

**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 2018（2019 年更新版）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 「日医工」****モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」****Mosapride Citrate Tablets**

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	なし
規格・含量	モサプリドクエン酸塩水和物を以下の量含有 2.5mg：1 錠中 2.65mg（モサプリドクエン酸塩として 2.5mg） 5mg：1 錠中 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 洋名：Mosapride Citrate Hydrate
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始 年月日	製造販売承認：2012 年 8 月 15 日 薬価基準収載：2012 年 12 月 14 日 販売開始：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：日医工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>

本 IF は 2023 年 7 月改訂（第 1 版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

# 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

## 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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

### 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>16</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ...	16
2. 製品の治療学的特性.....	1	2. 薬理作用.....	16
3. 製品の製剤学的特性.....	1	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>17</b>
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1	1. 血中濃度の推移.....	17
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1	2. 薬物速度論的パラメータ.....	18
6. RMP の概要.....	1	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	18
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	4. 吸収.....	19
1. 販売名.....	2	5. 分布.....	19
2. 一般名.....	2	6. 代謝.....	19
3. 構造式又は示性式.....	2	7. 排泄.....	19
4. 分子式及び分子量.....	2	8. トランスポーターに関する情報.....	19
5. 化学名（命名法）又は本質.....	2	9. 透析等による除去率.....	19
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	2	10. 特定の背景を有する患者.....	20
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>3</b>	11. その他.....	20
1. 物理化学的性質.....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>21</b>
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	3	1. 警告内容とその理由.....	21
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	3	2. 禁忌内容とその理由.....	21
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>4</b>	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	21
1. 剤形.....	4	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...	21
2. 製剤の組成.....	4	5. 重要な基本的注意とその理由.....	21
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	5	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	21
4. 力価.....	5	7. 相互作用.....	22
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	5	8. 副作用.....	22
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	5	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	23
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	9	10. 過量投与.....	23
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	9	11. 適用上の注意.....	23
9. 溶出性.....	9	12. その他の注意.....	23
10. 容器・包装.....	12	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>24</b>
11. 別途提供される資材類.....	13	1. 薬理試験.....	24
12. その他.....	13	2. 毒性試験.....	24
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>14</b>	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>25</b>
1. 効能又は効果.....	14	1. 規制区分.....	25
2. 効能又は効果に関連する注意.....	14	2. 有効期間.....	25
3. 用法及び用量.....	14	3. 包装状態での貯法.....	25
4. 用法及び用量に関連する注意.....	14	4. 取扱い上の注意点.....	25
5. 臨床成績.....	14	5. 患者向け資材.....	25

## 略語表

6.	同一成分・同効薬.....	25
7.	国際誕生年月日 .....	25
8.	製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日.....	25
9.	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.....	25
10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	26
11.	再審査期間 .....	26
12.	投薬期間制限に関する情報.....	26
13.	各種コード .....	26
14.	保険給付上の注意 .....	26
<b>X I.</b>	<b>文献</b> .....	<b>27</b>
1.	引用文献 .....	27
2.	その他の参考文献.....	27
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b> .....	<b>28</b>
1.	主な外国での発売状況.....	28
2.	海外における臨床支援情報 .....	28
<b>X III.</b>	<b>備考</b> .....	<b>29</b>
1.	調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報.....	29
2.	その他の関連資料.....	32

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
tmax	最高血中濃度到達時間
t <sub>1/2</sub>	消失半減期
S.D.	標準偏差
HPLC	高速液体クロマトグラフィー
RRT	相対保持時間

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、モサプリドクエン酸塩水和物を有効成分と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錠 2.5mg「日医工）」及び「モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工）」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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8月15日に承認を取得、2012年12月14日に販売を開始した。（薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づき承認申請）

2020年9月30日付で「モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「日医工）」及び「モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工）」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」の効能又は効果、用法及び用量が追加された。

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、モサプリドクエン酸塩水和物を有効成分とする消化管運動機能改善剤である。
- (2) 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。（「Ⅷ. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

### 3. 製品の製剤学的特性

- (1) PTPシートはピッチコントロールを行い、成分名、含量、屋号を表示した。
- (2) PTPシート裏面に「消化管運動機能改善薬」を表記した。

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

#### (1) 承認条件

該当しない

#### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

### 6. RMPの概要

該当しない

## 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 「日医工」

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」

#### (2) 洋名

Mosapride Citrate Tablets

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 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（stem）

スルピリド誘導体：-pride

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式：



### 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）又は本質

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

特になし

### 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、味は僅かに苦い。)

##### (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、定量法

##### (1) 確認試験法

###### 1) 紫外可視吸光度測定法

本品のメタノール溶液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 2) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 3) 定性反応

