

## 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 2008 に準拠して作成

### 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「TSU」 モサプリドクエン酸塩錠 5mg「TSU」

Mosapride Citrate Tablets 2.5mg/5mg

|                           |   |
|---------------------------|---|
| 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                     | 錠 2.5mg：1錠中モサプリドクエン酸塩水和物を<br>モサプリドクエン酸塩として 2.5mg<br>錠 5mg：1錠中モサプリドクエン酸塩水和物を<br>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<br>洋名：Mosapride Citrate Hydrate  |
| 製造販売承認年月日<br>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<br>薬価基準収載年月日：2012年12月14日<br>販売年月日：2012年12月14日  |
| 開発・製造販売（輸入）・<br>提携・販売会社名  | 製造販売元：鶴原製薬株式会社  |
| 医薬情報担当者の連絡先               |   |
| 問い合わせ窓口                   | 鶴原製薬株式会社 医薬情報部<br>TEL：072-761-1456（代表） FAX：072-760-5252<br>医療関係者向けホームページ<br><a href="http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/">http://www.tsuruhara-seiyaku.co.jp/member/</a> |

本 I F は2012年11月作成（第1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<http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

## I F 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、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。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「IF 記載要領 2008」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「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）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

「医薬品インタビューフォーム記載要領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  |
| [ II ] 名称に関する項目             | 2  |
| [ III ] 有効成分に関する項目          | 3  |
| [ IV ] 製剤に関する項目             | 4  |
| [ V ] 治療に関する項目              | 13 |
| [ VI ] 薬効薬理に関する項目           | 14 |
| [ VII ] 薬物動態に関する項目          | 15 |
| [ VIII ] 安全性(使用上の注意等)に関する項目 | 19 |
| [ IX ] 非臨床試験に関する項目          | 22 |
| [ X ] 管理的事項に関する項目           | 23 |
| [ X I ] 文 献                 | 25 |
| [ X II ] 参考資料               | 25 |
| [ X III ] 備 考               | 25 |

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「TSU」、モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」は、鶴原製薬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月に上市した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

## 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 「TSU」

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」

#### 2) 洋名

Mosapride Citrate Tablets 2.5mg 「TSU」

Mosapride Citrate Tablets 5mg 「TSU」

#### 3) 名称の由来：

一般名＋剤形＋規格(含量)＋「TSU」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」  
(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づく〕

### 2. 一般名

#### 1) 和名（命名法）

モサプリドクエン酸塩水和物（JAN）

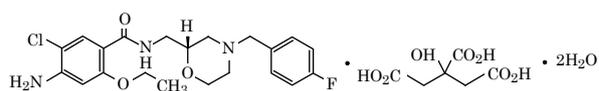
#### 2) 洋名（命名法）

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



及び鏡像異性体

### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>21</sub>H<sub>25</sub>ClFN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>・C<sub>6</sub>H<sub>8</sub>O<sub>7</sub>・2H<sub>2</sub>O

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

### 6. 慣用名，別名，略号，記号番号

該当資料なし

### 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

モサプリドクエン酸塩水和物は白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。

*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) 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

該当資料なし

#### 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」による。

#### 4. 有効成分の定量法

日局「モサプリドクエン酸塩水和物」による。

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### 1) 剤形の区別及び性状

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「TSU」：白色のフィルムコーティング錠

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」：白色の割線入りフィルムコーティング錠

|            |   |   |   |   |
|------------|---|---|---|---|
| 2.5mg<br>錠 |  |  |  | 直径：約 6.1mm<br>厚さ：約 2.7mm<br>質量：約 82.5mg |
| 5mg<br>錠   |  |  |  | 直径：約 6.6mm<br>厚さ：約 2.9mm<br>質量：約 103mg  |

#### 2) 製剤の物性

該当資料なし

#### 3) 識別コード

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「TSU」：表面 M47、裏面 2.5

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」：表面 M46、裏面 5

#### 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

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「TSU」：1 錠中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

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」：1 錠中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

#### 2) 添加物

乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度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、マクロゴール 6000、酸化チタン、タルク、カルナウバロウ

