

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 2008 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「明治」

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」

MOSAPRIDE CITRATE Tablets 2.5mg・5mg「MEIJI」

剤形	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	モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「明治」: 1錠中 日局モサプリドクエン酸塩水和物をモサプリドクエン酸塩として 2.5mg 含有 モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」: 1錠中 日局モサプリドクエン酸塩水和物を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 (JAN) 洋名: Mosapride Citrate Hydrate (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 : 2012年 8月 15日 製造販売一部変更承認年月日 : 2020年 9月 30日 (効能・効果、用法・用量追加による) 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: Meiji Seika ファルマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室 TEL: (0120)093-396、(03)3273-3539 FAX: (03)3272-2438 受付時間 9時~17時(土・日・祝日及び当社休業日を除く) 医療関係者向けホームページ https://www.meiji-seika-pharma.co.jp/medical/

本 IF はモサプリドクエン酸塩錠 2.5mg・5mg「明治」2020年9月改訂(第3版)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、医薬品医療機器情報提供ホームページ <https://www.info.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 年が経過した現在、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新たな IF 記載要領が策定された。

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 判、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、添付文書で赤字・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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」は、平成 21 年 4 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 2008」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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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があり、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、今後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。

(2008 年 9 月)

目 次

I. 概要に関する項目

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

1. 販売名 …………… 2
 - (1) 和名 …………… 2
 - (2) 洋名 …………… 2
 - (3) 名称の由来 …………… 2
2. 一般名 …………… 2
 - (1) 和名 (命名法) …………… 2
 - (2) 洋名 (命名法) …………… 2
 - (3) システム …………… 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 …………… 3
7. CAS 登録番号 …………… 3

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 …………… 4
 - (1) 外観・性状 …………… 4
 - (2) 溶解性 …………… 4
 - (3) 吸湿性 …………… 4
 - (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点 …………… 4
 - (5) 酸塩基解離定数 …………… 4
 - (6) 分配係数 …………… 4
 - (7) その他の主な示性値 …………… 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 …… 4
3. 有効成分の確認試験法 …………… 5
4. 有効成分の定量法 …………… 5

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形 …………… 6
 - (1) 剤形の区別、規格及び性状 …………… 6
 - (2) 製剤の物性 …………… 6
 - (3) 識別コード …………… 6
 - (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等 …………… 6
2. 製剤の組成 …………… 6
 - (1) 有効成分 (活性成分) の含量 …………… 6
 - (2) 添加物 …………… 6
 - (3) その他 …………… 6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 …… 6
4. 製剤の各種条件下における安定性 …………… 7
5. 調製法及び溶解後の安定性 …………… 10
6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化) …… 10
7. 溶出性 …………… 10
8. 生物学的試験法 …………… 15

9. 製剤中の有効成分の確認試験法 …………… 15
10. 製剤中の有効成分の定量法 …………… 15
11. 力価 …………… 15
12. 混入する可能性のある夾雑物 …………… 15
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 …… 15
14. その他 …………… 15

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果 …………… 16
2. 用法及び用量 …………… 16
3. 臨床成績 …………… 16
 - (1) 臨床データパッケージ …………… 16
 - (2) 臨床効果 …………… 16
 - (3) 臨床薬理試験：忍容性試験 …………… 16
 - (4) 探索的試験：用量反応探索試験 …… 16
 - (5) 検証的試験 …………… 16
 - 1) 無作為化並行用量反応試験 …… 16
 - 2) 比較試験 …………… 16
 - 3) 安全性試験 …………… 16
 - 4) 患者・病態別試験 …………… 17
 - (6) 治療的使用 …………… 17
 - 1) 使用成績調査・特定使用成績調査・製造販売後臨床試験 …………… 17
 - 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 …………… 17

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 …………… 18
2. 薬理作用 …………… 18
 - (1) 作用部位・作用機序 …………… 18
 - (2) 薬効を裏付ける試験成績 …………… 18
 - (3) 作用発現時間・持続時間 …………… 18

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法 …………… 19
 - (1) 治療上有効な血中濃度 …………… 19
 - (2) 最高血中濃度到達時間 …………… 19
 - (3) 臨床試験で確認された血中濃度 …… 19
 - (4) 中毒域 …………… 20
 - (5) 食事・併用薬の影響 …………… 20
 - (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 …… 20
2. 薬物速度論的パラメータ …………… 20
 - (1) コンパートメントモデル …………… 20
 - (2) 吸収速度定数 …………… 20
 - (3) バイオアベイラビリティ …………… 20
 - (4) 消失速度定数 …………… 20
 - (5) クリアランス …………… 20

(6) 分布容積	20
(7) 血漿蛋白結合率	20
3. 吸収	21
4. 分布	21
(1) 血液-脳関門通過性	21
(2) 血液-胎盤関門通過性	21
(3) 乳汁への移行性	21
(4) 髄液への移行性	21
(5) その他の組織への移行性	21
5. 代謝	21
(1) 代謝部位及び代謝経路	21
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	22
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	22
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	22
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	22
6. 排泄	22
(1) 排泄部位及び経路	22
(2) 排泄率	22
(3) 排泄速度	22
7. 透析等による除去率	22

