

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 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「NP」
モサプリドクエン酸塩錠5mg「NP」
 MOSAPRIDE CITRATE TABLETS

剤形	錠剤(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「NP」 1錠中 日本薬局方 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) モサプリドクエン酸塩錠 5mg「NP」 1錠中 日本薬局方 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)
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 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:ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL:0120-226-898 FAX:06-6375-0177 医療関係者向けホームページ https://www.nipro.co.jp/

本 I F 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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<https://www.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、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】

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。

IF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。

表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「I F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。

[I Fの作成]

I F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。

I Fに記載する項目及び配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠する。

添付文書の内容を補完するとのI Fの主旨に沿って必要な情報が記載される。

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。

「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」（以下，「I F記載要領2013」と略す）により作成されたI F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。

[I Fの発行]

「I F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。

上記以外の医薬品については，「I F記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。

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I Fが改訂される。

3．I Fの利用にあたって

「I F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I F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，I Fの原点を踏まえ，医療現場に不足している情報やI F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，I F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，I F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，I F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

I F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。I F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，I F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

．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

．名称に関する項目

- 1．販売名 …………… 2
- 2．一般名 …………… 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 …………… 2
- 7．CAS 登録番号 …………… 2

．有効成分に関する項目

- 1．物理化学的性質 …………… 3
- 2．有効成分の各種条件下における安定性 …… 3
- 3．有効成分の確認試験法 …………… 3
- 4．有効成分の定量法 …………… 3

．製剤に関する項目

- 1．剤形 …………… 4
- 2．製剤の組成 …………… 4
- 3．懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 …… 5
- 4．製剤の各種条件下における安定性 …… 5
- 5．調製法及び溶解後の安定性 …………… 6
- 6．他剤との配合変化（物理化学的变化） …… 6
- 7．溶出性 …………… 6
- 8．生物学的試験法 …………… 11
- 9．製剤中の有効成分の確認試験法 …… 11
- 10．製剤中の有効成分の定量法 …………… 12
- 11．力価 …………… 12
- 12．混入する可能性のある夾雑物 …………… 12
- 13．注意が必要な容器・外観が特殊な容器に
関する情報 …………… 12
- 14．その他 …………… 12

．治療に関する項目

- 1．効能又は効果 …………… 13
- 2．用法及び用量 …………… 13
- 3．臨床成績 …………… 13

．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 …… 15
- 2．薬理作用 …………… 15

．薬物動態に関する項目

- 1．血中濃度の推移・測定法 …………… 16
- 2．薬物速度論的パラメータ …………… 17
- 3．吸収 …………… 18
- 4．分布 …………… 18
- 5．代謝 …………… 18
- 6．排泄 …………… 19
- 7．トランスポーターに関する情報 …… 19
- 8．透析等による除去率 …………… 19

．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 …………… 20
- 2．禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） …… 20
- 3．効能又は効果に関連する使用上の注意と
その理由 …………… 20
- 4．用法及び用量に関連する使用上の注意と
その理由 …………… 20
- 5．慎重投与内容とその理由 …………… 20
- 6．重要な基本的注意とその理由及び
処置方法 …………… 20
- 7．相互作用 …………… 20
- 8．副作用 …………… 21
- 9．高齢者への投与 …………… 22
- 10．妊婦，産婦，授乳婦等への投与 …… 22
- 11．小児等への投与 …………… 22
- 12．臨床検査結果に及ぼす影響 …… 22
- 13．過量投与 …………… 22
- 14．適用上の注意 …………… 22
- 15．その他の注意 …………… 23
- 16．その他 …………… 23

．非臨床試験に関する項目

- 1．薬理試験 …………… 24
- 2．毒性試験 …………… 24

・管理的事項に関する項目		14. 再審査期間	26
1. 規制区分	25	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	26
2. 有効期間又は使用期限	25	16. 各種コード	27
3. 貯法・保存条件	25	17. 保険給付上の注意	27
4. 薬剤取扱い上の注意点	25		
5. 承認条件等	25	・文献	
6. 包装	25	1. 引用文献	28
7. 容器の材質	25	2. その他の参考文献	28
8. 同一成分・同効薬	26		
9. 国際誕生年月日	26	・参考資料	
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	26	1. 主な外国での発売状況	29
11. 薬価基準収載年月日	26	2. 海外における臨床支援情報	29
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	26		
13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及び その内容	26	・備考	
		その他の関連資料	30

