

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
処方箋医薬品^注)

メサラジン腸溶錠400mg「VTRS」

MESALAZINE Enteric-coated Tablets
メサラジン腸溶錠

剤形	フィルムコーティング錠
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	1錠中 日局 メサラジン 400.0mg
一般名	和名：メサラジン（JAN） 洋名：Mesalazine（JAN）
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：2015年 2月16日 薬価基準収載年月日：2022年 4月20日 発売年月日：2015年 9月18日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：マイラン EPD 合同会社 販売：ヴィアトリス製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 https://www.viatrix-e-channel.com/

本IFは2022年4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、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 — 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、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に審査・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
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命名法）	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	4
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4
4. 製剤の各種条件下における安定性	5
5. 調製法及び溶解後の安定性	5
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5
7. 溶出性	6
8. 生物学的試験法	7
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
10. 製剤中の有効成分の定量法	7
11. 力価	8
12. 混入する可能性のある夾雑物	8
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	8
14. その他	8

V. 治療に関する項目	9
1. 効能又は効果	9
2. 用法及び用量	9
3. 臨床成績	9
VI. 薬効薬理に関する項目	11
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	11
2. 薬理作用	11
VII. 薬物動態に関する項目	13
1. 血中濃度の推移・測定法	13
2. 薬物速度論的パラメータ	14
3. 吸収	14
4. 分布	14
5. 代謝	15
6. 排泄	15
7. トランスポーターに関する情報	15
8. 透析等による除去率	15
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	16
1. 警告内容とその理由	16
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	16
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	16
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	16
5. 慎重投与内容とその理由	16
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16
7. 相互作用	17
8. 副作用	17
9. 高齢者への投与	19
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19
11. 小児等への投与	19
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
13. 過量投与	19
14. 適用上の注意	19
15. その他の注意	20
16. その他	20

IX. 非臨床試験に関する項目	21
1. 薬理試験	21
2. 毒性試験	21
X. 管理的事項に関する項目	22
1. 規制区分	22
2. 有効期間又は使用期限	22
3. 貯法・保存条件	22
4. 薬剤取扱い上の注意点	22
5. 承認条件等	22
6. 包装	22
7. 容器の材質	22
8. 同一成分・同効薬	22
9. 国際誕生年月日	23
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
11. 薬価基準収載年月日	23
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	23
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	23
14. 再審査期間	23
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
16. 各種コード	23
17. 保険給付上の注意	23
XI. 文献	24
1. 引用文献	24
2. その他の参考文献	24
XII. 参考資料	25
1. 主な外国での発売状況	25
2. 海外における臨床支援情報	25
XIII. 備考	26
その他の関連資料	26

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

メサラジンは、経口投与では大部分が小腸において吸収されてしまうため、潰瘍性大腸炎の病変部位に十分送達されるよう、様々な製剤学的工夫がなされてきた。本剤は、消化管内の pH の変化に着目して開発されたものである。

メサラジン腸溶錠 400mg「ファイザー」は、後発医薬品として開発を企画され、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）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、2015 年 2 月に承認を得た製剤である。

2017 年 8 月に潰瘍性大腸炎の寛解維持療法の用法・用量が追加承認された。

2022 年 4 月、マイラン製薬株式会社からマイラン EPD 合同会社へ製造販売移管したため、販売名をメサラジン腸溶錠 400mg「V T R S」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み

- 1) 包装（小函、PTP シート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている^{1)、2)、3)}。
- 2) PTP シートのデザインを工夫することで識別性を高めている。
- 3) 患者用説明書を小函に同封している。

2. 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が、メサラジンの重大な副作用として、骨髄抑制、再生不良性貧血、汎血球減少症、無顆粒球症、白血球減少症、好中球減少症、血小板減少症、心筋炎、心膜炎、胸膜炎、間質性肺疾患、膵炎、間質性腎炎、ネフローゼ症候群、腎不全、肝炎、肝機能障害、黄疸が報告されている。

*「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

メサラジン腸溶錠 400mg 「V T R S」

(2) 洋名

MESALAZINE Enteric-coated Tablets [VTRS]

(3) 名称の由来

有効成分であるメサラジンに剤形、含量及び「V T R S」を付した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

メサラジン（JAN）

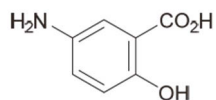
(2) 洋名（命名法）

Mesalazine（JAN、INN）

(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：C₇H₇NO₃

分子量：153.14

5. 化学名（命名法）

5-Amino-2-hydroxybenzoic acid

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：メサラミン Mesalamine (USAN)

