

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薬

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「ZE」 モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」

MOSAPRIDE CITRATE TABLETS 2.5mg「ZE」・TABLETS 5mg「ZE」

剤形	フィルムコーティング錠		
製剤の規制区分	—		
規格・含量	モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」： 1錠中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 モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」： 1錠中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		
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		錠 2.5mg	錠 5mg
	製造販売承認年月日	2012年8月15日	2012年8月15日
	薬価基準収載年月日	2012年12月14日	2012年12月14日
	発売年月日	2012年12月14日	2012年12月14日
開発・製造(輸入)・提携・販売会社名	発売元：全星薬品株式会社 製造販売元：全星薬品工業株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	全星薬品工業株式会社 医薬情報部  0120-189-228 TEL 06-6630-8820 FAX 06-6630-8990 医療関係者向けホームページ https://www.zenseiyakuhin.co.jp		

本IFは2020年9月改訂（第3版）の添付文書の記載に基づき作成した。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/>にてご確認下さい。

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 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。
- ② 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。
- 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】

- ① IF 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。
- ② IF 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、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
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・・・・・・・・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
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・・・・・・・・4
4. 有効成分の定量法・・・・・・・・4

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形・・・・・・・・・・・・・・・・・・5
2. 製剤の組成・・・・・・・・・・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・・・・・・・・・・6
5. 調製法及び溶解後の安定性・・・・・・・・7
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）・・・・・・・・・・7
7. 溶出性・・・・・・・・・・・・・・・・8
8. 生物学的試験法・・・・・・・・・・12
9. 製剤中の有効成分の確認試験法・・・・・・・・12
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. 治療上注意が必要な容器に関する情報・・・・・・・・・・13
14. その他・・・・・・・・・・・・・・・・13

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果・・・・・・・・・・14
2. 用法及び用量・・・・・・・・・・14
3. 臨床成績・・・・・・・・・・14

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群・・・・・・・・・・16
2. 薬理作用・・・・・・・・・・16

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法・・・・・・・・17
2. 薬物速度論的パラメータ・・・・・・・・18
3. 吸収・・・・・・・・・・19
4. 分布・・・・・・・・・・19
5. 代謝・・・・・・・・・・20
6. 排泄・・・・・・・・・・20
7. 透析等による除去率・・・・・・・・20

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

IX. 非臨床試験に関する項目	
1. 薬理試験	24
2. 毒性試験	24
X. 管理的事項に関する項目	
1. 規制区分	25
2. 有効期間又は使用期限	25
3. 貯法・保存条件	25
4. 薬剤取扱い上の注意点	25
5. 承認条件等	25
6. 包装	25
7. 容器の材質	25
8. 同一成分・同効薬	26
9. 国際誕生年月日	26
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	26
11. 薬価基準収載年月日	26
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
14. 再審査期間	26
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	26
16. 各種コード	27
17. 保険給付上の注意	27
X I. 文 献	
1. 引用文献	28
2. その他の参考文献	28
X II. 参考資料	
1. 主な外国での発売状況	29
2. 海外における臨床支援情報	29
X III. 備考	
その他の関連資料	30

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、選択的セロトニン 5-HT₄ 受容体作動薬であり、慢性胃炎に伴う消化器症状(胸やけ、悪心・嘔吐)の治療に供されている。本邦においては、1998年10月に上市されている。

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」・同錠 5mg「ZE」は全星薬品工業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、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 月に上市した。

2020 年 9 月「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」に係る「効能・効果」及び「用法・用量」の一部変更が承認され、適応を取得した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1)モサプリドクエン酸塩水和物を有効成分とする選択的セロトニン 5-HT₄ 受容体作動薬である。
- (2)上部消化管だけでなく、下部消化管運動も促進¹⁾する消化管運動機能改善剤である。
- (3)規格により錠剤の形状(2.5mg錠：円形、5mg錠：楕円形)およびPTPシートサイズが異なるため、外観上、容易に識別可能である。
- (4)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。
なお、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。
〈参考〉『Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目「8. 副作用(2)」』