1. 開発の経緯

モサプリドクエン酸塩水和物は消化管運動機能改善剤であり、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おり¹⁾、本邦では 1998 年に上市されている。

1錠中にモサプリドクエン酸塩を 2.5mg 及び 5mg 含有するモサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「NP」及びモサプリドクエン酸塩錠 5mg「NP」は、ニプロファーマ(株)が初の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、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2012 年 8 月に承認を取得、2012 年 12 月に販売を開始した。2013 年 12 月には、製造販売承認をニプロ(株)が承継した。

2020 年 9 月には、「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」に対する「効能・効果」、「用法・用量」が追加承認された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤は選択的セロトニン 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⁾

ベンズアミノ構造をもつが、ドパミン D₂ 遮断作用がないため、鎮静、錐体外路症状、プロラクチン過剰分泌などの副作用が少ないのが特徴である。²⁾

臨床的には、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に有用性が認められている。

錠剤本体に識別コード・含有量を刻印し、2.5mg と 5mg の形状を変えて、識別性の向上をはかった。

PTP シートに「胸やけ・悪心・嘔吐の薬」を記載した。

重大な副作用としては、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸があらわれることがある(頻度不明)。

．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 「NP」
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「NP」

(2) 洋 名：MOSAPRIDE CITRATE TABLETS

(3) 名称の由来：有効成分であるモサプリドクエン酸塩に剤形及び含量を記載し、NIPRO から「NP」を付した。

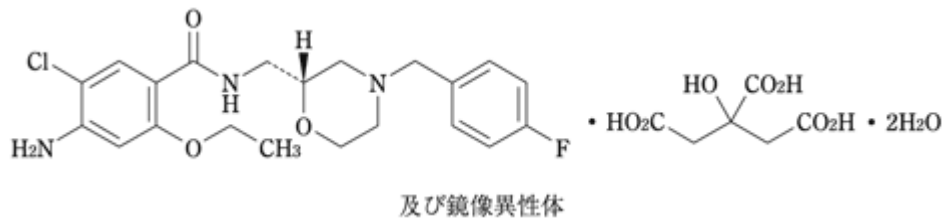
2．一般名

(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)

(3) ステム : スルピリド誘導体：-pride

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式：C₂₁H₂₅ClFN₃O₃ · C₆H₈O₇ · 2H₂O

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

．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。

(3) 吸湿性³⁾

25℃、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。

(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³⁾

pKa = 6.20 (中和滴定法)

(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。

水分 : 5.0～6.5% (0.5g、容量滴定法、逆滴定)。¹⁾

強熱残分 : 0.1%以下(1g、白金るつぼ)。¹⁾

2．有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3．有効成分の確認試験法¹⁾

日本薬局方の医薬品各条の「モサプリドクエン酸塩水和物」確認試験法による。

4．有効成分の定量法¹⁾

日本薬局方の医薬品各条の「モサプリドクエン酸塩水和物」定量法による。


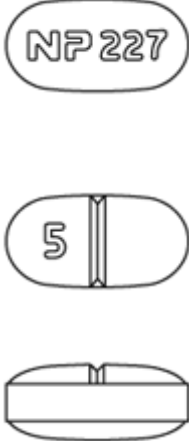
・製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別, 外観及び性状

1) 区別: 錠剤 (フィルムコーティング錠)

2) 外観及び性状: 下記表に記載

販売名		モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「NP」	モサプリドクエン酸塩錠 5mg「NP」
外形			
形状		白色のフィルムコーティング錠	白色の割線入りフィルムコーティング錠
大きさ	直径 (mm)	6.2	(長径) 9.2 (短径) 4.6
	厚さ (mm)	3.3	3.8
	重量 (mg)	82	140
識別コード		NP-225	NP-227

(2) 製剤の物性: 該当資料なし

(3) 識別コード: 上記表に記載

(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「NP」

1錠中 日本薬局方 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)

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「NP」

1錠中 日本薬局方 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)

(2) 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、軽質無水ケイ酸、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、コポリビドン、カルナウバロウ

(3) その他

該当しない

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

加速試験

試験条件 : 40 ± 1 、 $75 \pm 5\%RH$

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「 NP 」⁴⁾

PTP 包装

包装形態 (ポリ塩化ビニル・アルミ箔 (アルミ製袋))