本品の *N,N*-ジメチルホルムアミド溶液はクエン酸塩の定性反応(1)を呈する。

##### (2) 定量法

###### 電位差滴定法

本品を酢酸に溶かし、過塩素酸で滴定する。

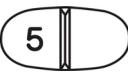
#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

###### (2) 製剤の外観及び性状

販売名		モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」	モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」
剤形		フィルムコーティング錠	割線入りのフィルムコーティング錠
色調		白色	
外形	表面		
	裏面		
	側面		
直径 (mm)		6.1	9.1×4.6
厚さ (mm)		3.0	3.6
質量 (mg)		83	134
本体表示		n 331 2.5	n 332 5
包装コード		Ⓝ331	Ⓝ332

###### (3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

###### (4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

###### (5) その他

該当しない

##### 2. 製剤の組成

###### (1) 有効成分 (活性成分) の含量及び添加剤

販売名	モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」	モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」
有効成分	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)	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)
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、軽質無水ケイ酸、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、酸化チタン、タルク、マクロゴール 6000、カルナウバロウ	

**(2) 電解質等の濃度**

該当資料なし

**(3) 熱量**

該当資料なし

**3. 添付溶解液の組成及び容量**

該当しない

**4. 力価**

該当しない

**5. 混入する可能性のある夾雑物**

該当資料なし

**6. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>**

(1) 加速試験

試験実施期間：2015/6/13～2015/12/28

◇モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「日医工」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態 (PTP 包装)]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <白色のフィルムコーティング 錠>	A00100 A00200 A00300	適合	適合	適合	適合
確認試験 (紫外可視吸光度測定法、 定性反応)	A00100 A00200 A00300	適合	—	適合	適合
純度試験 (HPLC) <※1>	A00100 A00200 A00300	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) <15.0%以下>	A00100 A00200 A00300	1.3 1.3 1.6	—	1.2 2.6 2.1	1.9 2.5 2.1
溶出性 (%) <45 分、80%以上>	A00100 A00200 A00300	95.7～97.1 95.7～98.9 95.0～97.8	91.8～ 99.7 96.3～102.6 96.6～101.0	92.3～100.9 97.6～101.7 92.3～100.2	94.7～100.9 90.4～103.0 95.9～ 98.7
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	A00100 A00200 A00300	100.5 101.0 100.2	100.5 101.1 101.8	100.7 100.7 101.5	102.0 102.3 102.4

※1：RRT 約 0.60、0.85 の類縁物質：0.5%以下、左記以外の個々の類縁物質：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

—：試験未実施

試験実施期間：2015/5/1～2015/11/3

◇モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態 (PTP包装)]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <白色の割線入りのフィルム コーティング錠>	A04500TH A04600TH A04700TH	適合	適合	適合	適合
確認試験 (紫外可視吸光度測定法、 定性反応)	A04500TH A04600TH A04700TH	適合	—	適合	適合
純度試験 (HPLC) <※1>	A04500TH A04600TH A04700TH	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) <15.0%以下>	A04500TH A04600TH A04700TH	2.6 2.4 1.4	—	1.5 2.9 1.4	2.4 2.0 1.3
溶出性 (%) <45 分、80%以上>	A04500TH A04600TH A04700TH	91.6～95.9 91.5～93.7 89.4～94.2	88.2～91.8 87.1～90.6 88.3～89.9	83.3～87.2 88.9～92.7 89.3～91.1	86.8～91.3 87.5～90.8 86.1～89.6
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	A04500TH A04600TH A04700TH	103.0 101.6 101.2	101.3 101.1 101.2	99.5 99.2 99.1	101.7 100.9 99.4

※1：RRT 約 0.60、0.85 の類縁物質：0.5%以下、左記以外の個々の類縁物質：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%) —：試験未実施

◇モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態 (バラ包装)]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <白色の割線入りのフィルム コーティング錠>	A04500TB A04600TB A04700TB	適合	適合	適合	適合
確認試験 (紫外可視吸光度測定法、 定性反応)	A04500TB A04600TB A04700TB	適合	—	適合	適合
純度試験 (HPLC) <※1>	A04500TB A04600TB A04700TB	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) <15.0%以下>	A04500TB A04600TB A04700TB	2.6 2.4 1.4	—	2.2 1.7 1.4	1.6 1.5 0.6
溶出性 (%) <45 分、80%以上>	A04500TB A04600TB A04700TB	91.6～95.9 91.5～93.7 89.4～94.2	88.0～90.1 87.4～89.2 87.4～90.9	87.2～91.0 88.2～91.8 86.5～90.5	86.7～90.6 86.5～89.7 86.9～89.1
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	A04500TB A04600TB A04700TB	103.0 101.6 101.2	101.6 101.3 100.5	100.2 99.7 99.1	100.6 101.8 102.2

※1：RRT 約 0.60、0.85 の類縁物質：0.5%以下、左記以外の個々の類縁物質：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%) —：試験未実施

