

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

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「サワイ」 モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」

MOSAPRIDE CITRATE

剤形	錠2.5mg：フィルムコーティング錠 錠5mg：割線入りフィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠2.5mg：1錠中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)含有 錠5mg：1錠中日局モサプリドクエン酸塩水和物5.29mg(モサプリドクエン酸塩として5mg)含有
一般名	和名：モサプリドクエン酸塩水和物 洋名：Mosapride Citrate Hydrate
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8月15日 薬価基準収載年月日：2012年12月14日 発売年月日：2012年12月14日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-6394-7355 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2020年9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、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ<https://www.pmda.go.jp/>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、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)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を掲載する医薬品情報提供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、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページ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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	20
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	20
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	20
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	20
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	20
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	20
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	20
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	20
5. 化学名(命名法)	2	8. 副作用	21
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	22
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	22
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	22
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	22
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	22
3. 有効成分の確認試験法	5	14. 適用上の注意	22
4. 有効成分の定量法	5	15. その他の注意	23
IV. 製剤に関する項目	6	16. その他	23
1. 剤形	6	IX. 非臨床試験に関する項目	24
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	24
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	2. 毒性試験	24
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	X. 管理的事項に関する項目	25
5. 調製法及び溶解後の安定性	9	1. 規制区分	25
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	9	2. 有効期間又は使用期限	25
7. 溶出性	9	3. 貯法・保存条件	25
8. 生物学的試験法	12	4. 薬剤取扱い上の注意点	25
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	12	5. 承認条件等	26
10. 製剤中の有効成分の定量法	12	6. 包装	26
11. 力価	12	7. 容器の材質	26
12. 混入する可能性のある夾雑物	12	8. 同一成分・同効薬	26
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	12	9. 国際誕生年月日	26
14. その他	12	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	26
V. 治療に関する項目	13	11. 薬価基準収載年月日	26
1. 効能又は効果	13	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	27
2. 用法及び用量	13	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	27
3. 臨床成績	13	14. 再審査期間	27
VI. 薬効薬理に関する項目	15	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	27
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15	16. 各種コード	27
2. 薬理作用	15	17. 保険給付上の注意	27
VII. 薬物動態に関する項目	16	XI. 文献	28
1. 血中濃度の推移・測定法	16	1. 引用文献	28
2. 薬物速度論的パラメータ	17	2. その他の参考文献	28
3. 吸収	18	XII. 参考資料	29
4. 分布	18	1. 主な外国での発売状況	29
5. 代謝	18	2. 海外における臨床支援情報	29
6. 排泄	19	XIII. 備考	29
7. トランスポーターに関する情報	19	その他の関連資料	29
8. 透析等による除去率	19		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg/錠5mg「サワイ」は、日局モサプリドクエン酸塩水和物を含有する消化管運動機能改善剤である。

モサプリドクエン酸塩は、選択的セロトニン5-HT₄受容体作用薬で¹⁾、構造にホルホリン環をもつ新規ベンズアミド化合物である。²⁾

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号(平成21年3月4日 薬食発第0304004号により一部改正)
承認	2012年8月
上市	2012年12月

2020年9月に「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」の効能・効果及び用法・用量が追加承認された。(X. -12. 参照)

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 有効成分の苦味をマスキングしたフィルムコーティング錠である。
- 2) 選択的5-HT₄受容体作用薬であり、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。¹⁾
- 3) ドパミンD₂受容体遮断作用を持たないため、錐体外路症状等の中枢神経系の副作用及び乳汁分泌や女性化乳房等の内分泌系の副作用を示さないとされている。³⁾
- 4) 重大な副作用として、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸が報告されている(頻度不明)。

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」

モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」

2) 洋名

MOSAPRIDE CITRATE

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

モサプリドクエン酸塩水和物(JAN)

2) 洋名(命名法)