項目及び規格	試験開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状(白色のフィルムコーティング錠)	適 合	適 合	適 合	適 合
確認試験	適 合	適 合	適 合	適 合
製剤均一性試験	適 合	-	-	適 合
純度試験	適 合	適 合	適 合	適 合
溶出試験	適 合	適 合	適 合	適 合
含量 (95.0 ~ 105.0%)	99.7 ~ 100.6	100.0 ~ 101.6	99.0 ~ 100.0	98.5 ~ 100.0

(n=3)

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「 NP 」⁵⁾

PTP 包装

包装形態 (ポリ塩化ビニル・アルミ箔 (アルミ製袋))

項目及び規格	試験開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状 (白色の割線入りフィルムコーティング錠)	適 合	適 合	適 合	適 合
確認試験	適 合	適 合	適 合	適 合
製剤均一性試験	適 合	-	-	適 合
純度試験	適 合	適 合	適 合	適 合
溶出試験	適 合	適 合	適 合	適 合
含量 (95.0 ~ 105.0%)	99.0 ~ 99.6	99.6 ~ 99.9	99.6 ~ 100.5	98.6 ~ 99.0

(n=3)

バラ包装

包装形態（ポリエチレン製白色瓶）

項目及び規格	試験開始時	1カ月後	3カ月後	6カ月後
性状（白色の割線入りフィルムコーティング錠）	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	-	-	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合
含量（95.0～105.0%）	98.7～ 99.8	99.6～ 100.3	98.5～ 98.9	99.0～ 99.3

（n=3）

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6カ月）の結果、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。

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

溶出挙動における同等性

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「NP」⁶⁾

（「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日一部改正 薬食審査発第1124004号、平成19年5月30日一部改正 審査管理課事務連絡」）

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

試験液の温度：37±0.5

試験液の量：900mL

試験液：pH1.2 = 日本薬局方溶出試験第1液

pH3.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 = 日本薬局方溶出試験第2液

水

試験液の種類：回転数 50rpm の場合 pH1.2、3.0、6.8 及び水

回転数 100rpm の場合 pH6.8

判定基準 : 溶出試験条件それぞれについて、以下に示す(1)、(2)の基準を満たすとき、溶出挙動が同等と判定する。

(1)平均溶出率

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 $\pm 10\%$ の範囲にある。

標準製剤が 15 ~ 30 分に平均 85% 以上溶出する場合 :

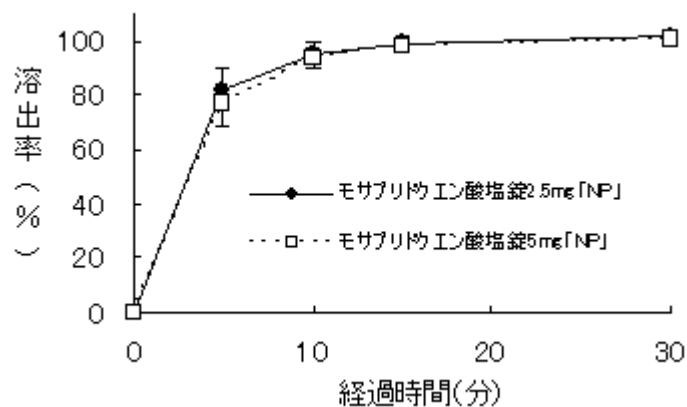
標準製剤の平均溶出率が約 60% 及び 85% となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 50 以上である。

(2)個々の溶出率

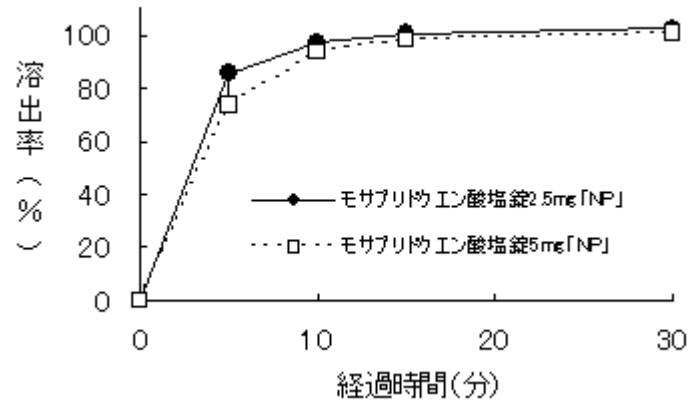
最終比較時点における標準製剤の平均溶出率が 85% 以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがない。

