

## 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（一部2018に準拠）

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「VTRS」  
モサプリドクエン酸塩錠5mg「VTRS」  
MOSAPRIDE Citrate Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「VTRS」 1錠中 日局 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「VTRS」 1錠中 日局 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：2022年 6月 1日 発売年月日：2012年12月14日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社 販売元：ヴィアトリス製薬合同会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬合同会社 メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル 0120-419-043 <a href="https://www.viatrix-e-channel.com/">https://www.viatrix-e-channel.com/</a>

本IFは2024年7月改訂の電子化された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 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな IF 記載要領が策定された。

### 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

#### 【IF の様式】

- ①規格は A4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤字・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

#### 【IF の作成】

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

- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2008」は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師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

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>
1. 開発の経緯 .....	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>
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
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>
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
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>
1. 剤形 .....	5
2. 製剤の組成 .....	5
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 .....	10
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	10
7. 溶出性 .....	11
8. 生物学的試験法 .....	14
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	14
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	14
11. 力価 .....	14
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	15
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 .....	15
14. その他 .....	15

<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>16</b>
1. 効能又は効果 .....	16
2. 効能又は効果に関連する注意 .....	16
3. 用法及び用量 .....	16
4. 用法及び用量に関連する注意 .....	16
5. 臨床成績 .....	17
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>19</b>
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 .....	19
2. 薬理作用 .....	19
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>20</b>
1. 血中濃度の推移・測定法 .....	20
2. 薬物速度論的パラメータ .....	21
3. 吸収 .....	22
4. 分布 .....	22
5. 代謝 .....	22
6. 排泄 .....	23
7. 透析等による除去率 .....	23
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>24</b>
1. 警告内容とその理由 .....	24
2. 禁忌内容とその理由 .....	24
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 .....	24
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 .....	24
5. 重要な基本的注意とその理由 .....	24
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 .....	24
7. 相互作用 .....	25
8. 副作用 .....	26
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	26
10. 過量投与 .....	26
11. 適応上の注意 .....	27
12. その他の注意 .....	27
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>28</b>
1. 薬理試験 .....	28
2. 毒性試験 .....	28

<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>29</b>
1. 規制区分 .....	29
2. 有効期間又は使用期限 .....	29
3. 貯法・保存条件 .....	29
4. 薬剤取扱い上の注意点 .....	29
5. 承認条件等 .....	29
6. 包装 .....	29
7. 容器の材質 .....	29
8. 同一成分・同効薬 .....	30
9. 国際誕生年月日 .....	30
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 .....	30
11. 薬価基準収載年月日 .....	30
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.....	30
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	30
14. 再審査期間 .....	30
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 .....	30
16. 各種コード .....	31
17. 保険給付上の注意 .....	31
<b>XI. 文献</b> .....	<b>32</b>
1. 引用文献 .....	32
2. その他の参考文献 .....	32
<b>XII. 参考資料</b> .....	<b>33</b>
1. 主な外国での発売状況 .....	33
2. 海外における臨床支援情報 .....	33
<b>XIII. 備考</b> .....	<b>34</b>
その他の関連資料 .....	34

---

## 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、胃腸機能調整を目的に開発された世界初の選択的セロトニン 5-HT<sub>4</sub> 受容体作用薬である。消化管壁内神経叢に存在するセロトニン 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消化管運動促進作用及び胃排出促進作用を示すと考えられる<sup>1)~3)</sup>。

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg・5mg「ファイザー」は、ファイザー株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく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 月に「慢性胃炎に伴う消化器症状（胸やけ、悪心・嘔吐）」の効能又は効果で承認を得た製剤である。更に、2021 年 1 月に「経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸 X 線造影検査前処置の補助」の効能又は効果が追加承認された。

2022 年 6 月、ファイザー株式会社からマイラン EPD 合同会社（現、ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社）へ製造販売移管したため、販売名をモサプリドクエン酸塩錠 2.5mg・5mg「V T R S」に変更した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

#### 1. 選択的にセロトニン 5-HT<sub>4</sub> 受容体に作用する消化管運動機能改善剤

1) モサプリドクエン酸塩水和物は、消化管運動機能を賦活するセロトニン 5-HT<sub>4</sub> 受容体を選択的に刺激することで、アセチルコリン遊離の増大を介して胃腸運動を活発にし<sup>1)~3)</sup>、慢性胃炎に伴う消化器症状を改善する。

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に使用される。

（「VI-2. (1)作用部位・作用機序」、「V-1. 効能又は効果」の項参照）

#### 2. 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み

包装（小函、PTP シート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント\*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている<sup>4)~6)</sup>。

3. モサプリドクエン酸塩水和物の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. 副作用」の項参照）

\*「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

## 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 「V T R S」

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」

#### (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、含量及び「V T R S」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）