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 「ZE」

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「ZE」

(2) 洋名

MOSAPRIDE CITRATE TABLETS 2.5mg「ZE」

MOSAPRIDE CITRATE TABLETS 5mg「ZE」

(3) 名称の由来

医薬発第 935 号(平成 12 年 9 月 19 日)に従う「一般名+剤形+含量+屋号」販売名である

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

モサプリドクエン酸塩水和物 (JAN)

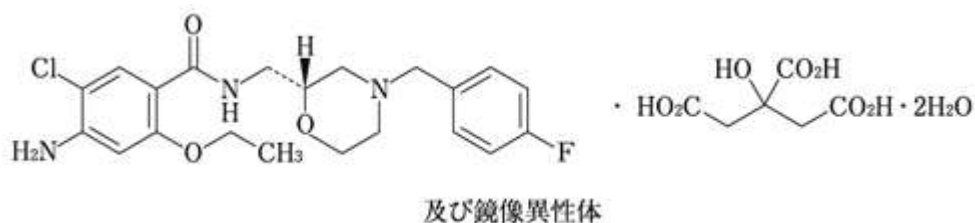
(2) 洋名(命名法)

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

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

II. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：クエン酸モサブリド

7. CAS登録番号

636582-62-2

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。

(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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(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

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

(1) 紫外可視吸光度測定法

(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

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

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	色調	形状
モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「ZE」	フィルムコーティング錠	白色	  
			直径:6.2mm 厚み:3.3mm 重量:82mg (ZE36、2.5)
モサプリドクエン酸塩錠5mg「ZE」	フィルムコーティング錠 (割線入り)	白色	  
			長径:9.2mm 短径:4.6mm 厚み:3.7mm 重量:140mg (ZE37、5)

(2) 製剤の物性

硬度：錠 2.5mg 平均値 40N 以上
 錠 5mg 平均値 60N 以上

(3) 識別コード

	品名		モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」	モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」
		本体		ZE36、2.5
包材 (PTP)	表	色調	無色透明／銀色	無色透明／金色
		耳	モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」	モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」
		シート	ZE36／2.5mg	ZE37／5mg
	裏	色調	白色	白色
		耳	MOSAPRIDE CITRATE TABLETS 2.5mg「ZE」	MOSAPRIDE CITRATE TABLETS 5mg「ZE」
		シート	モサプリドクエン酸塩錠「ZE」/ 2.5mg／プラマーク/ 取り出しケアマーク/ GS1コード	モサプリドクエン酸塩錠「ZE」/ 5mg／プラマーク/ 取り出しケアマーク/ GS1コード

(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

IV. 製剤に関する項目

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「ZE」:

1錠中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

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」:

1錠中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

(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

(1) 加速試験²⁾

試験条件:

PTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミ箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム)・バラ包装(ポリエチレン容器・密栓)の状態、40±1℃、75±5%RH

● 錠 2.5mg

<PTP包装>

項目及び規格	試験開始時	1箇月	3箇月	6箇月
性状 (白色のフィルムコーティング錠である)	白色のフィルムコーティング錠であった	白色のフィルムコーティング錠であった	白色のフィルムコーティング錠であった	白色のフィルムコーティング錠であった
確認試験	適	適	適	適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	—	—	適
溶出性 (45分、80%以上)	適	適	適	適
含量(%) (95.0~105.0%)	99.7~ 100.6	100.0~ 101.6	99.0~ 100.0	98.5~ 100.0

確認試験:沈殿反応、紫外可視吸光度測定法

純度試験:類縁物質

(n=3)

