

**2010年11月改訂 (第14版)

*2010年2月改訂

日本標準商品分類番号

8 7 2 3 2 9

胃・十二指腸潰瘍、胃炎治療剤

メサフィリン[®] 配合散 メサフィリン[®] 配合錠 *Methaphyllin[®]*

**【貯 法】 室温保存

配合錠PTP包装はアルミ袋開封後光を遮り湿気を避けて保存すること。〔「取扱い上の注意」の項参照〕

【使用期限】 外箱又はラベルに表示の使用期限内に使用すること。

| | 配合散 | 配合錠 |
|-------|-------------------|-------------------|
| 承認番号 | 22100.AMX01558000 | 22100.AMX00988000 |
| 薬価収載 | 2009年9月 | 2009年9月 |
| 販売開始 | 1953年10月 | 1954年10月 |
| 再評価結果 | 1986年1月 | |

【禁 忌】 (次の患者には投与しないこと)

1. 緑内障の患者
〔抗コリン作用により眼圧を上昇させるおそれがある。〕
2. 前立腺肥大による排尿障害のある患者
〔抗コリン作用により排尿障害を悪化させるおそれがある。〕
3. 重篤な心疾患の患者
〔心疾患の症状を悪化させるおそれがある。〕
4. 麻痺性イレウスの患者
〔麻痺性イレウスの症状を悪化させるおそれがある。〕




【組成・性状】

1. 組成

配合散：本剤は、1g中に銅クロロフィリンナトリウム30mg、プロバンテリン臭化物15mg、ケイ酸マグネシウム831.2mgを含有する緑色の散剤である。
添加物として、L-グルタミン酸ナトリウム水和物、軽質無水ケイ酸、硬化油、酒石酸、タルク、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、香料を含有する。

配合錠：本剤は、1錠中に銅クロロフィリンナトリウム7.5mg、プロバンテリン臭化物3.75mg、ケイ酸マグネシウム160mgを含有する緑色の素錠である。
添加物として、カルメロース、軽質無水ケイ酸、硬化油、酒石酸、ステアリン酸カルシウム、タルク、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

2. 製剤の性状

| 販売名 | 剤形 識別コード | 外 形 | | | 性 状 |
|-----------|----------------|---|---|---|-------------------|
| | | 表 | 裏 | 断 面 | |
| メサフィリン配合散 | 散剤 | | | | 緑色 わずかに特有の芳香あり |
| メサフィリン配合錠 | 素錠 |  |  |  | 緑色 |
| | EISAI ML250 | 直径(mm)・質量(mg)・厚さ(mm) 9.1 250 3.2 | | | |

【効能・効果】

下記疾患における自覚症状及び他覚所見の改善
胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃炎

【用法・用量】

配合散：通常成人1回1gを1日3～4回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

配合錠：通常成人1回4錠を1日3～4回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

【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)前立腺肥大のある患者
〔抗コリン作用により排尿障害を起こすおそれがある。〕
- (2)甲状腺機能亢進症の患者
〔甲状腺機能亢進症に伴う心悸亢進や頻脈を悪化させるおそれがある。〕
- (3)うっ血性心不全の患者
〔うっ血性心不全の症状を悪化させるおそれがある。〕
- (4)不整脈のある患者
〔不整脈の症状を悪化させるおそれがある。〕
- (5)下痢のある患者
〔下痢を悪化させるおそれがある。〕
- (6)潰瘍性大腸炎の患者
〔中毒性巨大結腸症を起こすおそれがある。〕
- (7)高温環境にある患者
〔発熱するおそれがある。〕
- (8)重篤な腎機能障害のある患者
〔長期投与によりマグネシウム中毒症があらわれることがある。〕
- (9)高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕

2. 重要な基本的注意

視調節障害、眠気を起こすことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に注意させること。

3. 相互作用

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 |
|---|------------------------------|---|
| 三環系抗うつ剤 フェノチアジン系薬剤 抗コリン剤 抗ヒスタミン剤 | 抗コリン作用に基づく副作用を増強させるおそれがある。 | 本剤に含まれるプロバンテリン臭化物の抗コリン作用を増強させるおそれがある。 |
| モノアミン酸化酵素阻害剤 | 抗コリン作用に基づく副作用を増強させるおそれがある。 | 本剤の代謝を妨げ、本剤に含まれるプロバンテリン臭化物の抗コリン作用を増強させるおそれがある。 |
| テトラサイクリン系抗生物質 ニューキノロン系抗菌剤 セフジニルエチドロン酸 二ナトリウム | 併用薬剤の血中濃度が低下し効果を減弱させるおそれがある。 | 本剤に含まれるケイ酸マグネシウムが経口投与された併用薬剤とキレート化合物を形成し、併用薬剤の吸収を妨げると考えられる。 |