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

1.0g を水 1000mL に溶かした液の pH は 3.9～4.3 である。

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

日本薬局方「メサラジン」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）

4. 有効成分の定量法



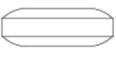
日本薬局方「メサラジン」定量法による。

電位差滴定法

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	外形				色調等
	上面	下面	側面		
メサラジン腸溶錠 400mg「VTR S」					帯赤褐色～褐色 楕円形 フィルムコーティング錠
	長径 15.3mm	短径 7.0mm	厚さ 5.3mm	重量 502mg	

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

上面 UG400、下面 なし

(4) 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

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1錠中 日局 メサラジン 400.0mg

(2) 添加物

D-マンニトール、デンプングリコール酸ナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、タルク、ステアリン酸マグネシウム、メタクリル酸コポリマーS、クエン酸トリエチル、三二酸化鉄、マクロゴール 6000、カルナウバロウ

(3) その他

該当資料なし

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

加速試験⁴⁾

試験条件：40±1℃、75±5%RH

包装形態：PTP包装（アルミピロー、紙箱）

項及び規格		開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（帯赤褐色～褐色の楕円形のフィルムコーティング錠）		適合	適合	適合	適合
確認試験（赤外吸収スペクトル）		適合	—	—	適合
製剤均一性試験*		適合	—	—	適合
溶出試験**	120分間の溶出率が5%以下（%） （溶出試験第1液）	0.0～0.2	0.0～0.2	0.0～0.2	0.0～0.2
	120分間の溶出率が5%以下（%） （pH6.5の薄めたMcIlvaine緩衝液）	0.0～0.2	—	—	—
	90分間の溶出率が80%以上（%） （pH7.5のリン酸水素二ナトリウム・クエン酸緩衝液）	97.3～104.0	88.6～101.0	88.4～102.3	87.0～101.9
定量試験（%） （95.0～105.0%）		100.2～102.9	100.2～101.4	99.3～103.0	99.5～102.4

各ロット n=3

*：各ロット n=10×3

**：各ロット n=6×3

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、メサラジン腸溶錠400mg「VTR S」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。

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）

該当資料なし

7. 溶出性

溶出挙動⁵⁾

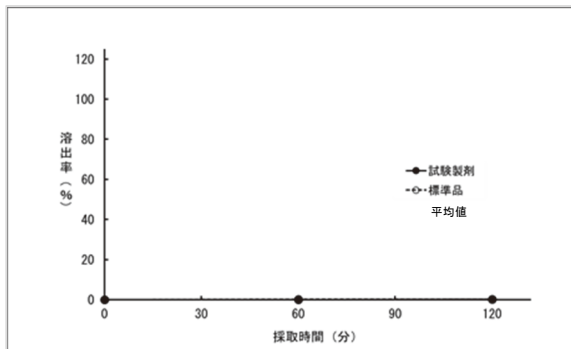
メサラジン腸溶錠 400mg「V T R S」と標準品の溶出試験を実施した結果、メサラジン腸溶錠 400mg「V T R S」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

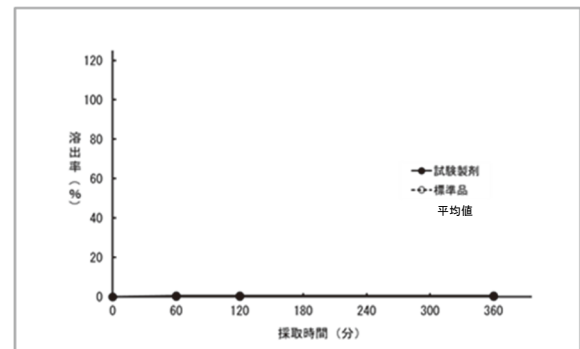
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液)	900mL	50rpm
	pH5.0 (薄めたMcIlvaine緩衝液)		
	pH6.5 (薄めたMcIlvaine緩衝液)		
	pH7.5 (薄めたMcIlvaine緩衝液)		
	水		
	pH7.5 (薄めたMcIlvaine緩衝液)	900mL	100rpm

n=12

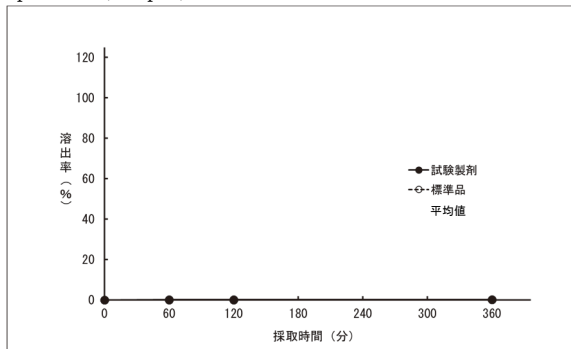
pH1.2 (50rpm)