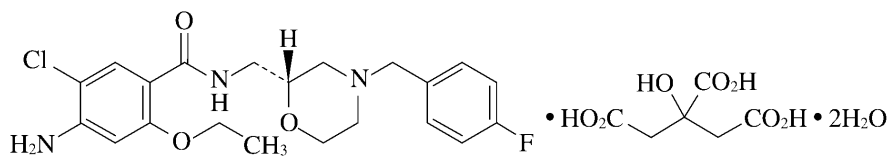
Mosapride Citrate Hydrate(JAN)

Mosapride(INN)

3) ステム

-pride : sulpiride誘導体(抗潰瘍剤、精神神経用剤)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{21}H_{25}ClFN_3O_3 \cdot C_6H_8O_7 \cdot 2H_2O$

分子量 : 650.05

5. 化学名(命名法)

4-Amino-5-chloro-2-ethoxy-*N*-{[(2*RS*)-4-(4-fluorobenzyl)morpholin-2-yl]methyl} benzamide monocitrate dihydrate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：クエン酸モサプリド

7. CAS登録番号

636582-62-2 [Mosapride Citrate Hydrate]

112885-41-3 [Mosapride]

Ⅲ. 有効成分に関する項目

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～帯黄白色の結晶性の粉末である。

無臭で、味はわずかに苦い。¹⁾

2) 溶解性

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。

¹⁾

溶媒	本品 1 gを溶解するための溶媒量
<i>N, N</i> -ジメチルホルムアミド	約 4 mL
酢酸(100)	約 4 mL
メタノール	約60mL
エタノール(99.5)	約250mL

溶解度(37°C)⁴⁾ : pH1.2 : 0.152mg/mL、pH4.0 : 0.246mg/mL、pH6.8 : 0.002mg/mL、水 : 1.62mg/mL

3) 吸湿性

水分 : 5.0～6.5% (0.5g、容量滴定法、逆滴定)

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

pKa=6.20(モルホリン環、滴定法)⁴⁾

6) 分配係数

910(クロロホルム/水系、pH 7)⁵⁾

7) その他の主な示性値

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。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

水⁴⁾ : 37°C、24時間は安定である。

液性(pH)⁴⁾ : pH1.2、pH4.0及びpH6.8において、37°C、24時間は安定である。

3. 有効成分の確認試験法

日局「モサプリドクエン酸塩水和物」の確認試験に準ずる。

- 1) 紫外可視吸光度測定法
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法
- 3) クエン酸塩の定性反応




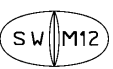
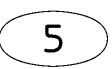
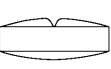
4. 有効成分の定量法

日局「モサプリドクエン酸塩水和物」の定量法に準ずる。(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

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
モサプリド クエン酸塩錠2.5mg 「サワイ」	フィルム コーティング錠	 6.1	 約78	 3.1	白色
モサプリド クエン酸塩錠5mg 「サワイ」	割線入りフィルム コーティング錠	 10.1×5.1	 約155	 3.7	白色

2) 製剤の物性

製剤均一性：日局モサプリドクエン酸塩錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局モサプリドクエン酸塩錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、45分：80%以上)

3) 識別コード

- モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」：SW M11
- モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」：SW M12

4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量

●モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」

1錠中に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)を含有する。

●モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」

1錠中に日局モサプリドクエン酸塩水和物5.29mg(モサプリドクエン酸塩として5mg)を含有する。

2) 添加物

添加剤として、カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000、D-マンニトールを含有する。

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

●モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁶⁾

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.7	100.7

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁷⁾

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で硬度低下が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C3ヵ月)	湿度(25°C75%RH)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	6.7	6.4	4.6	4.6
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.8	100.7	99.7

保存条件	イニシャル	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし
硬度(kg)	6.7	5.7	5.1
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.3	101.1

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

IV. 製剤に関する項目

●モサプリドクエン酸塩錠 5 mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁸⁾

モサプリドクエン酸塩錠 5 mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.9	101.7

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)⁸⁾

モサプリドクエン酸塩錠 5 mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.9	101.8

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性試験⁹⁾

モサプリドクエン酸塩錠 5 mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度及び室温の条件下で硬度低下が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度(25°C75%RH)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	13.9	11.9	10.4	7.6
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.0	99.7	99.9

