	2. 海外における臨床支援情報	23
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	18		
13. 過量投与	18	<b>XIII. 備考</b>	24
14. 適用上の注意	18	その他の関連資料	24

# 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。

メサラジンは、持続性サルファ薬であるサラゾスルファピリジンが大腸内で細菌によりアゾ基が還元的に開裂し、生成された 5-アミノサリチル酸である。<sup>1)</sup>

本邦でのメサラジンの懸濁注腸剤は、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得て、2012 年 6 月に販売開始した。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、潰瘍性大腸炎に用いられるサラゾスルファピリジンの作用本態とされる 5-アミノサリチル酸である。<sup>1)</sup>
- (2) 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（頻度不明）。

## 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

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

メサラジン (JAN)

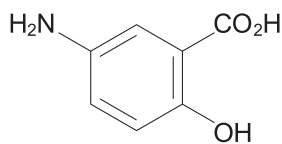
#### (2) 洋名 (命名法)

Mesalazine (JAN、INN、EP)

#### (3) ステム

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<sub>7</sub>H<sub>7</sub>NO<sub>3</sub>

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：5-Aminosalicylic acid

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。

溶解度 (37°C) <sup>2)</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

$pK_{a1}$  : 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

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（波長 302nm 付近及び 232nm 付近の吸収の極大を示す）

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

#### 4. 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) 投与経路

直腸

### (2) 剤形の区別、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>ノズルキャップ      薬液ボトル      (単位：mm)</p> <p>74.0      111.6      43.5 59.0      15.0      49.0 φ24.8</p> <p>ノズル延長用カテーテル      ストッパー</p> <p>8.0      202.0      24.0      φ15.5 170.0      φ10.6      φ23.0      2.0</p>

### (3) 製剤の物性

本品を振り混ぜるとき、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。

### (4) 識別コード

該当しない

### (5) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

### (6) 無菌の有無

該当しない

## 2. 製剤の組成

### (1) 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

### (2) 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

### (3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

## 3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

## 4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

よく振り混ぜてから使用すること。

## 5. 製剤の各種条件下における安定性

### ◎ 加速試験<sup>3)</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 (%)
		(2)	(3)		(5)	(6)		
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	4.8	適合	適合	適合	100
1 ヶ月後	—	適合	適合	4.9	—	適合	—	99
3 ヶ月後	—	適合	適合	4.8	—	適合	—	98
6 ヶ月後	適合 (白色懸濁液、無色上澄液)	適合	適合	4.8	適合	適合	適合	99

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 (%)
		(10)	(11)			
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°C、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>4)</sup>

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

②光に対する安定性試験：総照度 33.6 万 lux・hr/25±1°C/60±5%RH  
(2000lux/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 (%)
規格		(1)	(2)	(3)	(4)	(5)
試験開始時		適合	4.8	適合	適合	101.7
①温度	1 日後	変化なし	4.8	適合	適合	100.3
	7 日後	変化なし	4.6	適合	適合	102.0
	30 日後	変化なし	4.6	適合	適合	101.0
②光	1 日後 (4.8 万 lux・hr)	変化あり (規格外)	4.7	適合	適合	98.0
	7 日後 (33.6 万 lux・hr)	変化あり (規格外)	4.5	不適合 (規格外)	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)。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。
- (4) 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。
- (5) 表示量の 95.0~105.0%

6. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 8. 溶出性

【放出試験】<sup>5)</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

試験条件	試験結果
(50rpm、水)	<p>標準製剤及び試験製剤は15分以内に平均85%以上放出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>
(50rpm、pH7.0)	<p>標準製剤及び試験製剤は15分以内に平均85%以上放出しており、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>

### ・ 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 (注腸剤、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。

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

(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)

11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

12. 力価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

「IV. 製剤に関する項目、-1. (2) 剤形の区別、外観及び性状」、 「VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目、-14. 適用上の注意」の項参照

15. 刺激性

該当資料なし

16. 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）

〈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。

### 2. 用法及び用量

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。

### 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

潰瘍性大腸炎（重症を除く）の治療に用いられる。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 B<sub>4</sub> 産生抑制作用が認められたという。<sup>6)</sup>

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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

健康成人男子

薬剤名	投与量	投与方法	Tmax (hr)
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	2.5±1.8