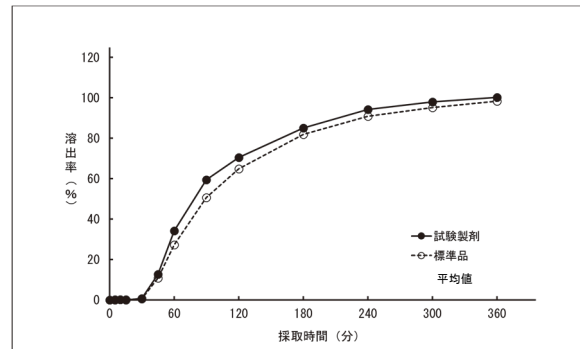
pH5.0 (50rpm)



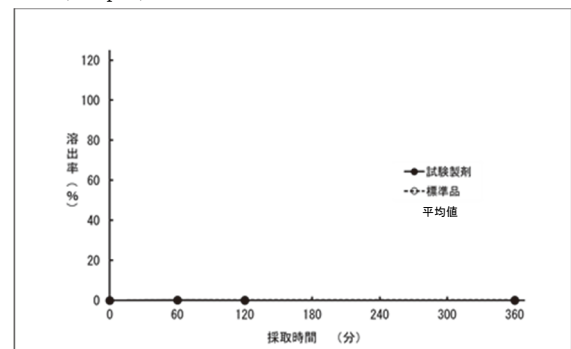
pH6.5 (50rpm)



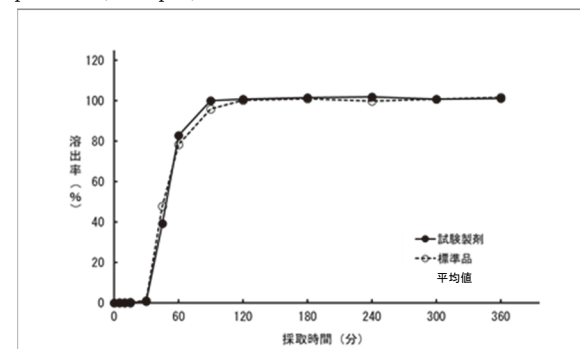
pH7.5 (50rpm)



水 (50rpm)



pH7.5 (100rpm)



試験条件	薬剤	溶出率 (%)											
		5分	10分	15分	30分	45分	60分	90分	120分	180分	240分	300分	360分
pH1.2 50rpm	メサラジン 腸溶錠400mg 「V T R S」	—	—	—	—	—	0.0 ±0.1	—	0.1 ±0.1	—	—	—	—
	標準品	—	—	—	—	—	0.1 ±0.1	—	0.1 ±0.1	—	—	—	—
pH5.0 50rpm	メサラジン 腸溶錠400mg 「V T R S」	—	—	—	—	—	0.5 ±0.0	—	0.5 ±0.0	—	—	—	0.5 ±0.1
	標準品	—	—	—	—	—	0.1 ±0.1	—	0.1 ±0.2	—	—	—	0.1 ±0.1
pH6.5 50rpm	メサラジン 腸溶錠400mg 「V T R S」	—	—	—	—	—	0.1 ±0.1	—	0.1 ±0.1	—	—	—	0.1 ±0.1
	標準品	—	—	—	—	—	0.0 ±0.1	—	0.0 ±0.1	—	—	—	0.1 ±0.1
pH7.5 50rpm	メサラジン 腸溶錠400mg 「V T R S」	0.1 ±0.1	0.1 ±0.1	0.0 ±0.0	0.6 ±0.3	12.7 ±3.8	34.2 ±6.3	59.5 ±6.0	70.5 ±4.9	85.1 ±3.2	94.3 ±1.6	98.0 ±1.8	100.3 ±2.4
	標準品	0.0 ±0.1	0.1 ±0.1	0.1 ±0.1	0.4 ±0.7	10.8 ±4.1	27.3 ±5.1	50.6 ±3.6	64.9 ±3.4	81.9 ±3.6	90.8 ±3.7	95.2 ±3.8	98.4 ±2.5
水 50rpm	メサラジン 腸溶錠400mg 「V T R S」	—	—	—	—	—	0.1 ±0.1	—	0.0 ±0.1	—	—	—	0.0 ±0.1
	標準品	—	—	—	—	—	0.2 ±0.0	—	0.2 ±0.1	—	—	—	0.1 ±0.1
pH7.5 100rpm	メサラジン 腸溶錠400mg 「V T R S」	0.0 ±0.1	0.0 ±0.1	0.0 ±0.1	0.6 ±0.4	39.3 ±9.7	82.9 ±4.3	100.0 ±1.3	100.7 ±1.1	101.5 ±2.1	101.8 ±1.0	100.8 ±0.6	101.1 ±2.4
	標準品	0.1 ±0.1	0.1 ±0.1	0.2 ±0.2	1.0 ±1.1	47.9 ±11.0	78.3 ±2.6	95.9 ±2.2	100.3 ±1.7	101.0 ±1.3	99.9 ±2.0	100.8 ±1.3	101.7 ±1.8