保存条件	イニシャル	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	13.9	10.8	11.6	9.0
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.9	99.9	99.8

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

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……………

本製剤は、日本薬局方に定められた規格に適合していることが確認されている。

<溶出挙動における同等性及び類似性>

●モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」¹⁰⁾

通知等	「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」：平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH6.8)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」	
標準製剤	モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」	

【結果及び考察】

<50rpm：pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm：pH5.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm：pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

IV. 製剤に関する項目

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<100rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

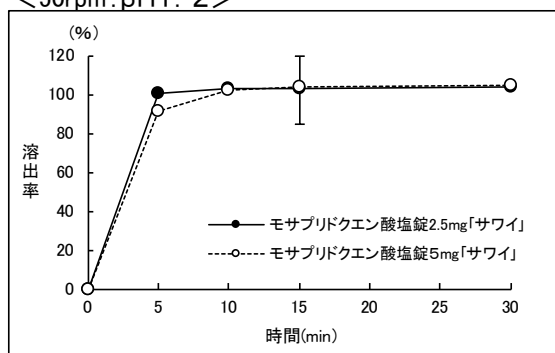
最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

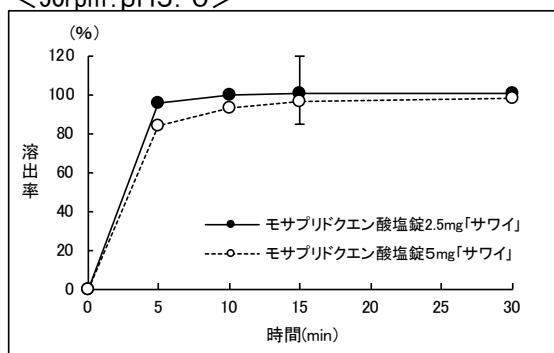
本剤の処方変更水準はB水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。

(溶出曲線)

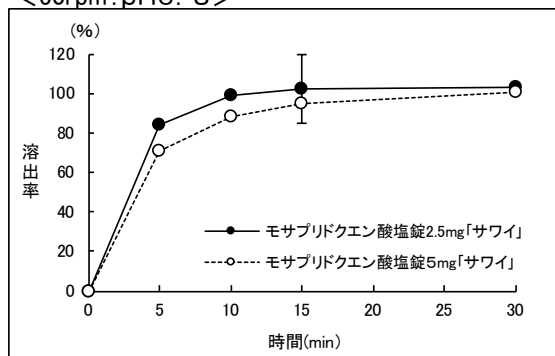
<50rpm : pH1. 2>



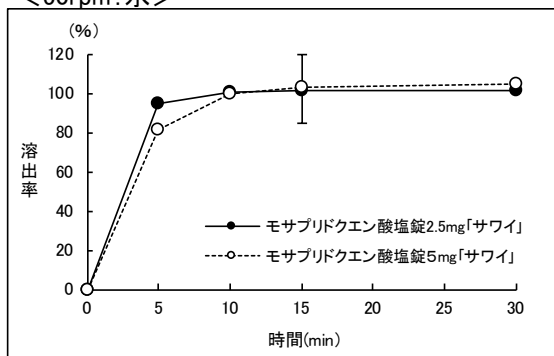
<50rpm : pH5. 0>



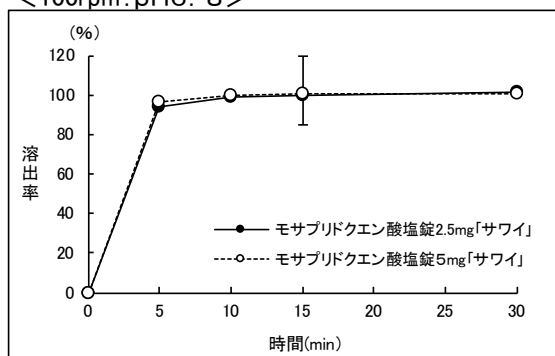
<50rpm : pH6. 8>



<50rpm : 水>



<100rpm : pH6. 8>



([] : 判定基準の適合範囲)

●モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」^{11,12)}

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成18年11月24日 薬食 審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、3.0、6.8、水)、100rpm (pH6.8)
試験回数	12 ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH3.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

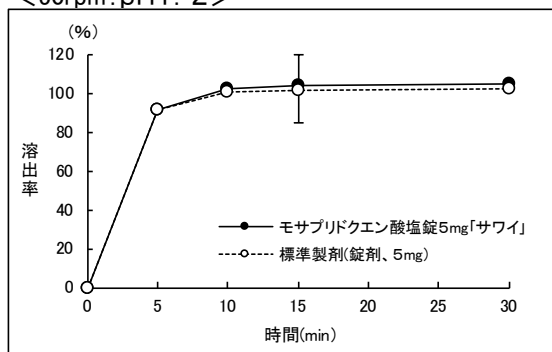
<100rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

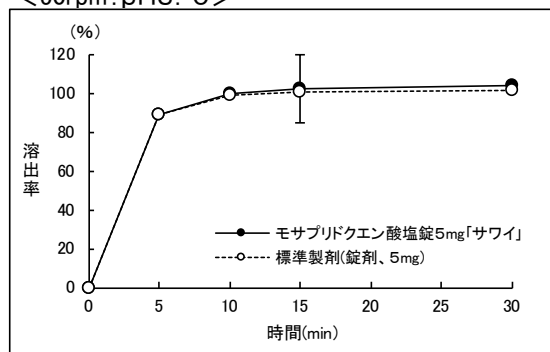
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

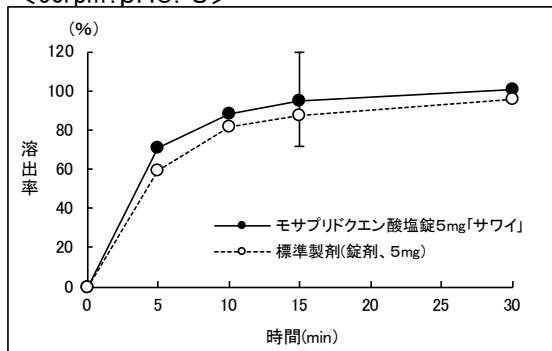
<50rpm : pH1.2>



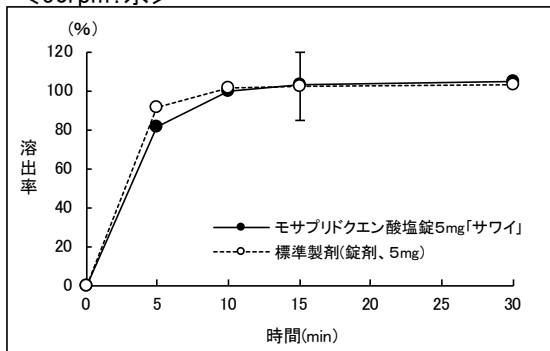
<50rpm : pH3.0>



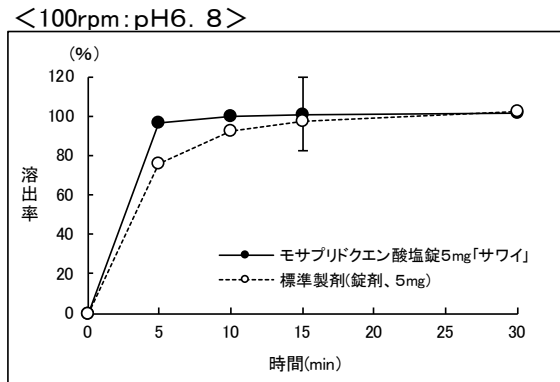
<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



IV. 製剤に関する項目



([] : 判定基準の適合範囲)

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
日局「モサプリドクエン酸塩錠」の確認試験に準ずる。
1) ドラーゲンドルフ試液による沈殿反応
2) 紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法
日局「モサプリドクエン酸塩錠」の定量法に準ずる。(紫外可視吸光度測定法)