#### 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

該当資料なし

#### 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 「TSU」:

試験条件及び保管

| 試験期間及び保管                       | 試験期間 | 保存包装  | 試験項目   | ロット                     |
|--------------------------------|------|---|--|-------------------------|
| 加速試験<br>温度 40±1℃<br>湿度 75±5%RH | 6ヶ月  | PTP包装:PTP<br>包装をアルミ袋<br>に入れ紙箱に入<br>れたものを使用<br>した。 | I : 性状<br>II : 確認試験<br>III : 純度試験 (類縁物質)<br>IV : 製剤均一性(含量均一性試験)<br>V : 溶出性<br>VI : 定量法 | M47-1<br>M47-2<br>M47-3 |

##### I. 性状

全ての検体において、規格に適合した。

##### II. 確認試験

全ての検体において、規格に適合した。

##### III. 純度試験 (類縁物質)

全ての検体において、規格に適合した。

##### IV. 製剤均一性(含量均一性試験)

全ての検体において、規格に適合した。

##### V. 溶出性

全ての検体において、規格に適合した。

##### VI. 定量法

全ての検体において、規格に適合した。

以上、加速条件で6ヶ月間保存した本品のPTP包装品の全ての検体で、全ての規格に適合していた。よってこの包装形態にて安定であると判断し、室温で3年間は安定な薬剤であると判断した。

|               | 保存期間 | ロット   | 回数 | 性状          | 確認試験         | 純度試験 | 製剤均一性 | 溶出    | 定量    |
|---------------|------|-------|----|-------------|--------------|------|-------|-------|-------|
| 加速試験<br>PTP包装 | 製造時  | M47-1 | 1  | 白色のフィルムコート錠 | (1)適<br>(2)適 | 適    | 適     | 適     | 99.3  |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.2 |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.2 |
|               |      | M47-2 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.4 |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.5  |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.6 |
|               |      | M47-3 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.2  |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.6  |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.4 |
|               | 1ヵ月  | M47-1 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.5  |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.0 |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 101.1 |
|               |      | M47-2 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.1  |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.1  |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.8  |
|               |      | M47-3 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.2 |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 98.7  |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.2 |
|               | 3ヵ月  | M47-1 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.2 |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 101.1 |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.2 |
|               |      | M47-2 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.6 |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.3  |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 99.5  |
|               |      | M47-3 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.0 |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 98.9  |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.6 |
|               | 6ヵ月  | M47-1 | 1  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.9 |
|               |      |       | 2  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 98.9  |
|               |      |       | 3  | 同上          | 同上           | 適    | 適     | 適     | 100.7 |
| M47-2         |      | 1     | 同上 | 同上          | 適            | 適    | 適     | 100.7 |       |
|               |      | 2     | 同上 | 同上          | 適            | 適    | 適     | 99.5  |       |
|               |      | 3     | 同上 | 同上          | 適            | 適    | 適     | 100.9 |       |
| M47-3         |      | 1     | 同上 | 同上          | 適            | 適    | 適     | 99.1  |       |
|               |      | 2     | 同上 | 同上          | 適            | 適    | 適     | 99.1  |       |
|               |      | 3     | 同上 | 同上          | 適            | 適    | 適     | 100.7 |       |

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」:

試験条件及び保管

| 試験期間及び保管                       | 試験期間 | 保存包装  | 試験項目   | ロット                     |
|--------------------------------|------|---|--|-------------------------|
| 加速試験<br>温度 40±1℃<br>湿度 75±5%RH | 6ヶ月  | PTP包装: PTP包装をアルミ袋に入れ紙箱に入れたものを使用した。<br>バラ包装:<br>ポリエチレン製の容器に錠剤を入れ、不透明のポリプロピレン製の蓋をしたものを使用した。 | I: 性状<br>II: 確認試験<br>III: 純度試験 (類縁物質)<br>IV: 製剤均一性(含量均一性試験)<br>V: 溶出性<br>VI: 定量法 | M46-1<br>M46-2<br>M46-3 |