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	23
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	23
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意 とその理由	23
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 とその理由	23
5. 慎重投与内容とその理由	23
6. 重要な基本的注意とその理由及び 処置方法	23
7. 相互作用	23
(1) 併用禁忌とその理由	23
(2) 併用注意とその理由	23
8. 副作用	24
(1) 副作用の概要	24
(2) 重大な副作用と初期症状	24
(3) その他の副作用	24
(4) 項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	24
(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	24
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び 試験法	24
9. 高齢者への投与	25
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	25
11. 小児等への投与	25
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
13. 過量投与	25
14. 適用上の注意	25
15. その他の注意	25

16. その他	25
---------	----

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	26
(1) 薬効薬理試験	26
(2) 副次的薬理試験	26
(3) 安全性薬理試験	26
(4) その他の薬理試験	26
2. 毒性試験	26
(1) 単回投与毒性試験	26
(2) 反復投与毒性試験	26
(3) 生殖発生毒性試験	26
(4) その他の特殊毒性	26

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	27
2. 有効期間又は使用期限	27
3. 貯法・保存条件	27
4. 薬剤取扱い上の注意点	27
(1) 薬局での取り扱いについて	27
(2) 薬剤交付時の注意 (患者等に留意 すべき必須事項等)	27
5. 承認条件等	27
6. 包装	27
7. 容器の材質	27
8. 同一成分・同効薬	28
9. 国際誕生年月日	28
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	28
11. 薬価基準収載年月日	28
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	28
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及 びその内容	28
14. 再審査期間	28
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	28
16. 各種コード	28
17. 保険給付上の注意	28

XI. 文献

1. 引用文献	29
2. その他の参考文献	29

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	30
2. 海外における臨床支援情報	30

XIII. 備考

その他の関連資料	31
----------	----

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水和物は、本邦で創薬された選択的セロトニン 5-HT₄ 受容体アゴニストで、ドパミン D₂ 受容体遮断作用を示さない消化管運動機能改善剤であり、本邦では 1998 年に上市されている。

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「明治」およびモサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」は、Meiji Seika ファルマ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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、2012 年（平成 24 年）8 月に「慢性胃炎に伴う消化器症状（胸やけ、悪心・嘔吐）」を適応症として承認を取得した。そして、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」に関する効能・効果及び用法・用量の一部変更承認を取得した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 選択的セロトニン 5-HT₄ 受容体作用薬である¹⁾。(18 頁参照)
- (2) 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⁾。(18 頁参照)
- (3) 製剤は、誤薬を防ぐ目的で PTP シートの裏面に薬効の記載がある。また、2.5mg 錠の錠剤裏面には、含量の刻印表示がある。(6 頁参照)
- (4) 5mg 錠には、10 錠 PTP シートのほか、21 錠 PTP シート及びバラ包装がある。(27 頁参照)
- (5) 副作用

重大な副作用（頻度不明）として、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸があらわれることがある。
（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」参照）

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「明治」
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」

(2) 洋名

MOSAPRIDE CITRATE Tablets 2.5mg 「MEIJI」
MOSAPRIDE CITRATE Tablets 5mg 「MEIJI」

(3) 名称の由来

一般名+剤形+規格(含量)+「明治」

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)

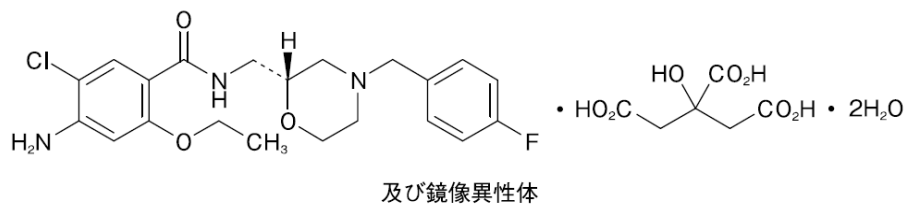
Mosapride Citrate Hydrate (JAN)
Mosapride (INN)

(3) ステム

-pride:スルピリド誘導体(sulpiride derivatives)

3. 構造式又は示性式

構造式:



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

7. CAS 登録番号

636582-62-2

112885-41-3 (Mosapride)

112885-42-4 (Mosapride Citrate)¹⁾

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。
本品は無臭で、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 1g は、*N,N*-ジメチルホルムアミド約 4mL、酢酸(100)約 4mL、メタノール約 60mL、エタノール(99.5)約 250mL に溶ける¹⁾。

溶解度 (37°C)²⁾

pH1.2 : 0.152mg/mL

pH4.0 : 0.246mg/mL

pH6.8 : 0.002mg/mL

水 : 1.62mg/mL

(3) 吸湿性

該当資料なし

以下の報告がある。

25°C、11～98%RH で 5 週間放置し、重量変化を観察した。いずれの相対湿度においても重量変化はなく、吸湿性は認められなかった。なお、低湿度下においても重量減少はなく、結晶水の脱離は認められなかった³⁾。

(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

解離定数 pK_a :6.20 (モルホリン環 滴定法)²⁾

(6) 分配係数

該当資料なし

(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

該当資料なし

溶液²⁾

水 : 37°C、24 時間は安定である。

液性 (pH) : pH1.2、pH 4.0 及び pH 6.8 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

(日本薬局方 モサプリドクエン酸塩水和物の確認試験による)

- (1) 紫外可視吸光度測定法 (波長 271~275nm 及び 306~310nm に吸収の極大を示す) ¹⁾
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)
- (3) クエン酸塩の定性反応(1)