(2) 無包装状態の安定性

試験実施期間：2015/11/18～2016/3/25

◇モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2週間	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 n=10 <白色のフィルム コーティング錠>	CR0501	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	CR0501	適合	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 <45分、80%以上>	CR0501	96.1～102.6	91.4～98.8	92.3～95.0	87.7～96.8	94.6～98.1
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	CR0501	100.6～100.9	100.6～100.9	98.2～100.8	100.5～101.3	100.6～101.1
(参考値) 硬度 (N) n=10	CR0501	63～58	60～69	63～72	61～73	61～10

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質質量 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

◇モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2週間	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 n=10 <白色のフィルム コーティング錠>	CR0501	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	CR0501	適合	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 <45分、80%以上>	CR0501	96.1～102.6	90.3～92.4	89.1～91.6	87.8～91.3	87.2～90.5
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	CR0501	100.6～100.9	101.6～102.0	101.3～101.5	101.4～101.8	101.7～102.0
(参考値) 硬度 (N) n=10	CR0501	63～58	30～37	35～39	37～40	33～37

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質質量 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

◇モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「日医工」 無包装 室温、曝光 [D65光源 (1600Lx)、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40万 Lx・hr	80万 Lx・hr	120万 Lx・hr
性状 n=10 <白色のフィルム コーティング錠>	CR0501	白色のフィルムコー ティング錠	白色のフィルムコー ティング錠	白色のフィルムコー ティング錠	白色のフィルムコー ティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	CR0501	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 <45分、80%以上>	CR0501	96.1～102.6	90.4～99.4	88.4～94.1	88.8～95.7
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	CR0501	100.6～100.9	100.3～101.2	100.7～101.1	100.6～100.9
(参考値) 硬度 (N) n=10	CR0501	63～58	65～71	61～75	65～74

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質質量 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

試験実施期間：2016/9/12～2016/12/20

◇モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2週間	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 n=10 ＜白色の割線入りのフィルムコーティング錠＞	B06000	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	B06000	適合	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 ＜45分、80%以上＞	B06000	87.5～93.8	88.8～94.4	91.6～95.2	88.9～96.2	91.6～99.0
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	B06000	103.0～103.7	103.4～103.7	103.7～104.0	103.4～103.9	103.4～103.9
(参考値) 硬度 (N) n=10	B06000	150～177	148～162	140～155	133～161	126～146

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質質量 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

◇モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2週間	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 n=10 ＜白色の割線入りのフィルムコーティング錠＞	B06000	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	B06000	適合	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 ＜45分、80%以上＞	B06000	87.5～93.8	83.2～88.3	86.2～90.1	83.1～88.3	78.3～89.1※3
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	B06000	103.0～103.7	104.1～104.6	104.6～105.0	104.5～104.8	104.5～104.9
(参考値) 硬度 (N) n=10	B06000	150～177	82～91	73～85	80～92	84～91

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質質量 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%) ※3：10/12錠適合のため、規格に適合した。

◇モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」 無包装 室温、曝光 [D65光源 (約 1600Lx)、シャレーをラップで覆う]

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	30万 Lx・hr	60万 Lx・hr	120万 Lx・hr
性状 n=10 ＜白色の割線入りのフィルムコーティング錠＞	B06000	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠	白色の割線入りのフィルムコーティング錠
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	B06000	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) n=6 ＜45分、80%以上＞	B06000	87.5～93.8	91.6～98.2	86.9～94.5	82.9～93.1
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	B06000	103.0～103.7	103.1～104.3	103.7～104.5	104.1～104.6
(参考値) 硬度 (N) n=10	B06000	150～177	136～152	115～125	104～118

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質質量 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

**7. 調製法及び溶解後の安定性**

該当しない

**8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）**

該当しない

**9. 溶出性**

(1) 溶出規格

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

(試験液に溶出試験第2液 900mLを用い、パドル法により、50rpmで試験を行う。)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
2.5mg、5mg	45分	80%以上

(2) 溶出試験<sup>2)</sup>

<モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」>

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（平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

