

貯法	室温保存(「取扱い上の注意」の項参照)
使用期限	外箱等に最終年月表示

承認番号	2.5mg: 22400AMX01149000 5mg: 22400AMX01150000
* 薬価収載	2012年12月
* 販売開始	2012年12月
** 効能追加	2020年9月

消化管運動機能改善剤

日本薬局方 **モサプリドクエン酸塩錠**
モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」
モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」
MOSAPRIDE CITRATE Tablets 2.5mg・5mg「MEIJI」







【組成・性状】

(1)組成

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」又はモサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」は、1錠中にそれぞれ下記の成分を含有する。

販売名	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」	モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」
有効成分	日局モサプリドクエン酸塩水和物 2.65mg (モサプリドクエン酸塩として2.5mg)	5.29mg (モサプリドクエン酸塩として5mg)
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、タルク、酸化チタン、マクロゴール6000、カルナウバロウ	

(2)製剤の性状

販売名	剤形	色	外形			重量 (mg)
			表	裏	側面	
モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」	フィルムコーティング錠	白色				82.5
モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」	割線入りフィルムコーティング錠	白色				113

【効能・効果】**

○慢性胃炎に伴う消化器症状(胸やけ、悪心・嘔吐)

**○経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助

** 効能・効果に関連する使用上の注意

＜経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助の場合＞

塩化ナトリウム、塩化カリウム、炭酸水素ナトリウム及び無水硫酸ナトリウム含有経口腸管洗浄剤(ニフレック配合内用剤)以外の経口腸管洗浄剤との併用による臨床試験は実施されていない。

【用法・用量】**

○慢性胃炎に伴う消化器症状(胸やけ、悪心・嘔吐)

通常、成人には、モサプリドクエン酸塩として1日15mgを3回に分けて食前または食後に経口投与する。

**○経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助

通常、成人には、経口腸管洗浄剤の投与開始時にモサプリドクエン酸塩として20mgを経口腸管洗浄剤(約180mL)で経口投与する。また、経口腸管洗浄剤投与終了後、モサプリドクエン酸塩として20mgを少量の水で経口投与する。

** 用法・用量に関連する使用上の注意

＜経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助の場合＞

経口腸管洗浄剤の「用法・用量」及び「用法・用量に関連する使用上の注意」を必ず確認すること。

【使用上の注意】**

(1)重要な基本的注意

- 1)本剤を慢性胃炎に伴う消化器症状に用いる際には、一定期間(通常2週間)投与後、消化器症状の改善について評価し、投与継続の必要性について検討すること。
- 2)劇症肝炎や重篤な肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、長期にわたって漫然と投与しないこと。なお、本剤投与中は、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、患者に対し、本剤投与後に倦怠感、食欲不振、尿濃染、眼球結膜黄染等の症状があらわれた場合は、本剤を中止し、医師等に連絡するよう指導すること。

**3)本剤を経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助に用いる際には、経口腸管洗浄剤の添付文書に記載されている警告、禁忌、慎重投与、重要な基本的注意、重大な副作用等の使用上の注意を必ず確認すること。

(2)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
抗コリン作用を有する薬剤 アトロピン ブチルスコポラミン等	本剤の作用が減弱する可能性があるため、抗コリン剤を服用する場合は、服用間隔をあけるなど注意すること。	本剤の消化管運動の促進作用は、コリン作動性神経の賦活により発現するため、抗コリン剤の併用により本剤の作用が抑制される。

(3)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)

劇症肝炎、肝機能障害、黄疸

劇症肝炎、著しいAST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -GTPの上昇等を伴う重篤な肝機能障害、黄疸があらわれることがあり、死亡に至った例もあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

****2)その他の副作用**

<慢性胃炎に伴う消化器症状(胸やけ、悪心・嘔吐)の場合>

種類\頻度	頻度不明
過敏症	浮腫、蕁麻疹、発疹
血液	好酸球増多、白血球減少
消化器	下痢・軟便、口渇、腹痛、嘔気・嘔吐、味覚異常、腹部膨満感、口内しびれ感(舌、口唇等を含む)
肝臓	ALT (GPT)、AST (GOT)、ALP、 γ -GTP、ビリルビンの上昇
循環器	心悸亢進
精神神経系	めまい・ふらつき、頭痛
その他	倦怠感、中性脂肪の上昇、振戦

**** <経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助の場合>**

種類\頻度	頻度不明
** 消化器	腹部膨満感、嘔気、腹痛、胃部不快感、おくび
** 肝臓	ビリルビンの上昇
** 精神神経系	頭痛、眠気
** その他	胸部不快感、寒気、倦怠感、顔面腫脹、尿潜血、尿蛋白、LDHの上昇