4. 有効成分の定量法







(日本薬局方 モサプリドクエン酸塩水和物の定量法による)

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

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	 直径 6.1mm		 厚さ 2.6mm	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	 長径 9.1mm 短径 4.6mm		 厚さ 3.2mm	113

(2) 製剤の物性

溶出性：「IV. 7. 溶出性」の項を参照のこと。

(3) 識別コード

販売名	製剤本体	PTP シート	
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「明治」	MS 038	meiji	MS038
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」	MS039	meiji	MS039

(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 錠中にそれぞれ下記の成分を含有する。

販売名	有効成分	含量
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「明治」	日局モサプリドクエン酸塩水和物	モサプリドクエン酸塩として 2.5mg
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」		モサプリドクエン酸塩として 5mg

(2) 添加物

販売名	添加物
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「明治」	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
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」	

(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 「明治」

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果	
					試験開始時	試験終了時
4) 加速試験	40℃、75%RH	最終包装形態 (PTP/アルミピロー+箱)	6ヵ月	性状・確認試験・純度試験 (類縁物質)	*1	*1
				製剤均一性	*2	*2
				溶出性 *3	*1 (88.5~97.0%)	*1 (86.5~96.6%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (101.5~101.6%)	*1 (99.8~101.3%)
5) 苛酷試験	50℃	無包装 (褐色ガラス瓶・開栓)	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (2ヵ月まで。経時的に増加し3ヵ月後は規格不適合)
				溶出性 *3	*1 (91.8~94.6%)	*1 (89.6~94.1%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (99.4~100.1%)	*1 (99.9~100.1%)
				硬度 (N)	66.0~75.5 N	65.5~77.5 N
	30℃75%RH	無包装 (褐色ガラス瓶・開栓)	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 *3	*1 (91.8~94.6%)	*1 (85.6~89.0%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (99.4~100.1%)	*1 (100.4~100.9%)
				硬度 (N)	66.0~75.5 N	50.5~57.5 N
	蛍光灯下 (D65ランプ、約1000lux)	無包装 (シャーレ・開放)	約50日 総照射量 120万lux・hr	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 *3	*1 (91.8~94.6%)	*1 (90.4~93.7%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (99.4~100.1%)	*1 (100.8~101.5%)
				硬度 (N)	66.0~75.5 N	46.5~51.0 N
		無包装 (シャーレ・開放・遮光)	約50日 総照射量 120万lux・hr	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1
				溶出性 *3	*1 (91.8~94.6%)	*1 (93.2~95.9%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (99.4~100.1%)	*1 (100.5~101.0%)
				硬度 (N)	66.0~75.5 N	53.0~61.0 N
PTP		約50日 総照射量 120万lux・hr	性状	*1	*1	
			純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)	
			溶出性 *3	*1 (91.8~94.6%)	*1 (87.8~92.3%)	
			定量試験 (対表示量)	*1 (99.4~100.1%)	*1 (99.7~100.6%)	
			硬度 (N)	66.0~75.5 N	49.0~55.5 N	
PTP/アルミピロー	約50日 総照射量 120万lux・hr	性状	*1	*1		
		純度試験 (類縁物質)	*1	*1		
		溶出性 *3	*1 (91.8~94.6%)	*1 (91.4~93.3%)		
		定量試験 (対表示量)	*1 (99.4~100.1%)	*1 (100.4~101.0%)		
		硬度 (N)	66.0~75.5 N	62.5~68.5 N		

*1：本剤の「規格及び試験方法」に適合した。

*2：日本薬局方 製剤均一性 含量均一性試験に適合した。

*3：試験条件：溶出試験第2液、50回転、45分

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果	
					試験開始時	試験終了時
⑥ 通常の環境下における安定性	通常の室内環境下 (温度・湿度：成り行き、 光：室内散乱光)	無包装 (シャーレ・開放)	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 *3	*1 (91.8~94.6%)	*1 (90.8~93.5%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (99.4~100.1%)	*1 (99.6~100.7%)
				硬度 (N)	66.0~75.5 N	43.5~50.0 N
		PTP	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 *3	*1 (91.8~94.6%)	*1 (90.9~92.9%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (99.4~100.1%)	*1 (100.1~100.6%)
				硬度 (N)	66.0~75.5 N	42.5~51.5 N

*1：本剤の「規格及び試験方法」に適合した。

*2：日本薬局方 製剤均一性 含量均一性試験に適合した。

*3：試験条件：溶出試験第2液、50回転、45分

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」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。

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果	
					試験開始時	試験終了時
⑦ 加速試験	40℃、75%RH	最終包装形態 (PTP/アルミピロー (+IDシート)+箱)	6ヵ月	性状・確認試験・純度試験 (類縁物質)	*1	*1
				製剤均一性	*2	*2
				溶出性 *3	*1 (85.1~93.9%)	*1 (81.7~90.0%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (99.8~102.1%)	*1 (100.1~101.4%)
		最終包装形態 (ポリエチレン容器 +箱)	6ヵ月	性状・確認試験・純度試験 (類縁物質)	*1	*1
				製剤均一性	*2	*2
				溶出性 *3	*1 (86.7~91.8%)	*1 (82.1~89.8%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (99.8~102.1%)	*1 (100.0~101.1%)