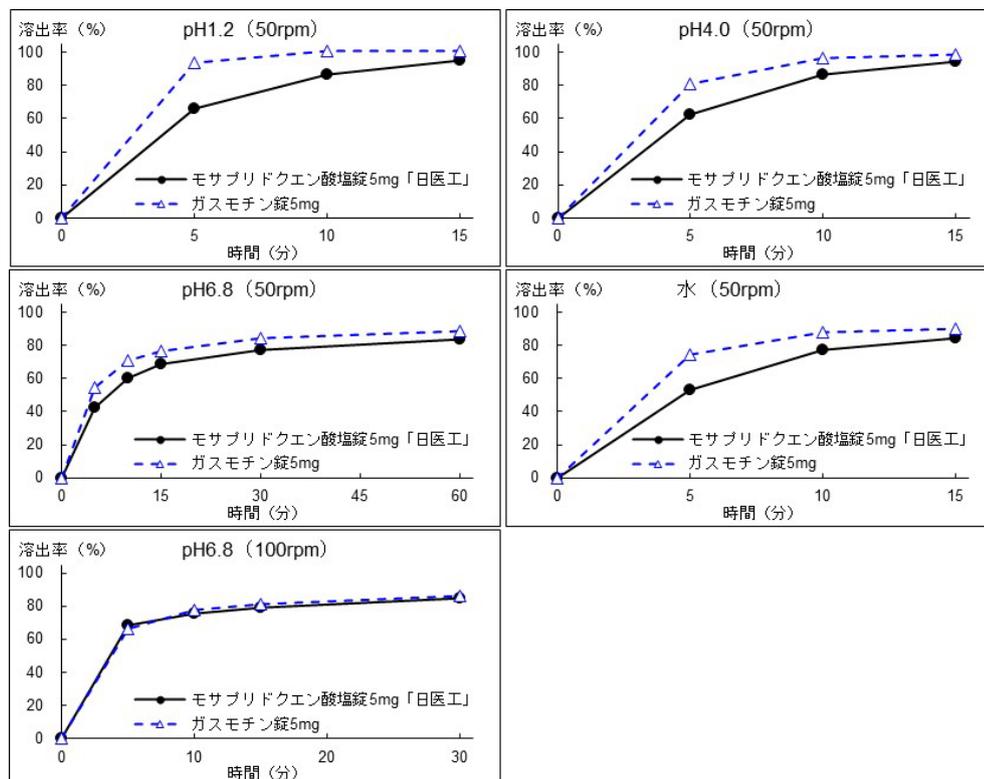
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)、100rpm (pH6.8)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出し、15 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (100rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（ガスモチン錠 5mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

(3) 含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験<sup>3)</sup>

<モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「日医工」>

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「日医工」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 薬食審査発第 1124004 号)に基づき、モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」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。

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

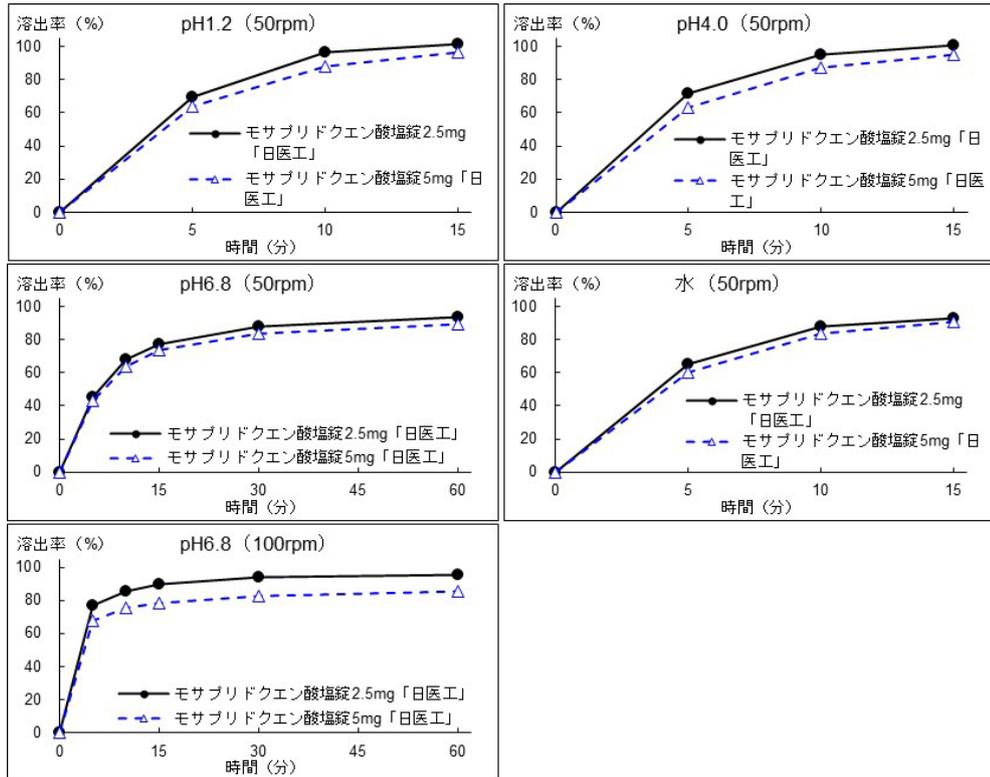
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)、100rpm (pH6.8)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。また、最終比較時点 (15 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±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。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。また、最終比較時点 (15 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±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。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。また、最終比較時点 (30 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±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。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。また、最終比較時点 (15 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±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。
- ・ pH6.8 (100rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。また、最終比較時点 (60 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±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、本品の溶出挙動を標準製剤 (モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」) と比較した結果、全ての試験液において「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」の溶出挙動の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