IV. 製剤に関する項目

● 錠 5mg

<PTP 包装>

項目及び規格	試験開始時	1 箇月	3 箇月	6 箇月
性状 (白色の割線入りフィルムコーティング錠である)	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった
確認試験	適	適	適	適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	—	—	適
溶出性 (45 分、80%以上)	適	適	適	適
含量 (%) (95.0~105.0%)	99.0~ 99.6	99.6~ 99.9	99.6~ 100.5	98.6~ 99.0

確認試験：沈殿反応、紫外可視吸光度測定法

純度試験：類縁物質

(n=3)

<バラ包装>

項目及び規格	試験開始時	1 箇月	3 箇月	6 箇月
性状 (白色の割線入りフィルムコーティング錠である)	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった
確認試験	適	適	適	適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	—	—	適
溶出性 (45 分、80%以上)	適	適	適	適
含量 (%) (95.0~105.0%)	98.7~ 99.8	99.6~ 100.3	98.5~ 98.9	99.0~ 99.3

確認試験：沈殿反応、紫外可視吸光度測定法

純度試験：類縁物質

(n=3)

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（物理化学的変化）

該当しない

IV. 製剤に関する項目

7. 溶出性

(1) 日本薬局方医薬品各条の規格に対する適合性

●溶出試験法

日本薬局方一般試験法・溶出試験 パドル法

試験条件：回転数：50rpm

試験液：溶出試験第2液(pH6.8)

試験液量：900 mL

測定法：液体クロマトグラフィー（波長：274nm）

結果：本剤は以下の規格に適合した。³⁾

	規定時間	溶出率
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」	45分	80%以上
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」	45分	80%以上

(2) 溶出挙動における類似性

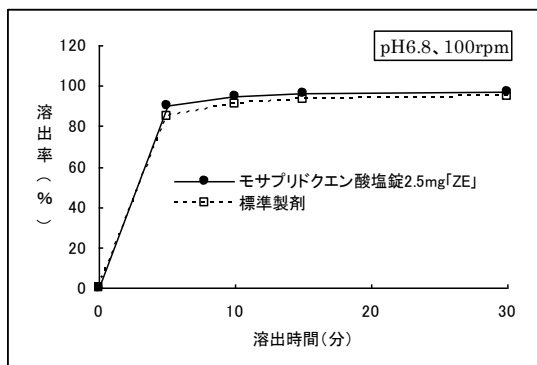
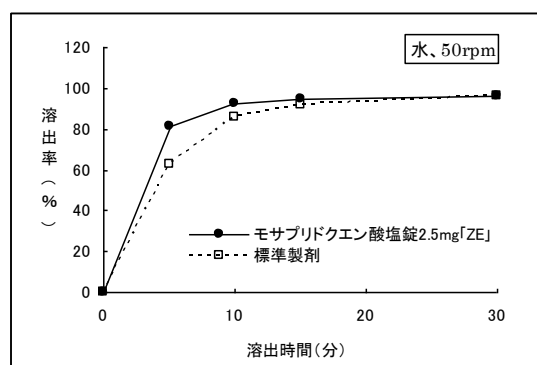
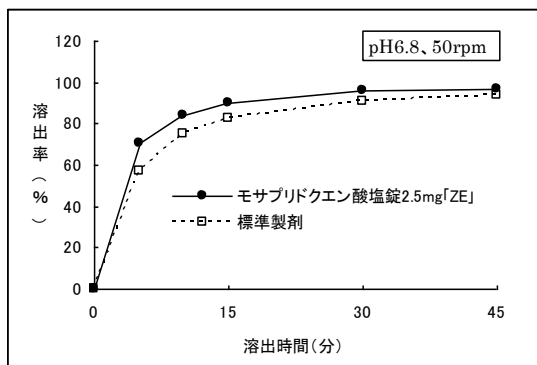
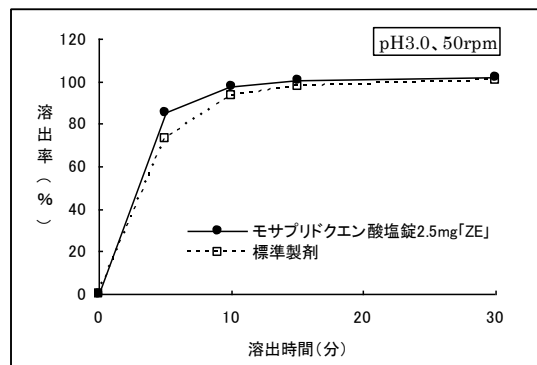
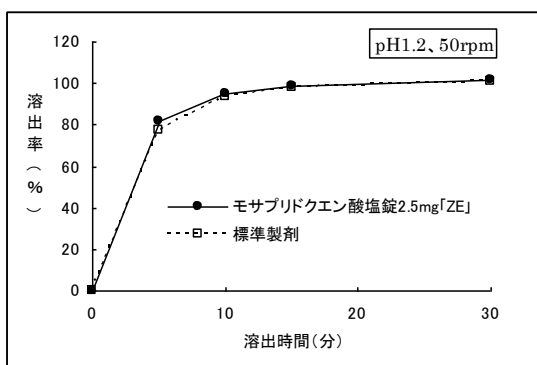
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」別添「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（薬食審査発第1124004号平成18年11月24日）に従い、標準製剤との溶出挙動の比較を行った。³⁾