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
該当資料なし

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

- 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

＜効能又は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＞

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。

2. 用法及び用量

- 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。

＜用法及び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。

3. 臨床成績

1) 臨床データパッケージ

該当しない

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

V. 治療に関する項目

(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……………
メトクロプラミド、ドンペリドン、イトプリド塩酸塩等

2. 薬理作用……………
モサプリドの薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

モサプリドは、選択的5-HT₄受容体作用薬であり、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。¹⁾

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

モサプリドクエン酸塩錠剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

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

VII. -1. -3) 参照

3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

●モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」¹⁰⁾

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」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(平成18年11月24日付 薬食審査発第1124004号)」に基づき、モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」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。(IV. -7. 参照)

●モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」^{11,13)}

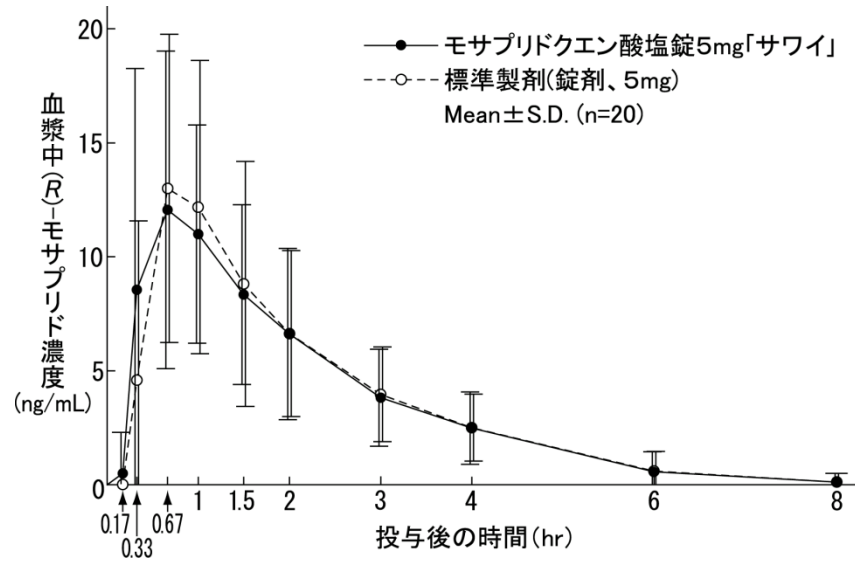
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、0.17、0.33、0.67、1、1.5、2、3、4、6、8 hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(モサプリドクエン酸塩として5mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中(R)-モサプリド濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} (ng·hr/mL)
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「サワイ」	15.81±6.90	0.7±0.4	1.4±0.3	28.76±14.85
標準製剤(錠剤、5mg)	15.89±7.19	0.8±0.3	1.5±0.2	28.94±15.21

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびに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。

4) 中毒域

該当資料なし

5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

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

VII. -1. -3) 参照

4) 消失速度定数

●モサプリドクエン酸塩錠 5 mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(モサプリドクエン酸塩として 5 mg)空腹時単回経口投与した場合の(R)-モサプリドの消失速度定数^{11,13)}

0.500±0.100hr⁻¹

VII. 薬物動態に関する項目

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

99%¹⁾

3. 吸収

<参考>主として小腸上部(ラット)¹⁴⁾

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

<参考>動物実験(ラット)で乳汁への移行が報告されている。

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

主として肝臓¹⁾

2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

主としてCYP3A4で代謝される。¹⁾

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

主代謝物(4-フルオロベンジル基脱離体)は活性がある。⁵⁾

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

尿中、糞便中¹⁴⁾

2) 排泄率

尿中排泄率は、未変化体として0.1%、主代謝物(4-フルオロベンジル基脱離体)として7%であった。¹⁾

3) 排泄速度

VII. -6. -2) 参照

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)……………
該当しない

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由……………
V. -1. 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……………
V. -2. 参照

5. 慎重投与内容とその理由……………
該当しない

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)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。

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
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。

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

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。

3) その他の副作用

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＞	
	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)、Al-P、 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＞	
	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、顔面腫張、尿潜血、尿蛋白、LDHの上昇

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

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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

副作用	
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>	
	頻度不明
過 敏 症	浮腫、蕁麻疹、発疹

9. 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ため、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。

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。〕
- 2) 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。〕

11. 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)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 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)

15. 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。

16. その他.....