*1：本剤の「規格及び試験方法」に適合した。

*2：日本薬局方 製剤均一性 含量均一性試験に適合した。

*3：試験条件：溶出試験第2液、50回転、45分

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果	
					試験開始時	試験終了時
苛酷試験 ⁸⁾	50℃	無包装 (褐色ガラス瓶・開栓)	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (2ヵ月まで。経時的に増加し3ヵ月後は規格不適合)
				溶出性 ^{*3}	*1 (86.5~89.9%)	*1 (86.7~90.2%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (100.6~101.1%)
				硬度 (N)	64.0~75.0 N	64.0~76.5 N
	30℃75%RH	無包装 (褐色ガラス瓶・開栓)	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 ^{*3}	*1 (86.5~89.9%)	*1 (79.8~83.3%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (99.9~101.3%)
				硬度 (N)	64.0~75.0 N	55.5~63.0 N
	蛍光灯下 (D65ランプ、 約1000lux)	無包装 (シャーレ・開放)	約50日 総照射量 120万lux・ hr	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 ^{*3}	*1 (86.5~89.9%)	*1 (82.8~86.5%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (100.3~100.9%)
				硬度 (N)	64.0~75.0 N	49.5~57.5 N
		無包装 (シャーレ・開放・ 遮光)		性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1
				溶出性 ^{*3}	*1 (86.5~89.9%)	*1 (85.5~88.3%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (100.7~101.2%)
				硬度 (N)	64.0~75.0 N	54.0~63.0 N
		PTP		性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 ^{*3}	*1 (86.5~89.9%)	*1 (85.2~86.8%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (100.6~101.0%)
				硬度 (N)	64.0~75.0 N	52.5~60.0 N
		PTP/アルミ ピロー (+ID シート)		性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1
				溶出性 ^{*3}	*1 (86.5~89.9%)	*1 (86.5~89.2%)
定量試験 (対表示量)				*1 (100.1~100.4%)	*1 (100.7~101.4%)	
硬度 (N)				64.0~75.0 N	64.5~74.0 N	
バラ (ポリ エチレン容 器)		性状	*1	*1		
		純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)		
		溶出性 ^{*3}	*1 (86.5~89.9%)	*1 (84.0~86.5%)		
		定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (100.7~101.3%)		
		硬度 (N)	64.0~75.0 N	57.0~68.5 N		
バラ (ポリ エチレン容 器) +箱		性状	*1	*1		
		純度試験 (類縁物質)	*1	*1		
		溶出性 ^{*3}	*1 (86.5~89.9%)	*1 (86.4~87.4%)		
		定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (100.3~100.8%)		
		硬度 (N)	64.0~75.0 N	64.5~74.0 N		

*1：本剤の「規格及び試験方法」に適合した。

*2：日本薬局方 製剤均一性 含量均一性試験に適合した。

*3：試験条件：溶出試験第2液、50回転、45分

安定性試験	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	結果	
					試験開始時	試験終了時
⑥ 通常の環境下における安定性	通常 の 室内環境下 (温度・湿度： 成り行き、 光：室内散乱光)	無包装 (シャー レ・開放)	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 *3	*1 (86.5~89.9%)	*1 (84.6~87.4%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (99.6~100.6%)
				硬度 (N)	64.0~75.0 N	51.5~56.0 N
	PTP	3ヵ月	性状	*1	*1	
			純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)	
			溶出性 *3	*1 (86.5~89.9%)	*1 (84.7~87.0%)	
			定量試験 (対表示量)	*1 (100.1~100.4%)	*1 (100.7~100.9%)	
			硬度 (N)	64.0~75.0 N	49.0~55.5 N	
⑨ 二分 割後 の 安定性	通常 の 室内環境下 (温度・湿度： 成り行き、 光：室内散乱光)	二分 割後 (シャー レ・開放)	3ヵ月	性状	*1	*1
				純度試験 (類縁物質)	*1	*1 (増加傾向)
				溶出性 *3	*1 (86.2~96.7%)	*1 (85.8~95.9%)
				定量試験 (対表示量)	*1 (100.3%)	*1 (100.9%)
				硬度 (N)		

*1：本剤の「規格及び試験方法」に適合した。

*2：日本薬局方 製剤均一性 含量均一性試験に適合した。

*3：試験条件：溶出試験第2液、50回転、45分

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 5mg「明治」は通常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

<溶出挙動における類似性>

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「明治」¹⁰⁾

(含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン：平成12年2月14日付 医薬審第64号、一部改正 平成18年11月24日付 薬食審査発1124004号)

試験方法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

試験条件

試験製剤：モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「明治」

標準製剤：モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」

試験液量：900mL、温度：37±0.5℃

試験液：①日局溶出試験法の第1液（pH1.2）

②薄めた McIlvaine の緩衝液（pH3.0）

③日局溶出試験法の第2液（pH6.8）

④：水

回転数：50回転（試験液①～④）、100回転（試験液③）

判定基準

平均溶出率：

試験液①②④（50回転）、③（100回転）：

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。

試験液③（50回転）：

標準製剤が15～30分に平均85%以上溶出する場合：標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又はf2関数の値が50以上である。