平均値±標準偏差 n=12

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

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

該当資料なし

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. 用法及び用量

通常、成人にはメサラジンとして1日2,400mg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2,400mg食後経口投与とすることができる。活動期には、1日3,600mgを3回に分けて食後経口投与する。

なお、患者の状態により適宜減量する。

[用法・用量に関連する使用上の注意]

1日3,600mgを、8週間を超えて投与した際の有効性及び安全性は確立していないため、漫然と投与せず、患者の病態を十分観察し、重症度、病変の広がり等に応じて適宜減量を考慮すること。

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）

該当しない

- 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⁶⁾

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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

生物学的同等性試験⁷⁾

ミニブタのトリニトロベンゼンスルホン酸-エタノール(TNBS-ETOH)誘発潰瘍性大腸炎モデル(n=6)を用い、メサラジン腸溶錠 400mg「V T R S」と標準剤の潰瘍性大腸炎に対する治療学的効果について検討した。その結果、両剤ともに対照に比して有意に潰瘍性大腸炎を改善し、両剤の同等性が確認された。

使用動物：ミニブタ

投与量：潰瘍性大腸炎モデル作製日から腸瘻管より1回2錠1日3回、10日間
群分け

群	試験群	TNBS-EtOH 誘発	投与量 (mg/body)	動物数
第1群	コントロール*	有	0	6
第2群	標準品	有	800 (2錠)	6
第3群	試験剤	有	800 (2錠)	6
第4群	無処置*	無	0	2

*コントロール群および無処置群は、注射用水を5mL/bodyを投与した。

評価方法

大腸炎誘発後11日目の大腸標本について、組織重量と浸潤細胞数を指標に治療効果を判定した。

治療効果

図1. 大腸組織重量の測定結果 (コントロール群、標準品投与群、試験製剤投与群(各 n=6)、無処置群(n=2)、平均値±S.E. * : p<0.05)

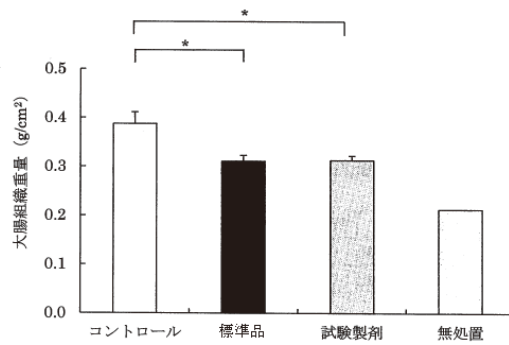
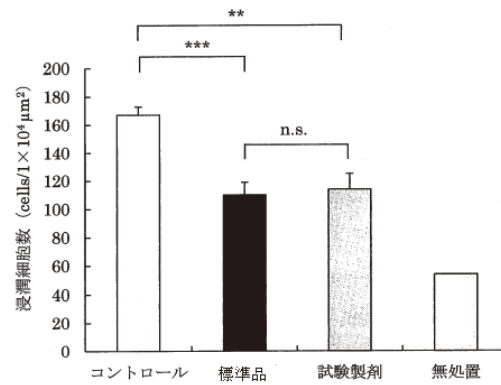


図2 浸潤細胞数の計測結果 (コントロール群、標準品投与群、試験製剤投与群(各 n=6)、無処置群(n=2)、平均値±S.E. n.s.: 有意差なし ** : p<0.01 *** : p<0.001)