●錠 2.5mg

検体	試験製剤	モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」	
	標準製剤	モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」	
処方変更水準		C水準	
試験方法	装置	日本薬局方一般試験法パドル法	
	試験液量	900mL	
	温度	37±0.5℃	
	回転数	50rpm(pH1.2、pH3.0、pH6.8、水)、100rpm(pH6.8)	
	試験液	pH1.2: 日本薬局方の溶出試験第1液	
		pH3.0: 0.05mol/Lリン酸水素二ナトリウムと0.025mol/Lクエン酸を用いてpH3.0に調整したもの	
		pH6.8: 日本薬局方の溶出試験第2液	
水			
界面活性剤添加	なし		
標準製剤の平均溶出率が85%を超えた時点で終了とする。			

IV. 製剤に関する項目

判定基準	<p>●pH1.2・pH3.0・水(50rpm)・pH6.8(100rpm)</p> <p>標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合で、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。</p>
	<p>●pH6.8(50rpm)</p> <p>標準製剤が 15~30 分に平均 85%以上溶出する場合で、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。</p>
	<p>(個々の溶出率)</p> <p>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。</p>



IV. 製剤に関する項目

表 溶出挙動における類似性 (試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				標準製剤 (モサプリドクエン酸 塩錠 5mg「ZE」)	モサプリドクエン酸 塩錠 2.5mg「ZE」	f2 関数	判定
試験方法	回転数	試験液	溶出時間	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)		
パドル法	50rpm	pH1.2	15 分	98.2	99.0	-	適合
		pH3.0	15 分	97.7	100.3	-	適合
		pH6.8	5 分	57.0	70.3	61.8	適合
			15 分	82.3	89.9		
		水	15 分	91.7	94.4	-	適合
	100rpm	pH6.8	15 分	93.3	96.4	-	適合

(n=12)

表 溶出挙動の同等性の判定結果 (個々の溶出率)

試験条件		平均溶出率が±15%の範囲を超えるもの	判定
50rpm	pH1.2	0 個	適合
	pH3.0	0 個	適合
	pH6.8	0 個	適合
	水	0 個	適合
100rpm	pH6.8	0 個	適合