I. 性状

全ての検体において、規格に適合した。

II. 確認試験

全ての検体において、規格に適合した。

III. 純度試験 (類縁物質)

全ての検体において、規格に適合した。

IV. 製剤均一性(含量均一性試験)

全ての検体において、規格に適合した。

V. 溶出性

全ての検体において、規格に適合した。

VI. 定量法

全ての検体において、規格に適合した。

以上、加速条件で6ヶ月間保存した本品の PTP 包装品及びバラ包装品の全ての検体で、全ての規格に適合していた。よってこの包装形態にて安定であると判断し、室温で3年間は安定な薬剤であると判断した。

|               | 保存<br>期間 | ロット       | 回<br>数 | 性<br>状                   | 確<br>認<br>試<br>験 | 純<br>度<br>試<br>験 | 製<br>剤<br>均<br>一<br>性 | 溶<br>出 | 定<br>量 |
|---------------|----------|-----------|--------|--------------------------|------------------|------------------|-----------------------|--------|--------|
| 加速試験<br>PTP包装 | 製造時      | M46<br>-1 | 1      | 白色の割線<br>入りフィルム<br>ムコート錠 | (1)適<br>(2)適     | 適                | 適                     | 適      | 99.5   |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.8   |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 100.7  |
|               |          | M46<br>-2 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.1   |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 100.0  |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.1   |
|               |          | M46<br>-3 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 100.4  |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.5   |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.3   |
|               | 1ヵ月      | M46<br>-1 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.7   |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.6   |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.1   |
|               |          | M46<br>-2 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.9   |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.9  |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 98.8   |
|               |          | M46<br>-3 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.1   |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 98.9   |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 98.8   |
|               | 3ヵ月      | M46<br>-1 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.7  |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.5   |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.4  |
|               |          | M46<br>-2 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.2  |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.0  |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 98.9   |
|               |          | M46<br>-3 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.8  |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.5  |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.3   |
|               | 6ヵ月      | M46<br>-1 | 1      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 98.8   |
|               |          |           | 2      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 100.7  |
|               |          |           | 3      | 同上                       | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.4   |
| M46<br>-2     |          | 1         | 同上     | 同上                       | 適                | 適                | 適                     | 98.9   |        |
|               |          | 2         | 同上     | 同上                       | 適                | 適                | 適                     | 100.0  |        |
|               |          | 3         | 同上     | 同上                       | 適                | 適                | 適                     | 100.5  |        |
| M46<br>-3     |          | 1         | 同上     | 同上                       | 適                | 適                | 適                     | 100.2  |        |
|               |          | 2         | 同上     | 同上                       | 適                | 適                | 適                     | 100.2  |        |
|               |          | 3         | 同上     | 同上                       | 適                | 適                | 適                     | 99.4   |        |

|              | 保存<br>期間 | ロット       | 回<br>数 | 性<br>状                  | 確<br>認<br>試<br>験 | 純<br>度<br>試<br>験 | 製<br>剤<br>均<br>一<br>性 | 溶<br>出 | 定<br>量 |
|--------------|----------|-----------|--------|-------------------------|------------------|------------------|-----------------------|--------|--------|
| 加速試験<br>バラ包装 | 製造時      | M46<br>-1 | 1      | 白色の割線<br>入りフィルム<br>コート錠 | (1)適<br>(2)適     | 適                | 適                     | 適      | 99.5   |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.5   |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 100.7  |
|              |          | M46<br>-2 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.1   |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 100.0  |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.1   |
|              |          | M46<br>-3 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 100.4  |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.5   |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.3   |
|              | 1ヵ月      | M46<br>-1 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.7  |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.3   |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.1   |
|              |          | M46<br>-2 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.5   |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.5  |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.8   |
|              |          | M46<br>-3 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.0  |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.3  |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.8   |
|              | 3ヵ月      | M46<br>-1 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.1   |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.4  |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.4  |
|              |          | M46<br>-2 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.7  |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.3   |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.5   |
|              |          | M46<br>-3 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.1   |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 100.7  |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                |                       | 適      | 99.3   |
|              | 6ヵ月      | M46<br>-1 | 1      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 100.2  |
|              |          |           | 2      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.7   |
|              |          |           | 3      | 同上                      | 同上               | 適                | 適                     | 適      | 99.1   |
| M46<br>-2    |          | 1         | 同上     | 同上                      | 適                | 適                | 適                     | 98.9   |        |
|              |          | 2         | 同上     | 同上                      | 適                | 適                | 適                     | 100.7  |        |
|              |          | 3         | 同上     | 同上                      | 適                | 適                | 適                     | 100.0  |        |
| M46<br>-3    |          | 1         | 同上     | 同上                      | 適                | 適                | 適                     | 98.9   |        |
|              |          | 2         | 同上     | 同上                      | 適                | 適                | 適                     | 100.3  |        |
|              |          | 3         | 同上     | 同上                      | 適                | 適                | 適                     | 99.4   |        |