(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⁸⁾

7.31±6.93 (hr)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

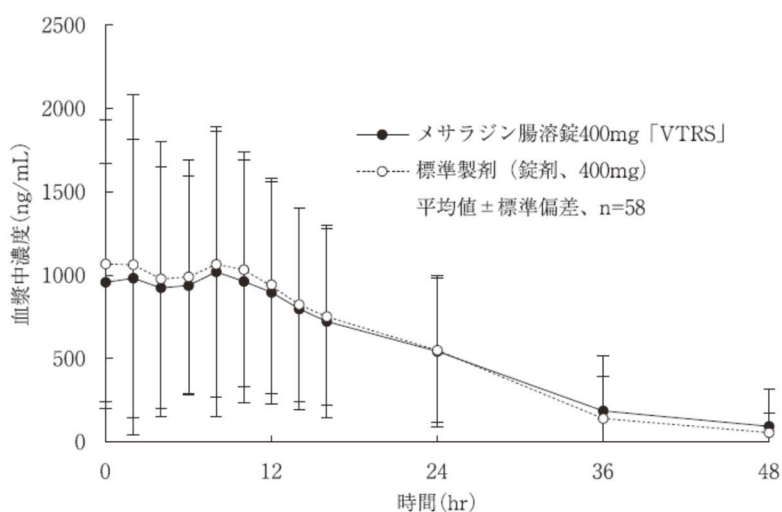
生物学的同等性試験⁸⁾

メサラジン腸溶錠 400mg「V T R S」と標準製剤を、クロスオーバー法により健康成人男子にそれぞれ1回3錠(メサラジンとして1200mg)を1日3回、6日間連続経口投与して、最終投与時より血漿中メサラジン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC₀₋₈、AUC₀₋₄₈、C_{max})について統計解析を行った結果、AUC₀₋₈は実数値の平均値の差の90%信頼区間が-0.20～+0.20の範囲内であり、また、AUC₀₋₄₈及びC_{max}は対数値の平均値の差がlog(0.90)～log(1.11)の範囲内であり、かつ、溶出試験で溶出挙動が類似していることから両剤の生物学的同等性が確認された。

	投与量	判定パラメータ			参考パラメータ				
		AUC ₀₋₈ (ng・hr/mL)	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	AUC _∞ * (ng・hr/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} * (hr)	MRT (hr)	Kel* (1/hr)
メサラジン腸溶錠 400mg「V T R S」	3錠 (1200mg)	7663.5 ±5482.3	25800.7 ±20204.8	1376.9 ±942.4	38000.7 ±31262.3	7.31 ±6.93	18.96 ±27.92	133.66 ±4.45	0.096 ±0.121
標準製剤 (錠剤、400mg)	3錠 (1200mg)	8191.0 ±6171.0	26070.5 ±18883.6	1476.5 ±1100.3	33546.8 ±24124.1	5.69 ±3.96	13.52 ±8.90	133.12 ±3.67	0.079 ±0.075

平均値±標準偏差、n=58

*メサラジン腸溶錠400mg「V T R S」は n=52、標準製剤は n=56で算出した。



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。

(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」の「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⁸⁾

0.096±0.121 (1/hr)

(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

ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。

(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. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. サリチル酸塩類に対し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. 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。]
4. 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. 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」の「2. 用法及び用量」の項参照

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]

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) ネフローゼ症候群、間質性腎炎が報告されているため、投与中は腎機能を検査するなど、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などの適切な処置を行うこと。
- (2) 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など、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などの適切な処置を行うこと。
- (3) 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、減量又は投与を中止するなどの適切な処置を行うこと。
- (4) サラゾスルファピリジンに対し過敏症の既往歴のある患者に本剤を投与する場合には、慎重に投与すること。腹部の痙攣、腹痛、発熱、重症な頭痛又は発疹のような急性の過敏症の症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

(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、減量又は中止するなど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）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。	メサラジンが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) 骨髄抑制、再生不良性貧血、汎血球減少症、無顆粒球症、白血球減少症、好中球減少症、血小板減少症：骨髄抑制、再生不良性貧血、汎血球減少症、無顆粒球症、白血球減少症、好中球減少症、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。
- 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、患者の状態を十分に観察し、胸部痛、心電図異常、胸水等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) 間質性肺疾患：間質性肺疾患（間質性肺炎、好酸球性肺炎等）があらわれることがあるので、患者の状態を十分に観察し、呼吸困難、胸痛、咳嗽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。
- 4) 膵炎：急性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。
- 5) 間質性腎炎、ネフローゼ症候群、腎不全：間質性腎炎、ネフローゼ症候群、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。