〈モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」〉

100錠 [10錠×10; PTP]

〈モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」〉

100錠 [10錠×10; PTP]

1000錠 [10錠×100; PTP]

1000錠 [アルミ袋;バラ]

(3) 予備容量

該当しない

**(4) 容器の材質**

販売名	PTP 包装	バラ包装
モサプリドクエン酸 塩錠 2.5mg「日医工」	PTP : ポリ塩化ビニルフィルム、アル ミニウム箔	—
モサプリドクエン酸 塩錠 5mg「日医工」	ピロー : ポリエチレンテレフタレート・ アルミニウム・ポリエチレンラ ミネートフィルム	袋 : ポリエチレンテレフタレート・アル ミニウム・ポリエチレンラミネート フィルム

**11. 別途提供される資材類**

該当資料なし

**12. その他**

該当記載事項なし

## 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

### 2. 効能又は効果に関連する注意

#### 5.効能又は効果に関連する注意

##### 〈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。

[17.1.1 参照]

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

##### 〈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。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

#### 7.用法及び用量に関連する注意

##### 〈慢性胃炎に伴う消化器症状（胸やけ、悪心・嘔吐）〉

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。

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

###### 〈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〉

###### 17.1.1 国内第Ⅲ相試験

バリウム注腸 X 線造影検査の前処置におけるブラウン変法との比較試験は、計 99 例を対象として実施された。その結果、モサプリドクエン酸塩と経口腸管洗浄剤（ニフレック配合内用剤）併用群の「右大腸バリウムの付着性スコア」及び「右大腸便残渣の量スコア」について、ブラウン変法群に劣らないことが確認された。[5. 参照]

群	ブラウン変法群	モサプリドクエン酸塩と ニフレック配合内用剤との 併用群
右大腸バリウムの付着性スコア	9.4±1.0	9.3±1.5
右大腸便残渣の量スコア	9.2±1.5	10.8±1.6

平均値±標準偏差、各群 46 例

スコア：右大腸（横行結腸、上行結腸、盲腸）の「バリウムの付着性」及び「便残渣の量」について、部位毎に 5 段階評価し、3 部位の点数を合計したもの（最高：15 点、最低：3 点）。

安全性評価対象 48 例（モサプリドクエン酸塩とニフレック配合内用剤との併用群）中 8 例（16.7%）に副作用がみられた。発現頻度が 5%以上であった副作用は、腹部膨満 3 例（6.3%）であった<sup>4)</sup>。

##### 2) 安全性試験

該当資料なし

#### (5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

#### (7) その他

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

消化管運動改善薬、セロトニン受容体作動薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

モサプリドは選択的なセロトニン 5-HT<sub>4</sub> 受容体アゴニストであり、消化管内在神経叢に存在する 5-HT<sub>4</sub> 受容体を刺激し、アセチルコリン遊離の増大を介して上部及び下部消化管運動促進作用を示すと考えられている<sup>5)7)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 上部消化管運動促進作用

###### 18.2.1 胃、十二指腸運動促進作用

用量依存的に、食後期の胃、十二指腸運動促進作用を示す<sup>5)</sup> (イヌ)。

###### 18.2.2 胃排出促進作用

(1) 健康成人及び慢性胃炎患者を対象とした胃排出試験において、モサプリドクエン酸塩 5mg1 回投与で胃排出促進作用を示す<sup>8)9)</sup>。

(2) 液体物の胃排出促進作用 (マウス、ラット) 及び固形物の胃排出促進作用 (ラット) を示す。なお、1 週間の反復投与で胃排出促進作用は減弱する<sup>6)10)</sup> (ラット)。

##### 18.3 下部消化管運動促進作用

###### 18.3.1 結腸運動及び内容物輸送促進作用

用量依存的に結腸運動及び内容物輸送促進作用を示す<sup>7)11)</sup> (モルモット)。

###### 18.3.2 結腸内の洗浄増強効果及び水分重量減少作用 (経口腸管洗浄剤併用時)

経口腸管洗浄剤 (ニフレック配合内用剤) 投与による結腸内の洗浄効果を増強し、さらに結腸内の水分重量を減少する<sup>11)</sup> (モルモット)。

#### (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

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 16.1.1 単独投与時

(健康成人 5 例、空腹時モサプリドクエン酸塩 5mg 1 回経口投与) <sup>12)</sup>

T <sub>max</sub> (h)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0~∞</sub> (ng・h/mL)
0.8±0.1	30.7±2.7	2.0±0.2	67±8

平均値±標準誤差

##### 16.1.2 経口腸管洗浄剤併用時

(健康成人、空腹時モサプリドクエン酸塩 20mg (1 回目) 経口投与後、経口腸管洗浄剤 (ニフレック配合内用剤) を服用し、1 回目の投与から 2 時間後モサプリドクエン酸塩 20mg (2 回目) 経口投与) <sup>13)</sup>