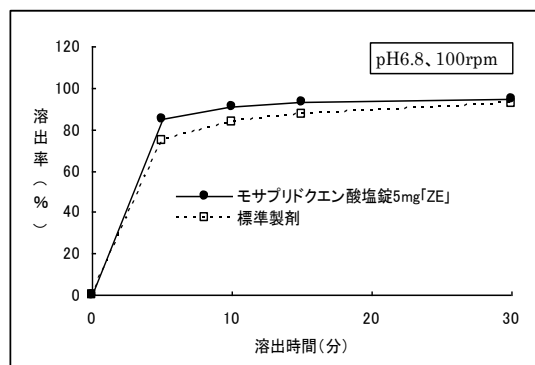
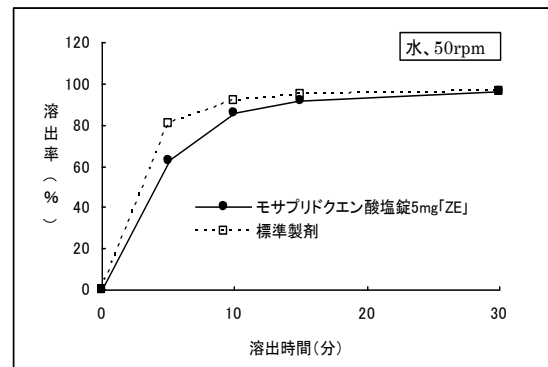
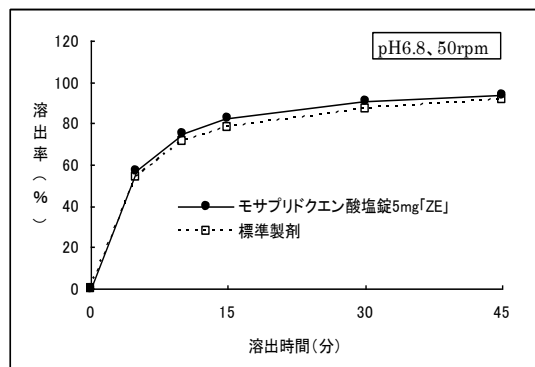
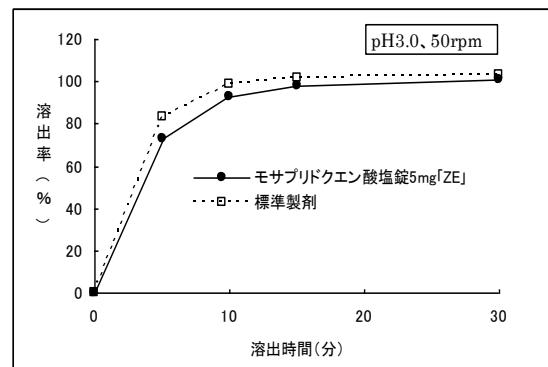
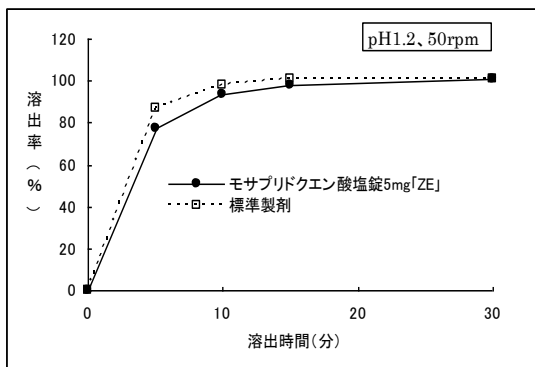
(n=12)

● 錠 5mg

試験方法	装置	日本薬局方一般試験法パドル法
	試験液量	900mL
	温度	37±0.5℃
	回転数	50rpm (pH1.2、pH3.0、pH6.8、水)、100rpm (pH6.8)
	試験液	pH1.2: 日本薬局方の溶出試験第 1 液
		pH3.0: 0.05mol/L リン酸水素二ナトリウムと 0.025mol/L クエン酸を用いて pH3.0 に調整したもの
		pH6.8: 日本薬局方の溶出試験第 2 液
	水	
界面活性剤添加	なし	
標準製剤の平均溶出率が 85%を超えた時点で終了とする。		