## 5. 調整法及び溶解後の安定性

該当資料なし

## 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

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「TSU」の溶出は、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た。

試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

回転数：毎分50回転

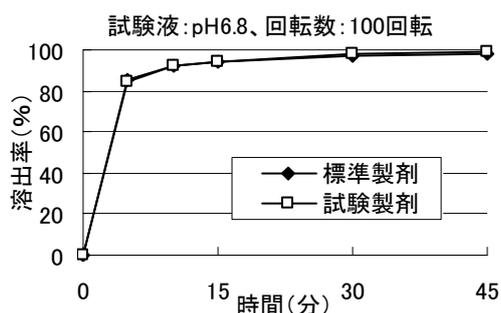
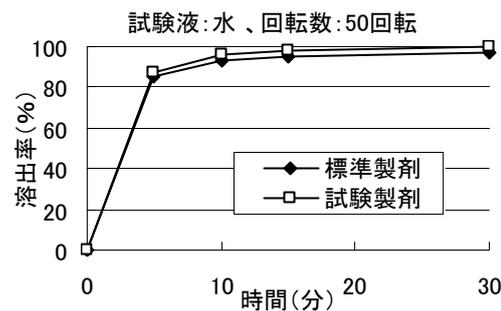
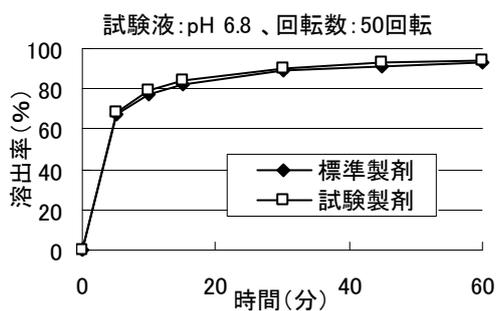
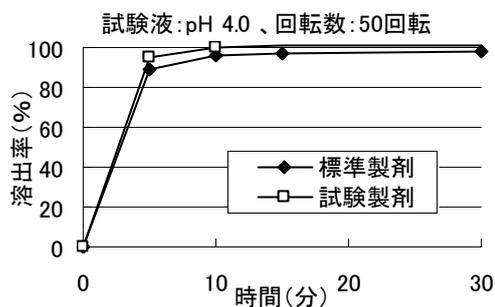
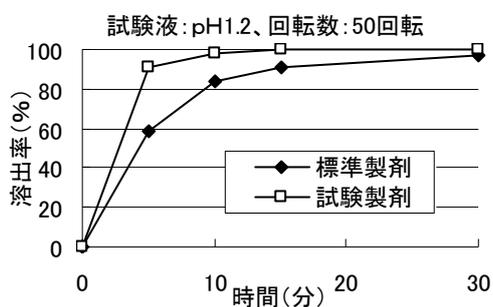
試験液：pH6.8

溶出規格：45分 80%以上

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「TSU」につき、標準製剤（モサプリドクエン酸塩錠 5mg「TSU」）を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

試験結果：

標準製剤を対照としたモサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「TSU」の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「TSU」の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



モサプリドクエン酸塩錠 5m g「TSU」の溶出は、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た。