(裏面につづく)

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|------------------|------------------------|--|
| 経口薬剤 (ジゴキシン等) | 併用薬剤の作用が減弱 することがある。 | 本剤に含まれるケイ酸マグネシウムの吸着作用又は消化管内・体液のpH上昇により、併用薬剤の吸収・排泄に影響を与えることがある。 |

【薬効薬理】

1. アセチルコリンに拮抗し、鎮痙作用を示す
プロパンテリン臭化物は、副交感神経末端でのアセチルコリン作用に拮抗することで、自律神経の緊張を緩解し、消化管の痙攣を抑制し、疼痛を和らげる。(9)(10)(11)
2. 持続性の制酸作用を有する
ケイ酸マグネシウムは、胃酸の中和作用とその結果生成するケイ酸コロイドの吸着作用により、持続性の制酸作用を示す。
さらにプロパンテリン臭化物の胃酸分泌抑制作用が加わって、制酸効果の延長をもたらす。(12)(13)
3. 抗ペプシン作用及び肉芽増殖作用を有する
銅クロロフィリンナトリウムは胃液中のペプシン活性を抑制し、さらに肉芽増殖作用によって潰瘍創傷面の治癒を促進する。(14)(15)
4. 各種実験潰瘍に対して抗潰瘍作用を有する
銅クロロフィリンナトリウム、プロパンテリン臭化物及びケイ酸マグネシウムは、ラットにおける各種実験潰瘍モデルに対して潰瘍発生を抑制する。また三成分を配合することにより、各単剤の効果よりも優れた抗潰瘍効果を発揮する。(16)(17)

4. 副作用

総症例1,135例中、108例(9.52%)の副作用が報告されている。(臨床試験成績集計)

| | 0.1～5%未満 | 0.1%未満 | 頻度不明 |
|---------------------|--------------------|----------|---------------------------|
| 眼 | | 視調節障害 | |
| 精神神経系 | 眩暈 | 頭痛・頭重、不眠 | 眠気 |
| 消化器 | 口渇、便秘、下痢、腹部膨満感・不快感 | | 胸やけ |
| 循環器 | 心悸亢進 | | |
| 過敏症 ^(注1) | | | 発疹 |
| 泌尿器 | 排尿障害 | | 腎結石、尿路結石 ^(注2) |
| 代謝異常 | | | 高マグネシウム血症 ^(注3) |
| その他 | | | 倦怠感、顔面紅潮、熱感、嘔声 |

注1) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

注2) 長期・大量投与により、このような症状があらわれたとの報告がある。

注3) 配合成分のケイ酸マグネシウムの長期・大量投与により、このような症状があらわれたとの報告がある。観察を十分に行い、異常が認められた場合には減量又は休薬等の適切な処置を行うこと。

5. 高齢者への投与

(1) 高齢者では、抗コリン作用による排尿障害、視調節障害、口渇、便秘等の副作用があらわれやすいので注意すること。

(2) 高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高マグネシウム血症があらわれるおそれがあるので、用量に留意すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していない(使用経験がない)。

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(使用経験が少くない)。

8. 適用上の注意

薬剤交付時(配合錠)

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に刺入し、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

便が濃緑色を呈したり、便臭が希薄になることがある。

【臨床成績】

臨床効果

胃潰瘍、十二指腸潰瘍及び胃炎の患者1,135例を対象とした一般臨床試験において、本剤の有用性が認められた。

(1)(2)(3)(4)(5)(6)(7)(8)

【有効成分に関する理化学的知見】

1. 一般名：銅クロロフィリンナトリウム

(Sodium Copper Chlorophyllin)

化学名：a型とb型の混合物である

(a型)copper complex salt of 1, 3, 5, 8-tetramethyl-4-ethyl-2-vinyl-9-oxo-10-carboxylphorbins-7-propionic acid disodium

(b型)copper complex salt of 1, 5, 8-trimethyl-4-ethyl-2-vinyl-3-formyl-9-oxo-10-carboxylphorbins-7-propionic acid disodium