投与時期	T <sub>max</sub> (h)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	AUC (ng・h/mL)
1 回目 (24 例)	1.0±0.5	116.1±35.1	150.3±45.2 (0~2)
2 回目 (23 例)	2.5±0.2	272.6±80.9	848.8±301.4 (0~24)

平均値±標準偏差

##### 16.1.3 生物学的同等性試験

<モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」><sup>3)</sup>

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」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 薬食審査発 1124004 号)」に基づき、モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等と判定され、生物学的に同等とみなされた。

<モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」><sup>14)</sup>

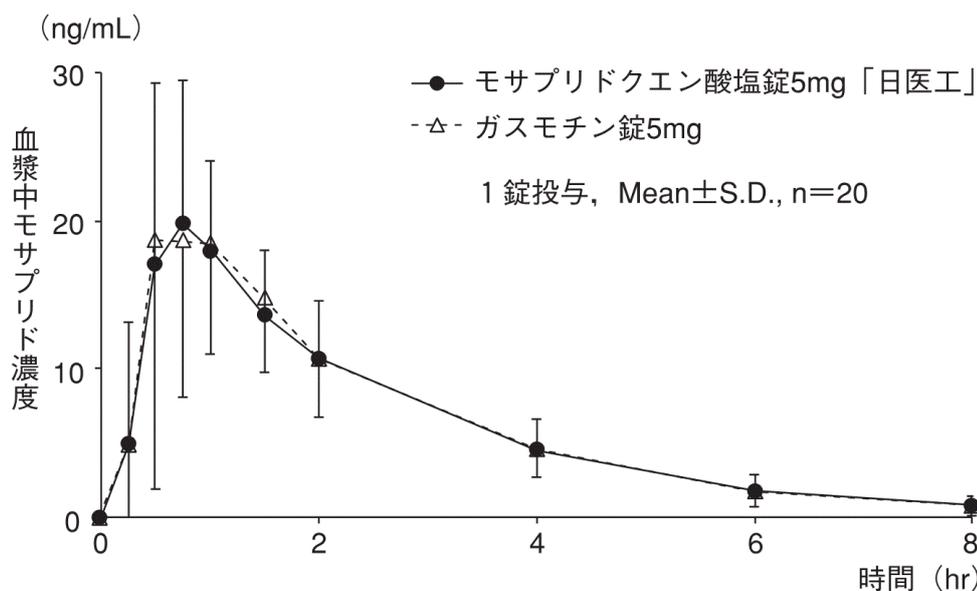
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について (平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号)

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」及びガスモチン錠 5mg 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、C<sub>max</sub>) 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。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>t</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」	50.4±18.8	23.8±9.28	0.81±0.31	1.54±0.29
ガスモチン錠 5mg	51.4±19.7	25.5±12.4	0.84±0.36	1.59±0.41

(1 錠投与、Mean±S.D.、n=20)



血漿中薬物濃度推移

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。

### (3) 中毒域

該当資料なし

### (4) 食事・併用薬の影響

#### 16.7.1 エリスロマイシン

モサプリドクエン酸塩 15mg/日にエリスロマイシン 1,200mg/日を併用したところ、単独投与時に比べて、モサプリドの最高血漿中濃度は 42.1ng/mL から 65.7ng/mL に上昇し、半減期は 1.6 時間から 2.4 時間に延長し、AUC<sub>0~4</sub> は 62ng・h/mL から 114ng・h/mL に増加した<sup>15)</sup> (健康成人)。

(「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照)

## 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) 消失速度定数

該当資料なし

### (4) クリアランス

該当資料なし

### (5) 分布容積

該当資料なし

### (6) その他

該当資料なし

## 3. 母集団 (ポピュレーション) 解析

### (1) 解析方法

該当資料なし

## (2) パラメータ変動要因

該当資料なし

## 4. 吸収

該当資料なし

## 5. 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

(「VIII. 6. (5) 妊婦」の項参照)

### (3) 乳汁への移行性

(「VIII. 6. (6) 授乳婦」の項参照)

### (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

### (6) 血漿蛋白結合率

#### 16.3.1 血清蛋白結合率

99.0% (*in vitro*、ヒト血清、1 $\mu$ g/mL、限外ろ過法又は平衡透析法)<sup>16)</sup>

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

#### 16.4.1 主な代謝産物

4-フルオロベンジル基脱離体<sup>12)</sup>

#### 16.4.2 代謝経路

主として肝臓で4-フルオロベンジル基の脱離、これに続くモルホリン環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<sup>11)・17)</sup>。