試験方法：溶出試験法第2法（パドル法）

回転数：毎分50回転

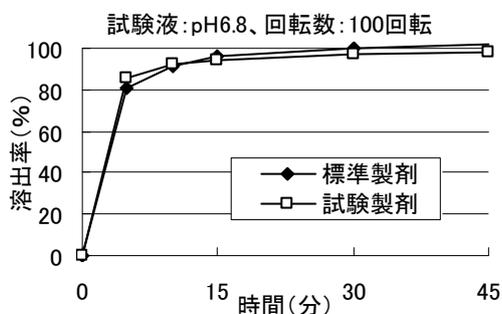
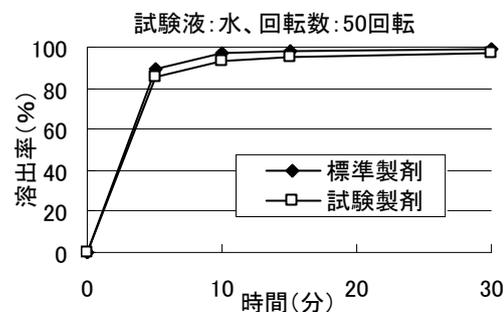
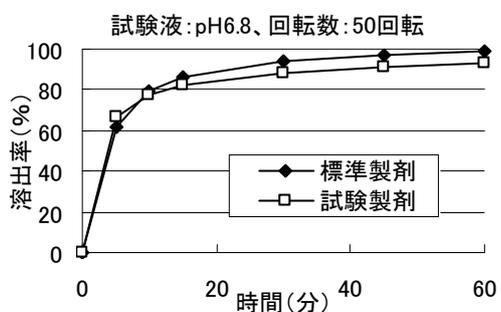
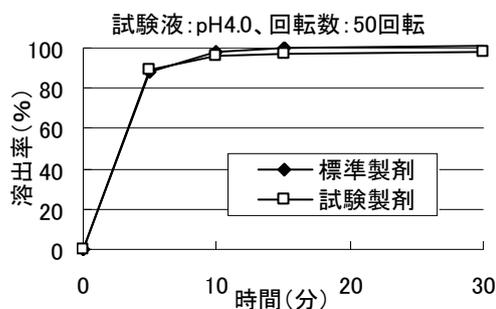
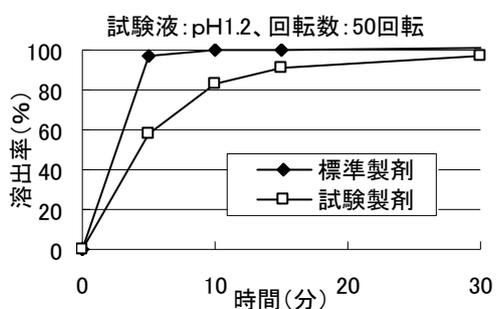
試験液：pH6.8

溶出規格：45分 80%以上

モサプリドクエン酸塩錠 5m g「TSU」につき、標準製剤を対照として、下記に示す4種試験液を用いて溶出試験を実施した。

### 試験結果

標準製剤を対照としたモサプリドクエン酸塩錠 5m g「TSU」の溶出試験結果を下図にそれぞれ示す。モサプリドクエン酸塩錠 5m g「TSU」の溶出パターンは、標準製剤と同等であった。



8. 生物学的試験法

該当資料なし

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」による。

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」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. 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

## 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）

### 2. 用法及び用量

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。

### 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）無作為化平行用量反応試験

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. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

作用部位：消化管

作用機序：モサプリドはセロトニン 5-HT<sub>4</sub> 受容体を選択的に刺激して、アセチルコリンの遊離を増加させることによって消化管運動を亢進し、胃排出促進作用を示す。

#### (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

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「TSU」と標準製剤との生物学的同等性を検討するため、両製剤投与後の血漿中モサプリドクエン酸塩濃度推移を比較した。

#### 使用薬剤

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「TSU」

標準製剤

#### 対象

あらかじめ健康診断を実施し、異常の認められなかった健康成人男子 20 名

#### 投与量

製剤試験により同等と認められた両製剤それぞれ 1 錠 (モサプリドクエン酸塩として 5mg) を絶食時単回経口投与した。

#### 投与方法

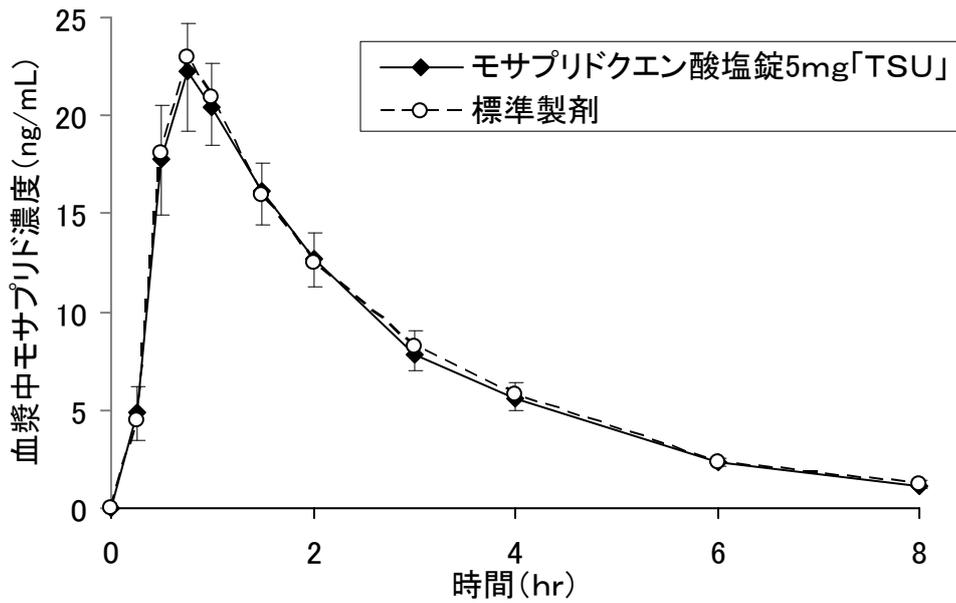
ボランティア 20 名を 2 群に分け、医師の問診ののち、1 群にモサプリドクエン酸塩錠 5mg「TSU」、他群には標準製剤を経口投与した。経時的に採血し血漿中モサプリドクエン酸塩濃度を測定した。その後 1 週間の休薬期間をおいた後、薬剤を代えて投与するクロスオーバー法により試験し血漿中モサプリドクエン酸塩濃度を測定した。