試験結果 : 同等性試験ガイドラインに従ってモサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「NP」と標準製剤の溶出挙動を比較した。その結果、全ての条件において溶出挙動の同等性の判定基準を満たしていたため、両製剤は生物学的に同等であると判断した。

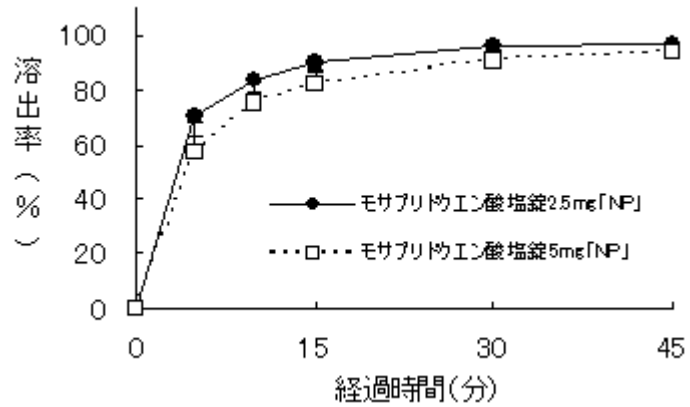
試験液 pH1.2 における平均溶出曲線 (mean \pm S.D.、n=12)



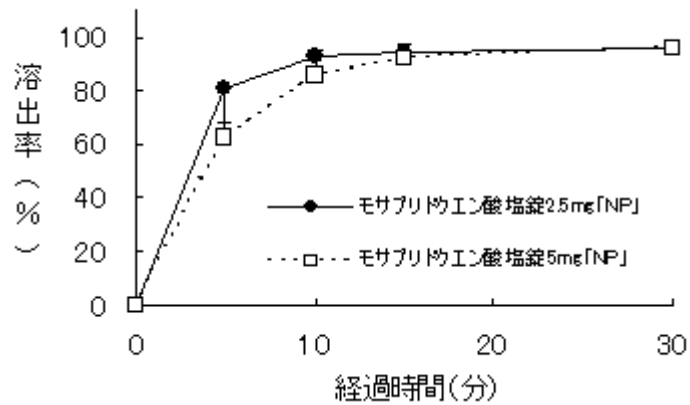
試験液 pH3.0 における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



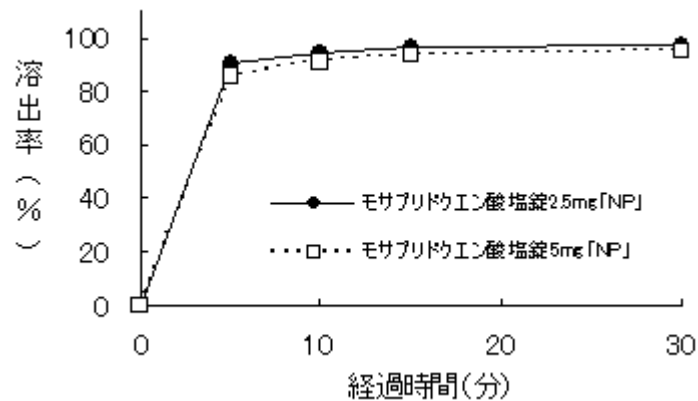
試験液 pH6.8 における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



試験液水における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



試験液 pH6.8 (100rpm) における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



溶出挙動における類似性

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「NP」⁷⁾

(「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 医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号及び平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第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

試験液の温度 : 37 ± 0.5

試験液の量 : 900mL

試験液 : pH1.2 = 日本薬局方溶出試験第1液
pH3.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液
pH6.8 = 日本薬局方溶出試験第2液
水

試験液の種類 : 回転数 50rpm の場合 pH1.2、3.0、6.8 及び水
回転数 100rpm の場合 pH6.8

判定基準 : すべての溶出試験条件において、以下のいずれかの基準に適合するとき、溶出挙動が類似しているとする。

(1) 標準製剤が 15 分以内に平均 85% 以上溶出する場合 :