IV. 製剤に関する項目

判定基準	<p>●pH1.2・pH3.0・水(50rpm)・pH6.8(100rpm) 標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合で、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$\pm 15\%$の範囲にある。</p> <p>●pH6.8(50rpm) 標準製剤が 15~30 分に平均 85%以上溶出する場合で、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$\pm 15\%$の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。</p>
------	---



IV. 製剤に関する項目

表 溶出挙動における類似性 (試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				標準製剤 (錠剤、5mg)	モサプリドクエン 酸塩錠 5mg「ZE」	判定
試験方法	回転数	試験液	溶出時間	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
パドル法	50rpm	pH1.2	15分	100.6	98.2	適合
		pH3.0	15分	101.8	97.7	適合
		pH6.8	5分	53.9	57.0	適合
			30分	87.0	90.4	
		水	15分	94.7	91.7	適合
	100rpm	pH6.8	15分	86.9	93.3	適合

(n=12)

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

- (1) 沈殿反応(ドラーゲンドルフ反応)
- (2) 紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

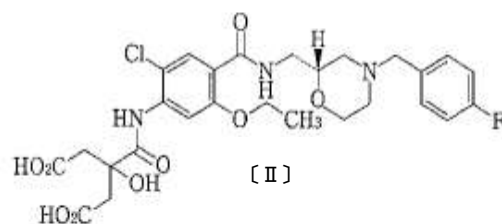
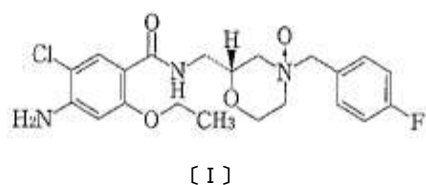
日局「モサプリドクエン酸塩錠」の定量法
紫外可視吸光度測定法

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

混在する類縁物質には分解生成物として〔I〕、〔II〕などがある。相対保持時間 0.60 及び 0.85 の類縁物質は〔II〕及び〔I〕であり、その許容限度は 0.5%以下である。〔I〕及び〔II〕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。⁴⁾



IV. 製剤に関する項目

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

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

該当資料なし

(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

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・特別使用成績調査（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. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

メトクロプラミド塩酸塩、ドンペリドン、トリメブチンマレイン酸塩、イトプリド塩酸塩など

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁴⁾

作用部位：消化管

作用機序：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。

(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

(「臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験⁵⁾

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)

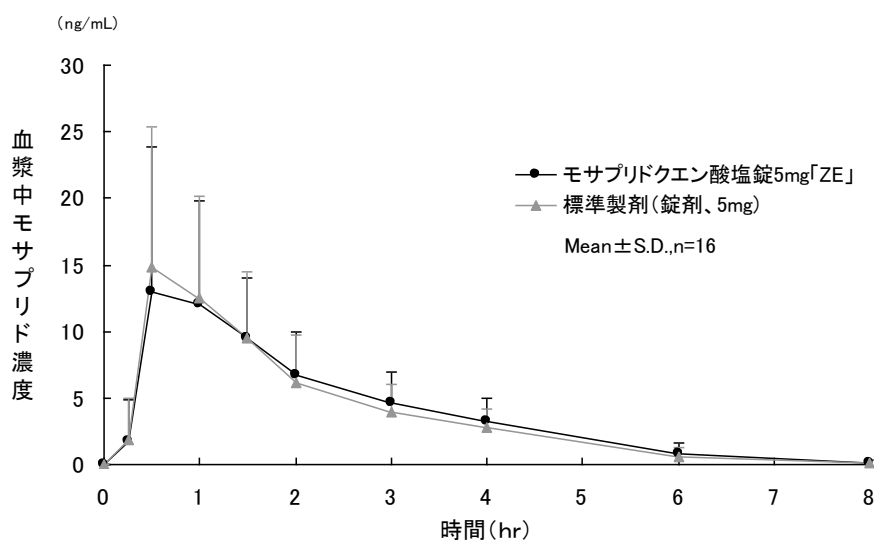
1) モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」は、モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」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。