#### 採血時間

投与前、0 時間、0.25 時間、0.5 時間、0.75 時間、1 時間、1.5 時間、2 時間、3 時間、4 時間、6 時間、8 時間目

#### 結果

血漿中モサプリドクエン酸塩濃度は、投与後 0.75 時間目に最高血中濃度に達し、減少した。得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された



平均値±S.E.、n=20

|                       | 判定パラメータ                          |                             | 参考パラメータ                  |                          |
|-----------------------|----------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
|                       | AUC <sub>0-8</sub><br>(ng・hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(ng/mL) | T <sub>max</sub><br>(hr) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」 | 58.71±5.44                       | 27.48±2.81                  | 0.8±0.1                  | 2.1±0.3                  |
| 標準製剤<br>(錠剤、5mg)      | 59.33±4.78                       | 27.35±1.76                  | 0.8±0.1                  | 1.8±0.1                  |

(mean±S.E. n=20)

血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 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. 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ー

### (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

### (6) 分布容積

該当資料なし

### (7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 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) 乳汁中への移行性

該当資料なし

### (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

### (2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

該当資料なし

### (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

(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

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

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 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

- 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。

### 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<br>アトロピン<br>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)、 $\gamma$ -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

|       | 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、口内のしびれ感（舌、口唇等を含む）            |
| 肝 臓   | ALT(GPT)の上昇、AST(GOT)の上昇、ALPの上昇、 $\gamma$ -GTPの上昇、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  |

## (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

該当資料なし

## 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ので、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（たとえば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

- 1) 製剤：該当しない
- 2) 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（安定性試験に基づく）

### 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

（「規制区分」及び「貯法・保存条件」の項を参照のこと）

#### （2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 14.適用上の注意」の項を参照のこと）

### 5. 承認条件等

なし

### 6. 包装

2.5mg錠（PTP）100錠

5mg錠（PTP）100錠、1000錠

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ガスモチン錠5mg、ガスモチン錠2.5mg、ガスモチン散1%

同効薬：メトクロプラミド、ドンペリドン、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

| 製品名                   | 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「TSU」 | 2012年8月15日 | 22400AMX01153000 |
| モサプリドクエン酸塩錠5mg「TSU」   | 2012年8月15日 | 22400AMX01154000 |

11. 薬価基準収載年月日

| 製品名                     | 薬価基準収載年月日   |
|-------------------------|-------------|
| モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「TSU」 | 2012年12月14日 |
| モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」   | 2012年12月14日 |

12. 効能・効果追加, 用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

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. 投与期間制限医薬品に関する情報

長期投与に上限が設けられている医薬品に該当しない

16. 各種コード

| 製品名                     | HOT (9桁)<br>番号 | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | レセプト電算<br>コード |
|-------------------------|----------------|-----------------------|---------------|
| モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「TSU」 | 122173201      | 2399010F1133          | 622217301     |
| モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「TSU」   | 122174901      | 2399010F2130          | 622217401     |

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

### 2. その他の参考文献

第 1 6 改正 日本薬局方

## **X II . 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

該当しない

## **X III . 備 考**

### 1. その他の関連資料

なし



製造販売元

**鶴原製薬株式会社**

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号

文献請求先：鶴原製薬（株）医薬情報部