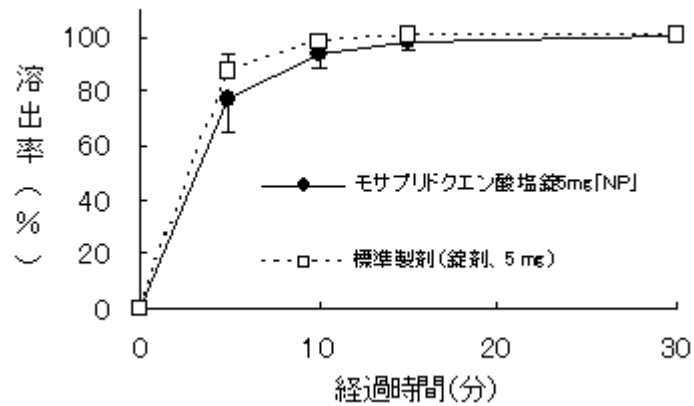
試験製剤が 15 分以内に平均 85% 以上溶出する。

(2) 標準製剤が 15 ~ 30 分に平均 85% 以上溶出する場合 :

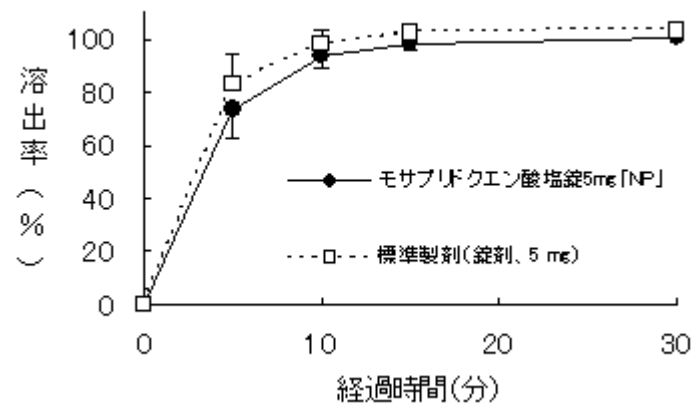
標準製剤の平均溶出率が 60% 及び 85% 付近となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 ± 15% の範囲にある。

試験結果 : 同等性試験ガイドラインに従ってモサプリドクエン酸塩錠 5mg 「NP」と標準製剤の溶出挙動を比較した。その結果、全ての条件において溶出挙動の類似性の判定基準を満たしていたため、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

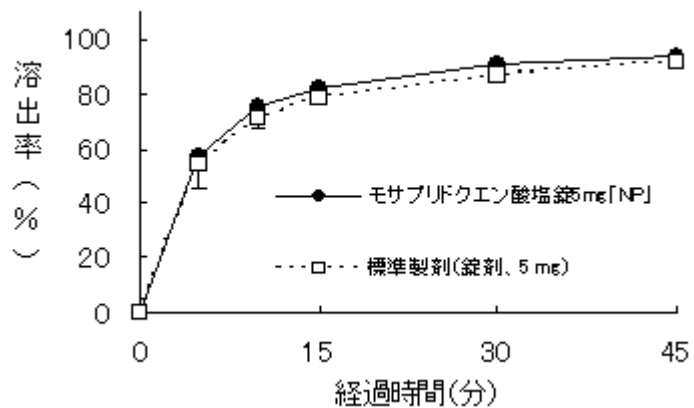
試験液 pH1.2 における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



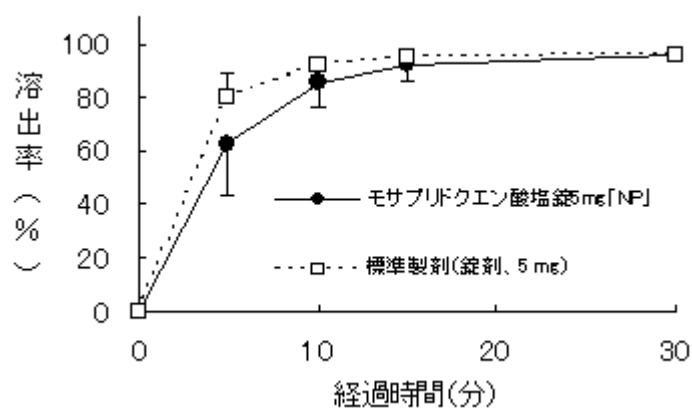
試験液 pH3.0 における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