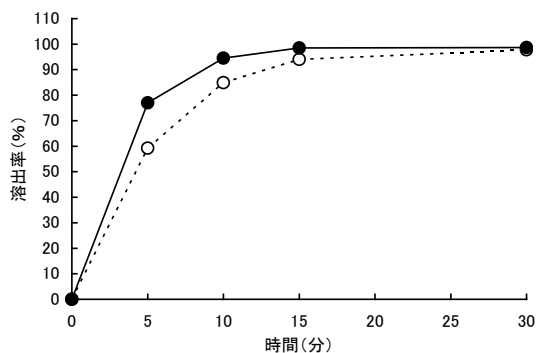
個々の溶出率：

最終比較時点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い。

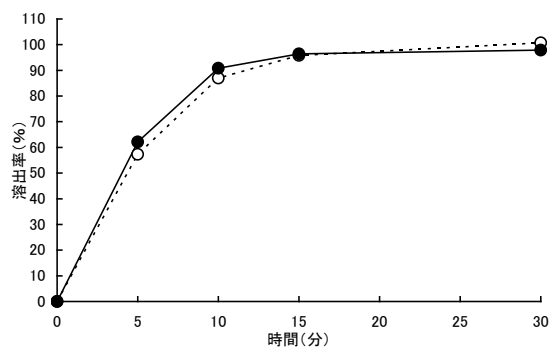
結果

標準製剤と試験製剤の溶出挙動の同等性を評価した結果、判定基準に適合し、両製剤の溶出挙動が同等と判定されたことから、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であるとみなされた。

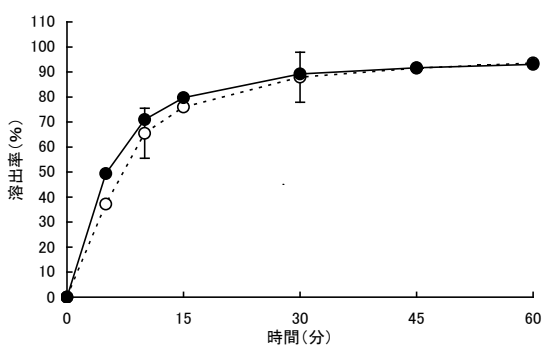
試験液①：pH1.2、50回転



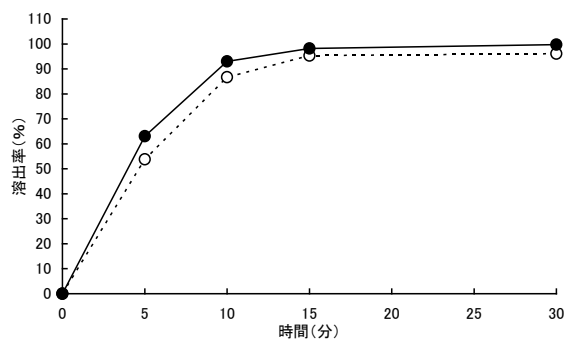
試験液②：pH3.0、50回転



試験液③：pH6.8、50回転



試験液④：水、50回転



試験液③：pH6.8、100回転

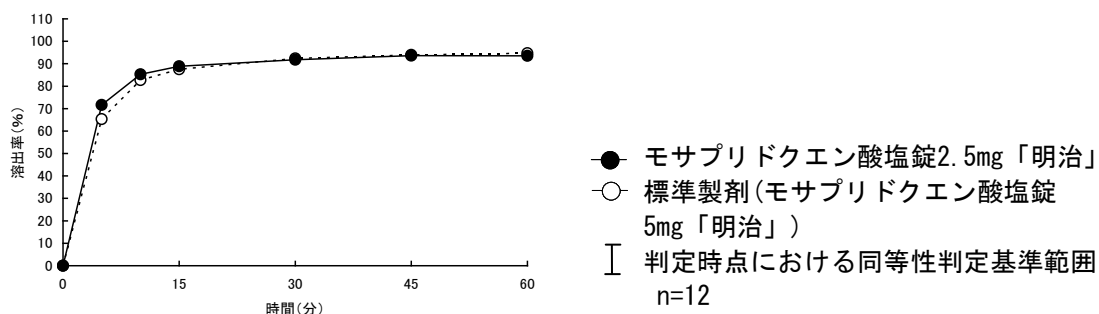


表 試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

試験条件				試験製剤 (モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「明治」)	標準製剤 (モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
溶出試験法 (パドル法)	50	pH1.2	15分	98.5	94.0	適合
		pH3.0	15分	96.4	95.8	適合
		pH6.8	10分	71.0	65.5	適合
			30分	89.2	87.9	適合
		水	15分	98.2	95.3	適合
	100	pH6.8	15分	88.9	87.5	適合

(n=12)

表 試験製剤の個々の溶出率の比較

試験条件				モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「明治」		判定
方法	回転数	試験液	判定時点	個々の溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
溶出試験法 (パドル法)	50	pH1.2	15分	98.8、97.9、96.0、99.0、99.7、99.5、100.4、97.2、99.3、99.1、96.3、98.6	98.5	適合
		pH3.0	15分	95.8、100.0、99.1、98.9、99.2、98.3、96.6、97.0、95.3、90.5、91.3、94.6	96.4	適合
		pH6.8	30分	88.2、89.3、90.8、91.4、88.6、89.0、87.7、89.7、89.6、89.7、88.5、87.6	89.2	適合
			水	15分	97.0、96.1、94.9、96.1、97.2、94.9、101.5、100.4、101.6、100.5、99.0、99.4	98.2
		100	pH6.8	15分	88.4、86.5、89.0、88.0、87.8、87.1、89.6、89.2、91.5、90.0、90.0、89.9	88.9

(n=12)