分子式：(a型) $C_{34}H_{30}O_5N_4CuNa_2$

(b型) $C_{34}H_{28}O_6N_4CuNa_2$

分子量：(a型)684.16

(b型)698.15

物理化学的性状：

銅クロロフィリンナトリウムは青黒色～緑黒色の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なおいがある。

本品は水に溶けやすく、エタノール(95)又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

本品の水溶液(1→100)のpHは9.5～11.0である。

本品は吸湿性である。

2. 一般名：プロパンテリン臭化物

(Propantheline Bromide)

化学名：*N*-Methyl-*N*, *N*-bis(1-methylethyl)-2-[(9*H*-xanthen-9-ylcarbonyl)oxy]ethylammonium bromide

分子式： $C_{23}H_{30}BrNO_3$

分子量：448.39

物理化学的性状：

プロパンテリン臭化物は白色～帯黄白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は極めて苦い。

本品は水、エタノール(95)、酢酸(100)又はクロロホルムに極めて溶けやすく、無水酢酸にやや溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

本品1.0gを水50mLに溶かした液のpHは5.0～6.0である。

融点：約161℃(分解、ただし乾燥後)

3. 一般名：ケイ酸マグネシウム
(Magnesium Silicate)

化学名：magnesium silicate hydrate

分子式： $Mg_2Si_3O_8 \cdot xH_2O$

分子量：260.86 + x18.02

物理化学的性状：

ケイ酸マグネシウムは白色の微細な粉末で、
におい及び味はない。
本品は水、エタノール(95)又はジエチルエー
テルにほとんど溶けない。

**【取扱い上の注意】

- **1. 光により退色、湿気により退色及びプロパンテリン臭化
物の含量が低下することがあるため、配合錠PTP包装の
アルミ袋開封後は、光を遮り湿気を避けて保存すること。
2. PTPシート・分包から取り出して調剤しないこと。

*【包 装】

- *メサフィリン配合散……………105g(分包1.0g×3×35)
1.26kg(分包1.0g×3×420)
メサフィリン配合錠……………100錠(PTP)・1000錠(PTP)

【主要文献】

| | 文献請求番号 |
|--|----------|
| ① 岸清一郎ら：基礎と臨床, 12, 1622 (1978) | MGL-0006 |
| ② 安斉幸夫ら：臨牀と研究, 55, 226 (1978) | MGL-0004 |
| ③ 市岡四象ら：臨牀と研究, 55, 2854 (1978) | MGL-0007 |
| ④ 福本四郎ら：新薬と臨牀, 43, 1454 (1994) | MGL-0038 |
| ⑤ 斉藤利彦ら：新薬と臨牀, 43, 1461 (1994) | MGL-0039 |
| ⑥ 池延東男ら：新薬と臨牀, 43, 1468 (1994) | MGL-0040 |
| ⑦ 小原勝敏ら：新薬と臨牀, 43, 1475 (1994) | MGL-0041 |
| ⑧ 芦田 潔ら：新薬と臨牀, 43, 1481 (1994) | MGL-0042 |
| ⑨ Aarsen, P.N. et al. : Brit. J. Pharmacol., 17, 41 (1961) | MGL-0010 |
| ⑩ 北川晴雄ら：日本薬理学雑誌, 59, 401 (1963) | MGL-0011 |
| ⑪ Yusuf, S.M. et al. : Arch. Int. Pharmacodyn. Ther., 152, 198 (1964) | MGL-0012 |
| ⑫ 高橋 坦：総合医学, 8, 527 (1951) | MGL-0020 |
| ⑬ 武部敏夫：薬局, 20, 1433 (1969) | MGL-0013 |
| ⑭ 佐藤靖夫：臨床消化器病学, 2, 663 (1954) | MGL-0015 |
| ⑮ Smith, L. W. et al. : J. Lab. Clin. Med., 29, 241 (1944) | MGL-0022 |
| ⑯ 岡部 進ら：応用薬理, 13, 835 (1977) | MGL-0002 |
| ⑰ 村上 学ら：応用薬理, 17, 683 (1979) | MGL-0017 |

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

エーザイ株式会社 hhcホットライン
フリーダイヤル 0120-419-497

製造販売元



サンノーバ株式会社

群馬県太田市世良田町3038-2

販売元



エーザイ株式会社

東京都文京区小石川4-6-10

SU18283-5