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

#### 16.4.3 代謝酵素

主として CYP3A4<sup>18)</sup>

### (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活性比、存在比率

該当資料なし

## 7. 排泄

#### 16.5.1 排泄経路

尿中、糞便中<sup>19)</sup>

#### 16.5.2 排泄率

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 7.0%であった<sup>12)</sup> (健康成人、空腹時モサプリドクエン酸塩 5mg1 回投与)。

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

該当資料なし

**10. 特定の背景を有する患者**

該当資料なし

**11. その他**

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

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

設定されていない

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

（「Ⅴ. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。）

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

（「Ⅴ. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。）

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8. 重要な基本的注意

**8.1** 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。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。[11.1.1 参照]

（解説）

肝機能障害等を重症化させないためには、その初期症状をいかに早く把握するかが重要となる。そのため、本剤投与中は、本剤投与後の肝機能障害に関連する初期症状の発現や、発現した場合の対応につき、患者へ指導する等の注意喚起を行っている。

### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### （1）合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

#### （2）腎機能障害患者

設定されていない

#### （3）肝機能障害患者

設定されていない

#### （4）生殖能を有する者

設定されていない

#### （5）妊婦

#### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

#### （6）授乳婦

#### 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁への移行が報告されている。

## (7) 小児等

### 9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

## (8) 高齢者

### 9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に腎機能、肝機能等の生理機能が低下している。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。

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

### (2) 併用注意とその理由

#### 10.2 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 ので、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。

(解説)

覚醒イヌを用いた実験で、抗コリン剤であるアトロピンの存在下では、本剤は胃運動を促進しないことが示されている<sup>5)</sup>。

## 8. 副作用

### 11.副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

### (1) 重大な副作用と初期症状

#### 11.1 重大な副作用

##### 11.1.1 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

劇症肝炎、著しいAST、ALT、 $\gamma$ -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。[8.1 参照]

(解説)

本剤投与中は、倦怠感、食欲不振、悪心・嘔吐、黄疸（皮膚の黄変、白目の黄染）、尿の濃色化、発熱、発疹、痒痒感等の初期症状及びAST、ALT、 $\gamma$ -GTP、ALP、ビリルビンの上昇等の肝機能検査値異常に注意し、これらの異常が認められた場合は、直ちに本剤の投与を中止し、速やかに適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

11.2 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）〉			
	1～2%未満	1%未満	頻度不明
過敏症		浮腫	発疹、じん麻疹
血液	好酸球増多	白血球減少	
消化器	下痢・軟便	口渇、味覚異常、腹痛、嘔吐	嘔気、腹部膨満感、口内しびれ感（舌、口唇等を含む）
肝臓		AST、ALT、ALP、 $\gamma$ -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	中性脂肪の上昇	倦怠感	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〉			
	1～5%未満	1%未満	
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	尿潜血、尿蛋白	胸部不快感、寒気、倦怠感、顔面腫脹、LDH の上昇	

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

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。

## 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」の項参照)

#### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

#### (4) がん原性試験

該当資料なし

#### (5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

#### (7) 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	モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」 モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」	なし
有効成分	モサプリドクエン酸塩水和物	なし

### 2. 有効期間

3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意点

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：有（「XⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照）

### 6. 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

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」	2012年8月15日	22400AMX01215000	2012年12月14日	2012年12月14日
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」	2012年8月15日	22400AMX01217000	2012年12月14日	2012年12月14日

## 9. 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

<効能又は効果、用法及び用量追加>

効能又は効果、用法及び用量追加年月日：2020年9月30日

販売名：モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「日医工」

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「日医工」

内容：

	新	旧
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	慢性胃炎に伴う消化器症状（胸やけ、悪心・嘔吐）
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。	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。

(\_\_：効能又は効果、用法及び用量追加に伴う変更箇所)

## 10. 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

## 11. 再審査期間

該当しない

## 12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」を参照）

## 13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT(9桁)番号	レセプト電算処理 システム用コード
モサプリドクエン酸 塩錠 2.5mg「日医工」	2399010F1010	2399010F1249	122158901	622215801
モサプリドクエン酸 塩錠 5mg「日医工」	2399010F2016	2399010F2245	122083401	622208301