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」¹¹⁾

(後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日付 医薬審第487号、一部改正 平成18年11月24日付 薬食審査発1124004号)

試験方法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法（パドル法）

試験条件

試験液量：900mL、温度：37±0.5℃

試験液：①日局溶出試験法の第1液（pH1.2）

②薄めた McIlvaine の緩衝液（pH5.0）

③日局溶出試験法の第2液（pH6.8）

④：水

回転数：50回転（試験液①～④）、100回転（試験液③）

判定基準

試験液①②④（50回転）：

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

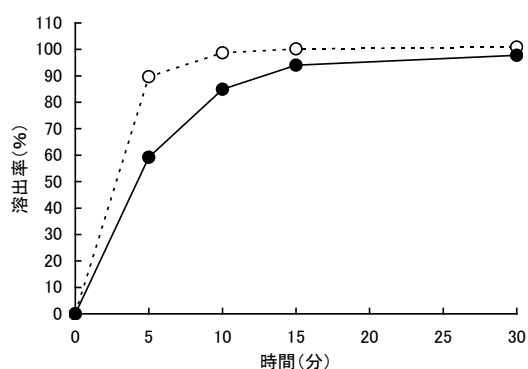
試験液③（50回転及び100回転）：

標準製剤が15～30分に平均85%以上溶出する場合：標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。

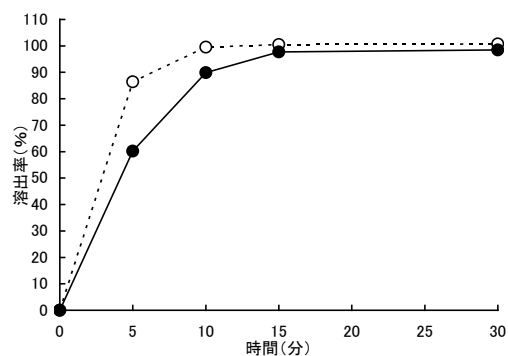
結果

各試験条件におけるモサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」の溶出挙動は判定基準に適合し、標準製剤との溶出挙動の類似性が確認された。

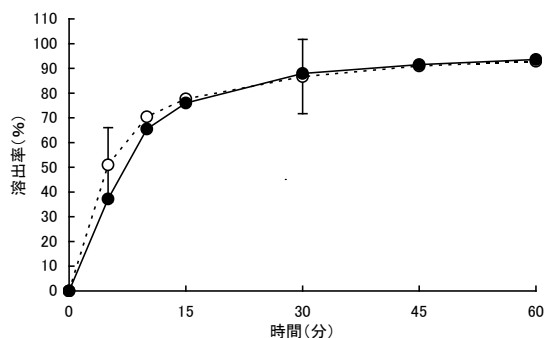
試験液①：pH1.2、50回転



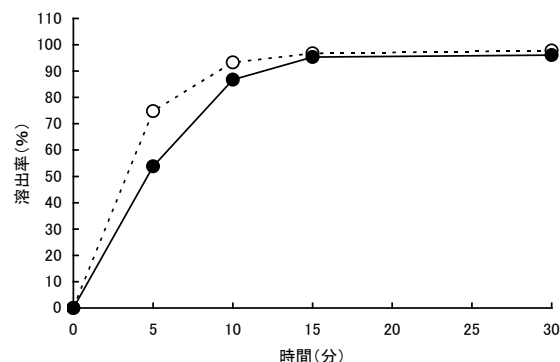
試験液②：pH5.0、50回転



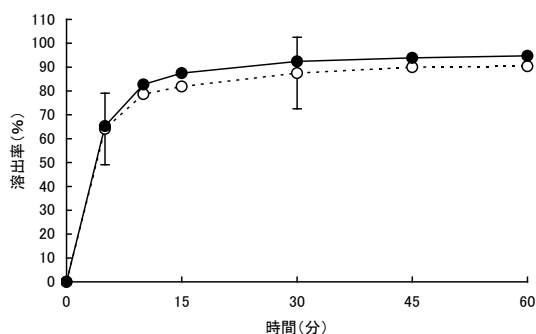
試験液③：pH6.8、50回転



試験液④：水、50回転



試験液③：pH6.8、100回転



● モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」
○ 標準製剤(錠剤、5mg)
I 判定時点における同等性判定基準範囲
n=12

表 試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

試験条件				モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」	標準製剤(錠剤、5mg)	判定
方法	回転数	試験液	判定時点	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
溶出試験法(パドル法)	50	① pH1.2	15分	94.0	100.2	適合
		② pH5.0	15分	97.7	100.5	適合
		③ pH6.8	5分 30分	37.2 87.9	51.0 86.7	適合
		④ 水	15分	95.3	96.7	適合
	100	③ pH6.8	5分 30分	65.3 92.4	64.1 87.5	適合

(n=12)

<公的溶出規格への適合性> ¹²⁾

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。

試験方法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)

試験条件

回転数：50回転

試験液：溶出試験第2液、900mL

溶出規格：45分間の溶出率は80%以上である。

試験結果：モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「明治」の溶出率は 88.5%～97.0%、モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」の溶出率は 85.1%～93.9%であり、いずれの製剤も溶出規格に適合していることが確認された。

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

(日本薬局方 モサプリドクエン酸塩錠の確認試験による)