6) 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。

(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
過 敏 症	発疹、蕁麻疹、そう痒
血 液	好酸球増加、白血球減少、単球増加、貧血
消 化 器	腹痛、下痢、腹部膨満、悪心、消化不良、鼓腸、血中アミラーゼ増加、嘔吐、リパーゼ増加、血便、下血
肝 臓	ビリルビン増加、AST (GOT) 増加、ALT (GPT) 増加、 γ -GTP増加、Al-P増加、LDH増加
腎 臓	尿中NAG増加、BUN増加、血中クレアチニン増加、クレアチニンクリアランス減少
そ の 他	CRP増加、頭痛、めまい、関節痛、錯感覚（しびれ等）、発熱、耳鳴、筋肉痛、体重減少、脱毛症、ループス様症候群、赤血球沈降速度増加

(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

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. サリチル酸塩類に対し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。]

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (3) サラズスルファピリジン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]

重要な基本的注意

- (3) 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、減量又は投与を中止するなどの適切な処置を行うこと。

(4) サラソスルファピリジンに対し過敏症の既往歴のある患者に本剤を投与する場合には、慎重に投与すること。腹部の痙攣、腹痛、発熱、重症な頭痛又は発疹のような急性の過敏症の症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

その他の副作用（頻度不明）

過敏症：発疹、蕁麻疹、そう痒

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）が低下しているので、十分観察しながら慎重に投与すること。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。

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。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。なお、動物試験において、メサラジンによる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。〔ヒト乳汁中へ移行することが報告されている。〕

11. 小児等への投与

未熟児、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。

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

服用時：本剤は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、乳鉢による粉砕は避けること。

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

便中に錠剤がみられる場合がある。

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：メサラジン腸溶錠 400mg「V T R S」 処方箋医薬品^{注)}

注) 注意-医師等の処方箋により使用すること

有効成分：日局 メサラジン 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：最終年月を外箱等に記載

(取扱い上の注意参照)

(「IV. 製剤に関する項目」の「4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

3. 貯法・保存条件

室温保存

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

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）

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

【取扱い上の注意】

吸湿により溶出性に影響を及ぼすことがあるため、服用直前にPTPシートから錠剤を取り出すこと。

患者向医薬品ガイド：無し

くすりのしおり：有り

(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

メサラジン腸溶錠 400mg「V T R S」：100錠、500錠（PTP）

7. 容器の材質

PTPシート：ポリ塩化ビニル、アルミニウム

8. 同一成分・同効薬

同一成分：アサコール錠 400mg（ゼリア新薬工業株式会社）

ペンタサ錠 250mg・500mg、ペンタサ注腸 1g、ペンタサ坐剤 1g（杏林製薬株式会社）

同 効 薬：サラゾスルファピリジン

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

メサラジン腸溶錠 400mg 「V T R S」

製造販売承認年月日：2015年2月16日

承認番号：22700AMX00487

11. 薬価基準収載年月日

メサラジン腸溶錠 400mg 「V T R S」：2022年4月20日

(旧販売名)

メサラジン腸溶錠 400mg 「ファイザー」：2015年6月19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

2017年8月2日 用法・用量追加

潰瘍性大腸炎の寛解維持療法

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、療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める掲示事項等（平成18年厚生労働省告示第107号）の一部を改正した平成20年厚生労働省告示第97号（平成20年3月19日付）の「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

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
メサラジン腸溶錠 400mg 「V T R S」	124164802	2399009F3087	622416402

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 中野 泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（1）
－明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較－」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：25, 2009
- 2) 新井 哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（2）
－低視力状態での可視性の比較－」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：29, 2009
- 3) 山本 亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（3）
－低コントラスト状態での可視性の比較－」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：33, 2009
- 4) 社内資料：安定性試験（加速試験）（メサラジン腸溶錠 400mg 「V T R S」）
- 5) 社内資料：溶出試験（メサラジン腸溶錠 400mg 「V T R S」）
- 6) 第十七改正 日本薬局方 第一追補解説書 廣川書店：C166, 2017
- 7) 社内資料：薬効比較試験（メサラジン腸溶錠 400mg 「V T R S」）
- 8) 社内資料：生物学的同等性試験（メサラジン腸溶錠 400mg 「V T R S」）

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

該当資料なし

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ヴィアトリス製薬株式会社　メディカルインフォメーション部
〒105-0001　東京都港区虎ノ門 5-11-2
フリーダイヤル　0120-419-043

製造販売

マイラン EPD 合同会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門 5-11-2

販売

ヴィアトリス製薬株式会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門 5-11-2