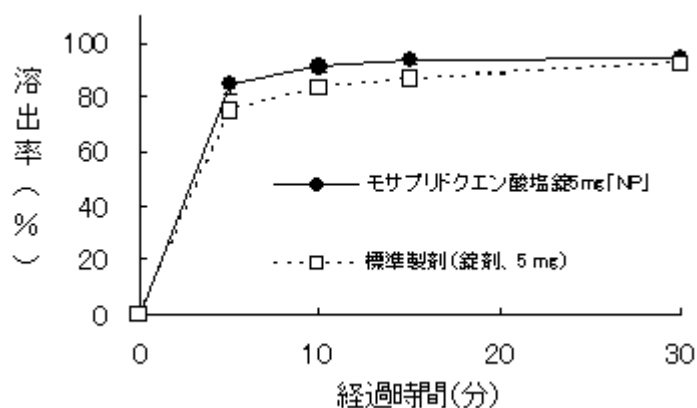
試験液 pH6.8 における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



試験液水における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



試験液 pH6.8 (100rpm) における平均溶出曲線 (mean ± S.D., n=12)



公的溶出規格への適合

- 方法 : 日本薬局方 溶出試験法 (パドル法)
 試験液 : pH6.8 = 日本薬局方溶出試験第2液 900mL
 回転数 : 50rpm
 試験結果 : 45分以内に80%以上溶出した。

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

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⁸⁾

日本薬局方の医薬品各条の「モサプリドクエン酸塩錠」確認試験法による。

10. 製剤中の有効成分の定量法⁸⁾

日本薬局方の医薬品各条の「モサプリドクエン酸塩錠」定量法による。

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

該当しない

．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 回に分けて食前又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

該当資料なし

（ 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

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

該当資料なし

・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

消化管運動賦活剤（イトプリド塩酸塩、ドンペリドン、メトクロプラミド 他）

2. 薬理作用

（1）作用部位・作用機序¹⁾

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。

（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

．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⁷⁾

健康成人男子に、モサプリドクエン酸塩錠5mg「NP」を1錠（モサプリドクエン酸塩として5mg、n=16）絶食時に経口投与した時のT_{max}は約1.0時間であった。

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験ガイドライン

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「NP」⁶⁾

(「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)」)

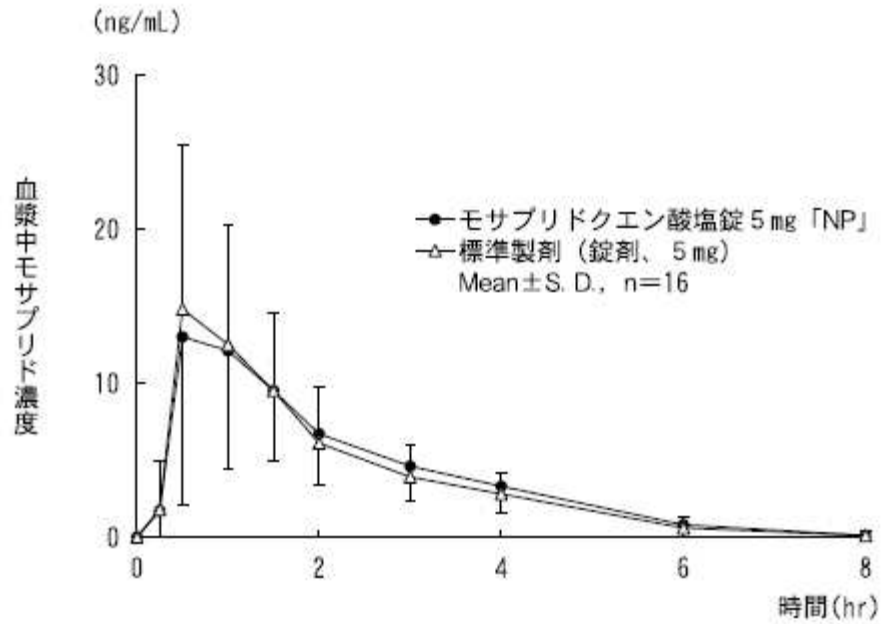
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「NP」はモサプリドクエン酸塩錠 5mg「NP」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

「．製剤に関する項目」の「7.溶出性」の項を参照。

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「NP」⁷⁾

(「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日医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号及び平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号」、「医薬品の臨床試験の実施の基準に関する省令:平成9年3月27日厚生省令第28号、平成13年3月26日一部改正 厚生労働省令第36号、平成15年6月12日一部改正 厚生労働省令第106号、平成16年12月21日一部改正 厚生労働省令第172号、平成18年3月31日一部改正 厚生労働省令第72号及び平成20年2月29日一部改正 厚生労働省令第24号」)