- (1) ドラージェンドルフ試液による沈殿反応 (アミンの呈色反応)
- (2) 紫外可視吸光度測定法 (極大吸収波長：271～275nm 及び 306～310nm)

10. 製剤中の有効成分の定量法

(日本薬局方 モサプリドクエン酸塩錠の定量法による)

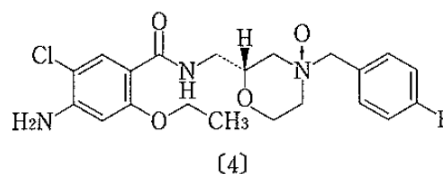
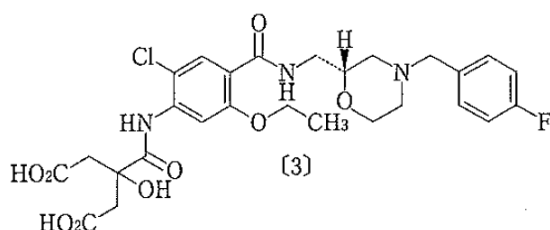
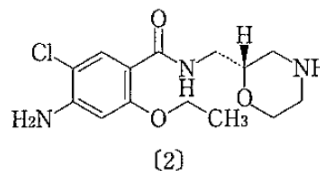
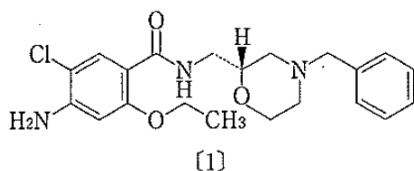
紫外可視吸光度測定法

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

日本薬局方では、原薬において、混在する類縁物質には〔1〕～〔4〕が規定されている。製剤における〔3〕及び〔4〕の許容限度は0.5%以下、〔3〕及び〔4〕以外の類縁物質の許容限度は0.2%以下、類縁物質総量の許容限度は1.0%以下に規定されている¹⁾。



13. 治療上注意が必要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・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。

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・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（2009年4月以降承認品目）

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

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、イトプリド塩酸塩など

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

薬理作用：上部消化管ならびに下部消化管の運動を促進し、消化管内容物の輸送を促進することによって種々の消化器症状（胸やけ、悪心・嘔吐）を改善する。

作用機序：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

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¹³⁾

薬剤名	投与量	n	t _{max} (hr)
モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」	5 mg	23	0.8±0.6

(Mean±S.D.)

(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「明治」¹⁰⁾

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。

(「IV.7. 溶出性」の項を参照のこと。)

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」¹³⁾

(後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日付 医薬審第487号、一部改正 平成18年11月24日付 薬食審査発1124004号)

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「明治」と標準製剤(錠剤、5mg)それぞれ1錠を、2剤2期のクロスオーバー法により健康成人男子に絶食下、単回経口投与した。第I期と第II期の休薬期間は5日間以上とした。投与前、投与0.25、0.5、1、1.5、2、3、4、6及び8時間後の計10時点に採血を行い、LC-MS/MS法にて血漿中モサプリド濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC_t、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った。その結果、AUC_t、C_{max}ともに試験製剤と標準製剤の対数値の平均値の差の90%信頼区間はlog(0.80)~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。

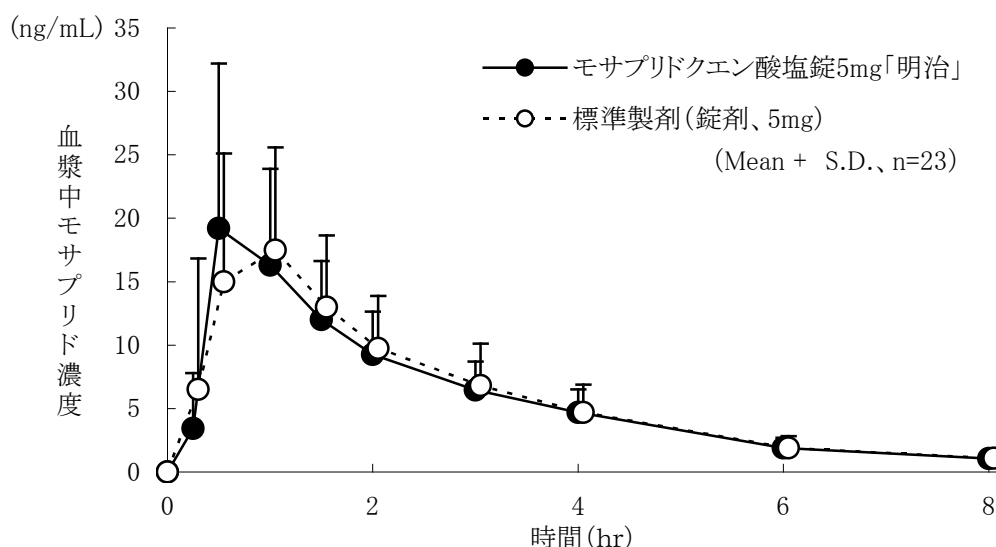


図 5mg 錠を投与時の血漿中モサプリド濃度推移

表 5mg錠を投与時の薬物動態パラメータ

薬 剤	被験者数	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC _t (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (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、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. 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) コンパートメントモデル