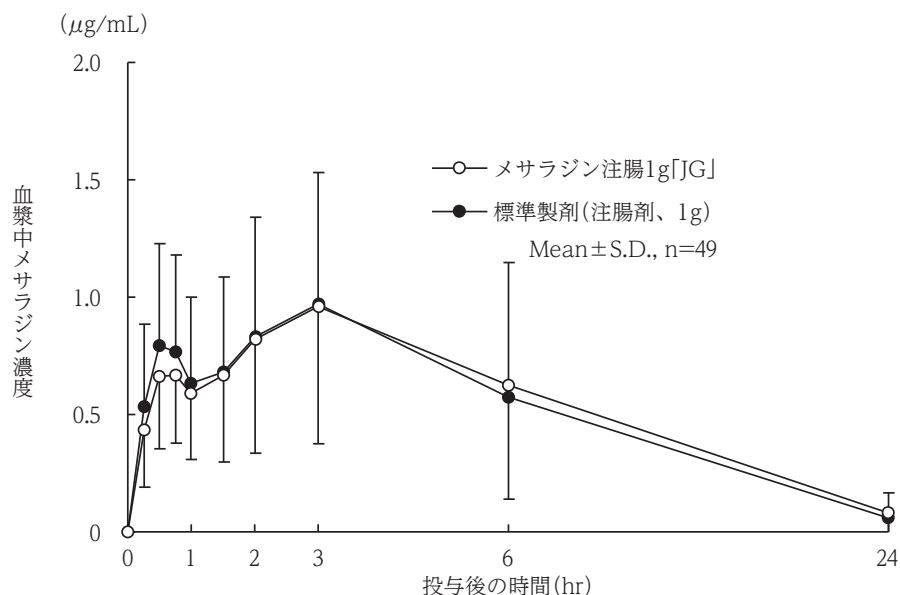
(Mean±S.D.,n=49)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

【生物学的同等性試験】<sup>7)</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）」に従う。

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。



<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*
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<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)

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 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

(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

健康成人男子

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)

(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

該当資料なし

#### (3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、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

該当しない

### 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

「V. 治療に関する項目 - 1. 効能又は効果」の項参照

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 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 (2)**」の項参照）

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

#### 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。

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

### (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

#### 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)、 $\gamma$ -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。

### (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、丘疹、蕁麻疹、紅斑、脱毛、痒痒感
消	化	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)・ $\gamma$ -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	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、便意切迫、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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）、 - 5. 慎重投与内容とその理由、 - 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法、 - 8. 副作用 (3) その他の副作用「皮膚」、「その他」の項参照

### 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、減量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。[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]

## 11. 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）。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

## 13. 過量投与

該当しない

## 14. 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。

## 15. その他の注意

該当しない

## 16. その他

該当しない

# 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」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. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

## 3. 貯法・保存条件

遮光保存、室温保存、気密容器

## 4. 薬剤取扱い上の注意点

### (1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

### (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）

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。

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 14. 適用上の注意」の項参照

- ・くすりのしおり：有り
- ・患者様用指導箋：有り

「XⅢ. 備考 - その他の関連資料」の項参照

### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

## 5. 承認条件等

該当しない

## 6. 包装

ポリエチレンボトル：100mL×7個

## 7. 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

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分：ペンタサ®注腸 1g（杏林製薬株式会社）、メサラジン錠 250mg「JG」/錠 500mg「JG」（日本ジェネリック株式会社）

同 効 薬：サラゾスルファピリジン 等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
メサラジン注腸 1g「JG」	2012年2月15日	22400AMX00550000

11. 薬価基準収載年月日

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

該当しない

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. 投薬期間制限医薬品に関する情報

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。

16. 各種コード

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

17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。



# X I . 文献

---

## 1. 引用文献

- 1) 田中千賀子、加藤隆一、成宮周編集；NEW 薬理学（改訂第7版）、490（2017）、南江堂
- 2) 日本版オレンジブック研究会；オレンジブック総合版 <http://www.jp-orangebook.gr.jp/index.html>（アクセス 2019/04/05）
- 3) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
メサラジン注腸 1g「JG」の加速試験（2012）
- 4) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
メサラジン注腸 1g「JG」の無包装状態での安定性試験（2012）
- 5) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
メサラジン注腸 1g「JG」の放出試験（2012）
- 6) 第十七改正日本薬局方解説書、C-166（2016）、廣川書店
- 7) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
メサラジン注腸 1g「JG」の生物学的同等性試験（2012）

## 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



*Memo*

*Memo*



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