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

LD₅₀ (mg/kg)¹⁵⁾

動物種	性	経口	腹腔内	皮下
マウス	♂	>3,000	>1,000	>1,000
マウス	♀	>3,000	914	>1,000
ラット	♂	>3,000	>1,000	>1,000
ラット	♀	1,905	>1,000	>1,000
イヌ	♂	>400	—	—
イヌ	♀	>400	—	—

2) 反復投与毒性試験

VIII. -15. 参照

3) 生殖発生毒性試験

ラットおよびウサギの生殖試験では催奇形作用は認められなかった。¹⁶⁾

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

規制区分	
製剤	該当しない
有効成分	該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

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)

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

VIII. -14. 参照

**モサプリドクエン酸塩錠「サワイ」を
お飲みになる患者さんへ**

必ずお読みください

このお薬を服用中にごくまれに肝臓の副作用
があらわれることがあります。このお薬の肝臓
の副作用を最小限にするために、次のような症
状がみられましたら、服用を中止し、すぐに主
治医や薬剤師に連絡してください。

- ひどくだるい
- 食欲がない
- 尿が褐色になる
- 皮膚や白目が黄色くなる

この他にも、いつもと違うと感じる症状があら
われた場合には、主治医や薬剤師に相談してく
ださい。

GU9886901PV01
2012年12月作成⑤5

注) 当説明書は変更・改訂される場合があります。

X. 管理的事項に関する項目

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

●モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)

●モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、420錠(21錠×20)、500錠(10錠×50)

バラ：500錠

7. 容器の材質

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

バラ：[本体]ポリエチレン、[キャップ]ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ガスモチン錠5mg/錠2.5mg/散1%

同効薬：メトクロプラミド、ドンペリドン、イトプリド塩酸塩等

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

●モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2012年8月15日、承認番号：22400AMX01004000

●モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2012年8月15日、承認番号：22400AMX01005000

11. 薬価基準収載年月日

●モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」：2012年12月14日

●モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」：2012年12月14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

承認年月日：2020年9月30日

効能・効果内容：「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」の効能・効果を追加した。

用法・用量内容：効能・効果追加に伴い、関連の用法・用量を追加した。

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

品名	HOT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
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「サワイ」	122191601	2399010F1206	622219101
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「サワイ」	122192301	2399010F2202	622219201

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。

XI . 文献

1. 引用文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十七改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2016, C-5558-C-5562.
- 2) 南山堂 医学大辞典, 第19版, 南山堂, 2006, p. 2492.
- 3) JAPAN DRUGS編集委員会編, JAPAN DRUGS 日本医薬品総覧, 2008~2009年版, メディカルレビュー社, 2008, p. 1997.
- 4) 日本公定書協会編, 医療用医薬品 品質情報集, No. 27, 薬事日報社, 2007, p. 182.
- 5) 平田純生他編, 透析患者への投薬ガイドブック 慢性腎臓病(CKD)の薬物治療, 改訂3版, じほう, 2017, p. 570.
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験]モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験]モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「サワイ」
- 11) 陶易王他, 診療と新薬, **49**(8), 1037(2012).
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」
- 13) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]モサプリドクエン酸塩錠5mg「サワイ」
- 14) 日本薬剤師研修センター編, 日本薬局方 医薬品情報 2011 JPDI 2011, じほう, 2011, p. 2051-2056.
- 15) The Merck Index 14th edition, 2006, p. 1084
- 16) 林昌洋他編, 実践 妊娠と薬 第2版-10,000例の相談事例とその情報-, じほう, 2010, p. 618-620.

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

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