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

kel: 0.377 ± 0.055 (hr⁻¹) (健康成人男子に 5mg 錠単回経口投与時)¹³⁾

(5) クリアランス

該当資料なし

全身クリアランス: 80 L/hr との報告がある¹⁾。

(6) 分布容積

該当資料なし

3.5 L/kg との報告がある¹⁾。

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

以下の報告がある³⁾。

99% (*in vitro*、ヒト血清、1μg/mL、限外ろ過法または平衡透析法)

3. 吸収

該当資料なし

<参考>以下の報告がある³⁾。

吸収部位：主として小腸上部（ラット）

経路：不明

吸収率：95%（ラット、尿中排泄率の比より算出）。未変化体のバイオアベイラビリティは雄ラット、雌ラット、マウス、イヌ及びサルでそれぞれ7、47、35、8、15%であった。

腸肝循環：不明

4. 分布

(1) 血液—脳関門通過性

該当資料なし

以下の報告がある。

<参考>ラットに10mg/kg(¹⁴C)を単回経口投与後1時間における脳中放射能濃度は、血漿中濃度の約1/2と低かった³⁾。

(2) 血液—胎盤関門通過性

該当資料なし

以下の報告がある。

<参考>妊娠19日目のラットに10mg/kg(¹⁴C)を単回経口投与1時間後の胎仔中濃度は母体血漿中濃度より1.5倍高かったが、24時間後では1時間値の1/10以下に減少した。全身オートラジオグラフィの所見によると、投与後24時間の胎仔中放射能は消化管内容物にのみ認められ、胎仔組織からは消失していた³⁾。

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

以下の報告がある。

<参考>10mg/kg(¹⁴C)を経口投与した授乳ラット（分娩14日目）の乳汁中放射能濃度は、投与後1時間で最大値7.3μg eq./mL（血漿中濃度の5倍）に達し、以後、血漿中濃度とほぼ対応して低下した³⁾。

(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

以下の報告がある¹⁾。

主として肝臓で4-フルオロベンジル基の脱離、これにつづくモルホリン環5位の酸化及びベンゼン環3位の水酸化によって代謝される。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

代謝酵素は主として CYP3A4 である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

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

尿中、糞便中、との報告がある³⁾。

(2) 排泄率

該当資料なし

以下の報告がある³⁾。

健康成人に空腹時 5mg1 回 (承認範囲外用量を含む) 投与後 48 時間までの尿中排泄率は、未変化体として投与量の 0.1%、主代謝物 (4-フルオロベンジル基脱離体) として 7.0%であった。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 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. 治療に関する項目」を参照すること。

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」を参照すること。

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には、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

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

<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) 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

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

9. 高齢者への投与

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

妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦また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、授乳を中止すること。[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

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。]

15. その他の注意

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）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

該当資料なし

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

製剤及び有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年 外箱等に最終年月表示（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

貯法：室温保存（「取扱い上の注意」の項参照）

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

開封後は湿気を避けて保存すること。

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ. 14. 適用上の注意」の項を参照のこと。

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 「明治」

PTP包装 100錠（10錠×10シート）

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「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（ボトル入り） 1000錠

7. 容器の材質

PTP包装

PTPシート：ポリ塩化ビニル（PVC）、アルミニウム

ピロー：ポリエチレン（PE）、アルミニウム

バンド：ポリプロピレン（PP）

箱：紙

バラ包装

ボトル：ポリエチレン（PE）

キャップ：ポリプロピレン（PP）

パッキン：ポリエチレン（PE）

詰め物：ポリエチレン（PE）

ラベル：ポリプロピレン（PP）

箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ガスモチン[®]錠 2.5mg・5mg、ガスモチン[®]散 1% (大日本住友製薬)

同効薬：メトクロプラミド、ドンペリドン、トリメブチンマレイン酸塩、ナパシジル酸アクラトニウム、イトプリド塩酸塩

9. 国際誕生年月日

1998年6月

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」	2012年8月15日	22400AMX01149000
モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」	2012年8月15日	22400AMX01150000

11. 薬価基準収載年月日

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

効能・効果及び用法・用量の追加 (2020年9月30日承認)

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

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

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
モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「明治」	121803901	2399010 F 1273	622180301
モサプリドクエン酸塩錠5mg「明治」	121804601	2399010 F 2270	622180401

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品である。

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方 解説書 (廣川書店)
- 2) オレンジブック総合版 クエン酸モサプリド
- 3) 日本薬局方医薬品情報 (JPDI) 2016 (公財) 日本薬剤師研修センター編 (じほう)
- 4) 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)
- 5) モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「明治」の過酷試験に関する資料 (社内資料)
- 6) モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg・5mg 「明治」の通常的环境下における開封時安定性に関する資料 (社内資料)
- 7) モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」の安定性に関する資料 (社内資料)
- 8) モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」の過酷試験に関する資料 (社内資料)
- 9) モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」の分割後の安定性試験に関する資料 (社内資料)
- 10) 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)
- 11) モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」の溶出試験に関する資料 (社内資料)
- 12) 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)
- 13) モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「明治」の生物学的同等性試験に関する資料 (社内資料)

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

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備 考

その他の関連資料

承認申請に際し、準拠または参考とした通知名

- ・医薬品の承認申請について 薬食発第0331015号(平成17年3月31日)
- ・後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について 薬食審査発第 1124004 号
(平成 18 年 11 月 24 日)

MEMO

MEMO

MEMO

製造販売元

Meiji Seika ファルマ株式会社

東京都中央区京橋 2 - 4 - 16

IFM0015003