

用法・用量
追加

活動期潰瘍性大腸炎に対する
1日4,000mg投与(分2)が可能になりました。

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1,500mg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2,250mgを上限とする。

ただし、活動期には、必要に応じて1日4,000mg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2,250mg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1,500mg～3,000mg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4,000mgへの増量は、再燃緩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(【臨床成績】の項参照)。
2. 1日4,000mg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、患者の病態を十分観察し、漫然と1日4,000mgの投与を継続しないこと。

**2008年12月改訂(第13版 用法・用量の変更による改訂)

【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。]

効能・効果、用法・用量、禁忌を含む使用上の注意等につきましては裏面をご参照ください。

指定医薬品 処方せん医薬品^{注)}
潰瘍性大腸炎・クローン病治療剤

薬価基準収載

ペンタサ[®] 錠250
ペンタサ[®] 錠500

PENTASA[®] Tablets 250 PENTASA[®] Tablets 500

一般名:メサラジン〔JAN〕

注)注意—医師等の処方せんにより使用すること

ペンタサ[®]錠250 ペンタサ[®]錠500

PENTASA Tablets 250 PENTASA Tablets 500

一般名：メサラジン (JAN)
注：注意—医師等の処方せんに併用すること

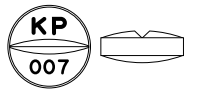
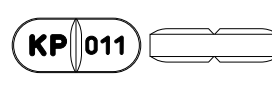
貯法	遮光した気密容器、室温保存
使用期限	外箱に表示の使用期限内に使用すること

販売名	和名	ペンタサ [®] 錠250	一般名	和名	メサラジン	錠250	錠500
	洋名	Pentasa [®] tablets 250	洋名	Mesalazine		(8AM) 694	22000AMX00481000
	和名	ペンタサ [®] 錠500	日本標準品分類番号	872399		1996年 4月	2008年 3月
	洋名	Pentasa [®] tablets 500	国際誕生	1986年9月		1996年 6月	2008年 7月
						1996年 7月	2008年10月
						**再審査結果	2008年10月

【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。]

組成・性状【*】

販売名	ペンタサ [®] 錠250	ペンタサ [®] 錠500
*成分・含量 (1錠中)	メサラジン250mg	メサラジン500mg
添加物	結晶セルロース、エチルセルロース、ポビドン、タルク、ステアリン酸マグネシウム、含水二酸化ケイ素	
色・剤形	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。	
*外形	 直径：9.5mm 厚さ：4.6mm 質量：約375mg	 長径：17.0mm 短径：7.2mm 厚さ：5.1mm 質量：約750mg
*識別コード	KP-007	KP-011

効能・効果

潰瘍性大腸炎 (重症を除く)、クローン病

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1,500mg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2,250mgを上限とする。
ただし、活動期には、必要に応じて1日4,000mg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2,250mg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1,500mg～3,000mg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、症状により適宜減量する。

*＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

1. 1日4,000mgへの増量は、再燃緩解型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 (【臨床成績】の項参照)。
2. 1日4,000mg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、患者の病態を十分観察し、漫然と1日4,000mgの投与を継続しないこと。

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。]
- (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) サラソルフアラジジンに対する過敏症のある患者 (「重要な基本的注意」の(2)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・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) サラソルフアラジ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、国内の臨床試験で39例中3例 (7.7%)、外国において43例中2例 (4.7%) に同様のアレルギー症状が認められた。そのため、サラソルフアラジ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射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

文献による報告があるため、併用に注意すること。

(1) 【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 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	白血球減少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。

**4. 副作用

総症例2,230例中、臨床検査値の変動を含め副作用が報告されたのは277例 (12.42%) であった。主な副作用症状は、下痢66例 (2.96%)、下血・血便28例 (1.26%)、腹痛24例 (1.08%) 等の消化器症状、発疹16例 (0.72%)、発熱15例 (0.67%)、肝機能異常14例 (0.63%) 等であった。また、主な臨床検査値の変動は、CRP上昇24例 (1.08%)、ALT (GPT) 上昇21例 (0.94%)、白血球上昇18例 (0.81%) 等であった。(用法・用量追加承認申請時)
なお、以下の副作用において「頻度不明」は自発報告で認められたものである。

(1) 重大な副作用

- **1) 過敏性肺障害 (0.01%以上0.1%未満) 並
好酸球性肺炎、肺炎、肺臓炎、間質性肺炎等の肺障害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 (0.01%以上0.1%未満)、心膜炎 (0.01%以上0.1%未満) 並、胸膜炎 (頻度不明)
心筋炎、心膜炎、胸膜炎があらわれることがあるので、胸痛、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 (0.01%未満) 並、急性腎不全 (頻度不明)
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 (0.01%未満) 並、血小板減少症 (0.01%以上0.1%未満)
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、黄疸 (0.01%以上0.1%未満)
肝炎、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) 肺炎 (0.01%以上0.1%未満)
肺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。
(注) 外国における市販後調査の結果による。

** (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。

	1%以上	0.1%以上1%未満	0.1%未満	頻度不明 ^{注1)}
皮膚	発疹、痒痒感、丘疹、紅斑	尋麻疹、脱毛 ^{注2)}		
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・AI-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、浮腫、全身倦怠感	筋肉痛、CK上昇、ループス様症候群 ^{注2)}	むくみ、末梢神経障害	

注1) 自発報告等による。

注2) 外国における市販後調査の結果による。

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、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。

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。[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。]

7. 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。

8. 適用上の注意

服用時：本剤は二分割して服用可能であるが、放出調節剤であることより、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、更には穿孔をお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)

9. 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。

包装【*】

ペンタサ錠250 PTP：100錠 (10錠×10)、500錠 (10錠×50)
*ペンタサ錠500 PTP：100錠 (10錠×10)

禁忌を含む使用上の注意の改訂に十分ご留意下さい。

●その他詳細につきましては添付文書等をご参照下さい。

製造販売元

杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台2丁目5番地
(資料請求先：学術部)

作成年月：2008.12
PS 0127