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)

2) モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」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、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



VII. 薬物動態に関する項目

<薬物速度論的パラメータ>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _(0→8) (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」	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)

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。

(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

<参考>

『VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目「7. 相互作用」』の項を参照のこと。

(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

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

<参考>

80L/hr⁴⁾

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

(6) 分布容積

該当資料なし

<参考>

3.5L/kg⁴⁾

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

<参考>

99%(血清蛋白結合率)⁴⁾

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>

移行性あり

『Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目「10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与（2）」』

授乳婦：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。〕

(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

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

<参考>

主として肝で代謝⁴⁾

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

該当資料なし

<参考>

CYP3A4⁴⁾

(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

(2) 排泄率

該当資料なし

<参考>

投与後48時間までの尿中排泄率は、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%である。⁴⁾

(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

<参考>

蛋白結合率が高いため、除去されないと思われる。^{a)}

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（現段階では定められていない）

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

該当しない（現段階では定められていない）

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（現段階では定められていない）

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（現段階では定められていない）

(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。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

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)上昇、AST(GOT)上昇、Al-P上昇、 γ -GTP上昇、ビリルビン上昇
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

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(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：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

該当しない(現段階では定められていない)

13. 過量投与

該当しない(現段階では定められていない)

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、さら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

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

該当資料なし

(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：－
有効成分：－

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（外箱、ラベルに記載）

3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

気密容器、室温保存

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

- 1) 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、服用を中止し、医師等に連絡するよう指導すること。『Ⅷ.安全性(使用上の注意等)に関する項目「6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」の項参照』
- 2) 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、さら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。]

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

	PTP	バラ
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」	100錠（10錠×10）	－
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」	100錠（10錠×10） 1,000錠（10錠×100） 1,050錠（21錠×50）	1,000錠

7. 容器の材質

PTP＝ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム、紙箱

バラ＝ポリエチレン（容器）、ポリプロピレン（キャップ）、紙箱

X. 管理的事項に関する項目

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ガスモチン錠 2.5mg、ガスモチン錠 5mg（大日本住友）

同効薬：メトクロプラミド塩酸塩、ドンペリドン、トリメブチンマレイン酸塩、イトプリド塩酸塩等

9. 国際誕生年月日

1998年6月30日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

	承認年月日	承認番号
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」	2012年8月15日	22400AMX01054000
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」	2012年8月15日	22400AMX01055000

11. 薬価基準収載年月日

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「ZE」	2012年12月14日
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」	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

2020年9月30日付

「【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

【用法・用量】

・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。」
が承認された。

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、投薬期間制限の対象となる医薬品ではない。

X. 管理的事項に関する項目

16. 各種コード

販売名	包装	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「ZE」	100 錠 (PTP)	1218398010101	2399010F1150	622183901
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「ZE」	100 錠 (PTP)	1218404010101	2399010F2156	622184001
	1,000 錠 (PTP)	1218404010102		
	1,050 錠 (PTP)	1218404010201		
	1,000 錠 (バラ)	1218404010301		

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。

X I. 文献

1. 引用文献

- 1) 治療薬マニュアル 健胃・消化薬（医学書院），795（2020）
- 2) 全星薬品工業株式会社：安定性試験に関する資料（社内資料）
- 3) 全星薬品工業株式会社：溶出試験に関する資料（社内資料）
- 4) 第17改正日本薬局方解説書（廣川書店），C - 5558（2016）
- 5) 全星薬品工業株式会社：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

- a) 平田純生 著：改訂2版 透析患者への投薬ガイドブック，じほう，389（2009）

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない（本剤は外国では発売していない）

<参考>

モサプリドクエン酸塩製剤は中国、韓国、タイ等で発売されている。

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

該当資料なし（オーストラリアのカテゴリ分類に記載なし）

XⅢ. 備考

その他の関連資料

該当資料なし