## 14. 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。

## X I. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験（錠 5mg）
- 3) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 2.5mg）
- 4) 杉野吉則 他：日本大腸検査学会雑誌. 2008 ; 25 (2) : 99-114
- 5) Yoshida N., et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther. 1991 ; 257 (2) : 781-787 (PMID: 2033519)
- 6) 薬効薬理（ガスモチン錠・散：2009年4月22日承認、申請資料概要 2.6.2）
- 7) Inui A., et al. : Jpn. J. Pharmacol. 2002 ; 90 : 313-320 (PMID: 12501007)
- 8) 金泉年郁 他：日本平滑筋学会雑誌. 1990 ; 26 : 161-174
- 9) 須山哲次 他：内科宝函. 1993 ; 40 (7) : 175-183
- 10) 日本薬剤師研修センター編：医薬品服薬指導情報集〔薬効別〕 追補版 2. 2005 ; 437-446
- 11) Mine Y., et al. : J. Pharmacol. Sci. 2009 ; 110 : 415-423 (PMID: 19602846)
- 12) Sakashita M., et al. : Arzneim.-Forsch./Drug Res. 1993 ; 43 (8) : 867-872 (PMID: 8216445)
- 13) 降旗謙一 他：診療と新薬. 2009 ; 46 (3) : 262-271
- 14) 小松崎徹也 他：診療と新薬. 2012 ; 49 (11) : 1367-1376
- 15) 加藤貴雄 他：臨床医薬. 1999 ; 15 (5) : 753-763
- 16) Matsumoto S., et al. : Arzneim.-Forsch./Drug Res. 1993 ; 43 (10) : 1084-1094 (PMID: 8267675)
- 17) Matsumoto S., et al. : Arzneim.-Forsch./Drug Res. 1993 ; 43 (10) : 1095-1102 (PMID: 8267676)
- 18) 代謝酵素（ガスモチン錠・散：2009年4月22日承認、申請資料概要 2.6.4）
- 19) 排泄（ガスモチン錠・散：2009年4月22日承認、申請資料概要 2.6.4）

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## **X II. 参考資料**

### **1. 主な外国での発売状況**

なし

### **2. 海外における臨床支援情報**

該当しない

### XIII. 備考

#### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

##### 本項の情報に関する注意

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。

試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。

医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

##### (1) 粉砕

##### モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」

粉砕物の安定性を 25°C・75%RH 及び 120 万 Lx・hr の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、純度及び含量は規格内であった。

検体作成：試験製剤を乳鉢で粉砕した。

試験実施期間：2015/11/18～2016/3/25

#### ● 粉砕物 25°C・75%RH [遮光、開放] (最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10	CR0501	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	CR0501	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	CR0501	100.6～100.9	101.4～102.1	101.2～101.4	101.0～101.2	100.4～100.5
(参考値) 重量変化 (%)	CR0501	—	+1.9	+1.8	+1.5	+1.1

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

#### ● 粉砕物 室温、曝光 [D65 光源 (約 1600Lx)、気密容器] (最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=10	CR0501	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	CR0501	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	CR0501	100.6～100.9	102.1～102.7	103.2～103.7	102.8～103.8

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

### モサブリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」

粉碎物の安定性を 25℃・75%RH 及び 120 万 Lx・hr の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、純度及び含量は規格内であった。

検体作成：試験製剤を乳鉢で粉碎した。

試験実施期間：2015/11/18～2016/3/25

#### ● 粉碎物 25℃・75%RH [遮光、開放] (最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10	DR3302	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	DR3302	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	DR3302	99.2～99.3	99.9～100.1	99.1～99.9	99.0～100.0	98.6～98.8
(参考値) 重量変化 (%)	DR3302	—	+2.0	+1.9	+1.3	+0.7

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

#### ● 粉碎物 曝光 [D65 光源 (約 1600Lx)、気密容器] (最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=10	DR3302	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
純度試験 (HPLC) n=3 <※1>	DR3302	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ※2 n=3 <95.0～105.0%>	DR3302	99.2～99.3	99.0～100.1	99.5～100.7	99.5～102.0

※1：RRT 約 0.60 及び約 0.85 の類縁物質 0.5%以下、その他の個々の類縁物質 0.2%以下、総類縁物質 1.0%以下

※2：表示量に対する含有率 (%)

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

### モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55°C の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2015/12/11~12/14

ロット番号：CR0501

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「日医工」	5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

## モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」

### 1) 試験方法

#### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55°C の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

#### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2015/12/11~12/14

ロット番号：DR3302

### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「日医工」	5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

## 2. その他の関連資料

モサプリドクエン酸塩錠／散「日医工」を服用される方へ

### モサプリドクエン酸塩錠／散「日医工」 を服用される方へ

このお薬は、消化管の運動を促進して、胸やけ、悪心・おう吐などの症状を改善するお薬です。

▶ **飲み方について**

- 医師または薬剤師の指示通りに服用してください。

▶ **服用中の注意点**

- 他の病院を受診する場合や、薬局で他のお薬を購入する場合には、必ずこのお薬を服用していることを医師または薬剤師に伝えてください。

▶ **副作用について**

- このお薬により、肝臓の障害がおこることがあります。次の症状があらわれた場合は、お薬の服用をやめて、すぐに医師または薬剤師に相談してください。

体がだるくなる

食欲がなくなる

尿の色が濃くなる

皮膚や白目が黄色くなる

● この他にも気になる症状があらわれた場合やわからないことがある場合には、医師または薬剤師に気軽に相談してください。

 日医工株式会社  
2023年6月作成 N202100367