(4)高齢者への投与

一般に高齢者では腎機能、肝機能等の生理機能が低下しているので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。なお、慢性胃炎に伴う消化器症状に用いる際に、副作用が発現した場合には、減量(例えば1日7.5mg)するなど適切な処置を行うこと。

(5)妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 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。]
- 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合は、授乳を中止させること。[動物実験(ラット)で乳汁への移行が報告されている。]

(6)小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。[使用経験がない。]

(7)適用上の注意

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。]

(8)その他の注意

げっ歯類に臨床通常用量の100~330倍(30~100mg/kg/日)を長期間経口投与した試験(ラット104週間、マウス92週間)において、腫瘍(肝細胞腺腫および甲状腺濾胞性腫瘍)の発生率の上昇が認められた。

【薬物動態】

(1)生物学的同等性試験^{1,2)}

モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(モサプリドクエン酸塩として5mg)健康成人男子に絶食単回経口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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

また、モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

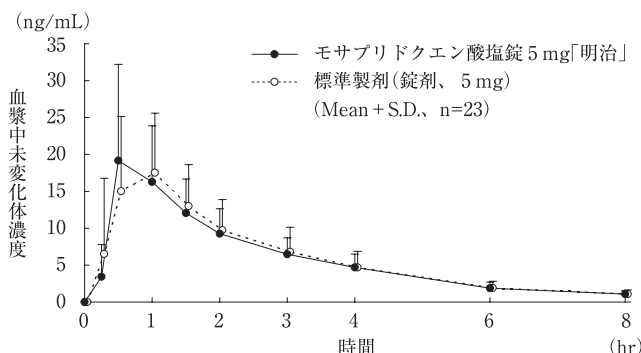


図 5mg錠投与時の血漿中未変化体濃度推移

表 薬物動態パラメータ

	被験者数	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」	23	47.5 ± 17.6	22.5 ± 9.9	0.8 ± 0.6	1.88 ± 0.27
標準製剤(錠剤, 5mg)	23	48.5 ± 18.1	21.7 ± 9.4	0.9 ± 0.3	1.85 ± 0.26

Mean ± S. D.

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。

(2)溶出挙動³⁾

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」及びモサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」は、日本薬局方医薬品各条に定められたモサプリドクエン酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】**

選択的セロトニン5-HT₄受容体作用薬。消化管壁内神経叢に存在する5-HT₄受容体を刺激し、アセチルコリン遊離の増大を介して消化管運動促進及び胃排出促進作用を示すと考えられている。⁴⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

性状：モサプリドクエン酸塩水和物は白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。

本品はN,N-ジメチルホルムアミド又は酢酸(100)に溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

本品のN,N-ジメチルホルムアミド溶液(1→20)は旋光性を示さない。

一般名：モサプリドクエン酸塩水和物
Mosapride Citrate Hydrate

化学名：4-Amino-5-chloro-2-ethoxy-N-[[(2*RS*)-4-(4-fluorobenzyl)morpholin-2-yl]methyl] benzamide monocitrate dihydrate

分子式：C₂₁H₂₆ClFN₃O₃ · C₆H₈O₇ · 2H₂O

分子量：650.05

構造式：



【主要文献】**

- 1) モサプリドクエン酸塩錠 5 mg「明治」の生物学的同等性試験に関する資料(社内資料)
- 2) モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」の溶出性(生物学的同等性試験)に関する資料(社内資料)
- 3) モサプリドクエン酸塩錠2.5mg・5mg「明治」の溶出性(日本薬局方溶出試験)に関する資料(社内資料)
- ** 4) 第十七改正日本薬局方解説書：C-5558-C-5562, 2016
- 5) モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」の安定性に関する資料(社内資料)
- 6) モサプリドクエン酸塩錠 5 mg「明治」の安定性に関する資料(社内資料)

【取扱い上の注意】

開封後は湿気を避けて保存すること。

安定性試験^{5,6)}

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、モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」及びモサプリドクエン酸塩錠 5 mg「明治」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。

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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下さい。

Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室
〒104-8002 東京都中央区京橋2-4-16
フリーダイヤル(0120)093-396 電話(03)3273-3539
FAX(03)3272-2438

【包 装】

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」
PTP包装 100錠(10錠×10シート)
モサプリドクエン酸塩錠 5 mg「明治」
PTP包装 100錠(10錠×10シート)
420錠(21錠×20シート)
500錠(10錠×50シート)
バラ包装(ボトル入) 1000錠