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「NP」と標準製剤のそれぞれ1錠（モサプリドクエン酸塩として5mg）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単回経口投与して LC/MS/MS 法にて血漿中モサプリド濃度を測定した。得られたそれぞれの薬物動態パラメータ(AUC_{0-8hr}、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、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。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-8hr} (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 「NP」	32.3 ± 12.7	17.9 ± 7.3	1.0 ± 0.9	1.6 ± 0.3
標準製剤 (錠剤、5mg)	30.9 ± 14.8	18.7 ± 8.0	0.7 ± 0.4	1.6 ± 0.4

(Mean ± S.D., n=16)

生物学的同等性試験によって得られた血漿中濃度並びに 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

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

該当資料なし

(4) 消失速度定数

健康成人単回経口投与

投与量	5mg (n=16)
kel (/hr)	0.4569 ± 0.0878

(Mean ± S.D.)

(5) クリアランス¹⁾

全身クリアランス : 80L/hr

(6) 分布容積¹⁾

3.5L/kg

(7) 血漿蛋白結合率¹⁾

血清タンパク結合率 : 99%

3 . 吸収

該当資料なし

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

該当資料なし

参考

動物試験(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¹⁾

主として CYP3A4

(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³⁾

尿中、糞便中

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

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

．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

「．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

「．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、服用間隔をあげ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、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

(1)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
(2)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

「8.副作用」の項を参照。

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。[動物試験（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

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 (肝細胞腺腫及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

該当しない

．非臨床試験に関する項目

1．薬理試験

- (1) 薬効薬理試験 (「 ．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
参考
「 ．安全性 (使用上の注意等) に関する項目」 の「 15. その他の注意」 の
項を参照。
- (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

. 管理的事項に関する項目

1 . 規制区分

製 剤：モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「NP」 該当しない
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「NP」 該当しない
有効成分：日本薬局方 モサプリドクエン酸塩水和物 該当しない

2 . 有効期間又は使用期限

使用期限：製造後 3 年（安定性試験結果に基づく）
（「 . 製剤に関する項目」の「4. 製剤の各種条件下における安定性」の項を参照。）

3 . 貯法・保存条件

室温保存

4 . 薬剤取扱い上の注意点

- （ 1 ）薬局での取り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）
「 . 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」及び「14. 適用上の注意」の項を参照。
- （ 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 「NP」 : 100 錠（PTP）
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「NP」 : 100 錠（PTP）
500 錠（PTP、バラ）
1050 錠（PTP）

7 . 容器の材質

PTP 包装：ポリ塩化ビニル、アルミ箔
瓶包装 : ポリエチレン製白色瓶

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ガスマチン錠 2.5mg、同 5mg（大日本住友製薬） 他
同効薬：イトプリド塩酸塩、ドンペリドン、メトクロプラミド 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

製造販売承認年月日：2012年8月15日

承認番号：モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「NP」：22400AMX01096000

モサプリドクエン酸塩錠5mg「NP」：22400AMX01097000

[注]2013年12月2日に製造販売承認を承継。

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」、「用法・用量」の追加

一部変更承認年月日：2020年9月30日

効能・効果 「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」
の追加

用法・用量 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
対する「用法・用量」の追加

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。

参考

「 . 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項を参照。

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「NP」	122164001	2399010F1109	622216401
モサプリドクエン酸 塩錠 5mg「NP」	122165701	2399010F2105	622216501

17. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当する。

. 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) C-5558(2016)
- 2)田中千賀子 他編集：NEW 薬理学、改訂第5版：p.425、南江堂
- 3)日本薬剤師研修センター編：日本薬局方 医薬品情報 2016(じほう) 773(2016)
- 4)ニプロ(株)社内資料：安定性(加速)試験
- 5)ニプロ(株)社内資料：安定性(加速)試験
- 6)ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性(溶出)試験
- 7)ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性(溶出、血漿中濃度測定)試験
- 8)第十七改正 日本薬局方 解説書(廣川書店) C-5562(2016)

2 . その他の参考文献

該当資料なし

． 参考資料

1． 主な外国での発売状況

該当しない

2． 海外における臨床支援情報

該当資料なし

・備考

その他の関連資料

該当資料なし

ニフ。ロ株式会社
大阪市北区本庄西3丁目9番3号