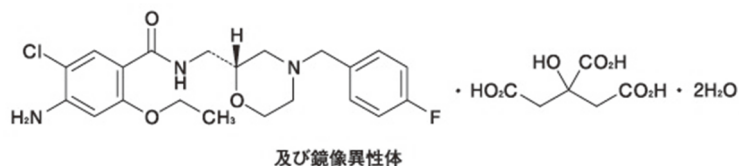
Mosapride Citrate Hydrate（JAN）

Mosapride（INN）

#### (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- { [ (2RS) -4- (4-fluorobenzyl) morpholin-2-yl] methyl} benzamide monocitrate dihydrate (IUPAC)



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 (Mosapride Citrate Hydrate)

112885-42-4 (Mosapride Citrate)

112885-41-3 (Mosapride)

---

### 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<sup>7)</sup>

日本薬局方「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<sup>7)</sup>

日本薬局方「モサプリドクエン酸塩水和物」定量法による。

## 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	モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「VTRS」			モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」		
剤形	白色 フィルムコーティング錠			白色 割線入り フィルムコーティング錠		
外形						
大きさ	直径	厚さ	重量	長径 短径	厚さ	重量
	6.1mm	2.6mm	82.5mg	9.1mm 4.6mm	3.2mm	113mg

#### (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 「VTRS」： 上面 2.5 MO、下面 VLE

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」： 上面 VTRS、下面 5 MO

#### (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

販売名	モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「VTRS」	モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」
有効成分	1錠中 日局 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 日局 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、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、タルク、酸化チタン、マクロゴール 6000、カルナウバロウ	

#### (2) 添加物

「IV-2. (1) 有効成分（活性成分）の含量」の項を参照

#### (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<sup>8)</sup>、<sup>9)</sup>

試験条件：40±1°C、75±5%RH

① モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「VTR S」

包装形態：PTP包装（アルミピロー、紙箱）

項及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
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	ドラーゲンドルフ試液による定性反応	適合	適合 <sup>#</sup>	適合 <sup>#</sup>	適合
	紫外可視吸光度測定法				
製剤均一性試験*		適合	適合 <sup>##</sup>	適合 <sup>##</sup>	適合
溶出試験** (45分間の溶出率は80%以上)		88.5 ~97.0	—	—	86.5 ~96.6
定量試験（95.0~105.0%）		100.4 ~102.2	99.2 ~102.4	101.1 ~102.9	99.5 ~102.5
純度試験		適合	適合	適合	適合

各試験は、各ロットn=3、ただし確認試験の1ヵ月後及び3ヵ月後は#：n=1

\*：製剤均一性試験は、各ロットn=10×3、ただし1ヵ月後及び3ヵ月後は##：n=10×1

\*\*：溶出試験は、各ロットn=6×3

加速試験（40°C、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「VTR S」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

② モサプリドクエン酸塩錠 5mg「VTR S」

包装形態：PTP包装（アルミピロー、乾燥剤入り、紙箱）

項及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
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	ドラーゲンドルフ試液による定性反応	適合	適合 <sup>#</sup>	適合 <sup>#</sup>	適合
	紫外可視吸光度測定法				
製剤均一性試験*		適合	適合 <sup>##</sup>	適合 <sup>##</sup>	適合
溶出試験** (45分間の溶出率は80%以上)		85.1 ~93.9	—	—	81.7 ~90.0
定量試験（95.0~105.0%）		98.6 ~102.4	100.4 ~102.5	99.5 ~102.7	99.7 ~101.6
純度試験		適合	適合	適合	適合

各試験は、各ロットn=3、ただし確認試験の1ヵ月後及び3ヵ月後は#：n=1

\*：製剤均一性試験は、各ロットn=10×3、ただし1ヵ月後及び3ヵ月後は##：n=10×1

\*\*：溶出試験は、各ロットn=6×3

包装形態：ポリエチレン製容器包装（密栓、紙箱）

項及び規格		試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
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	ドラーゲンドルフ試液による定性反応	適合	適合 <sup>#</sup>	適合 <sup>#</sup>	適合
	紫外可視吸光度測定法				
製剤均一性試験*		適合	適合 <sup>##</sup>	適合 <sup>##</sup>	適合
溶出試験** （45分間の溶出率は80%以上）		86.7 ～91.8	—	—	82.1 ～89.8
定量試験（95.0～105.0%）		98.6 ～102.4	99.1 ～101.7	100.0 ～101.6	99.5 ～102.4
純度試験		適合	適合	適合	適合

各試験は、各ロットn=3、ただし確認試験の1ヵ月後及び3ヵ月後は#：n=1

\*：製剤均一性試験は、各ロットn=10×3、ただし1ヵ月後及び3ヵ月後は##：n=10×1

\*\*：溶出試験は、各ロットn=6×3

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、モサプリドクエン酸塩錠5mg「VTR S」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

(2) 長期保存試験<sup>10)、11)</sup>

試験条件：25±2℃、60±5%RH

① モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「VTR S」

包装形態：PTP包装（アルミピロー、紙箱）

項及び規格		試験開始時	6ヵ月後	12ヵ月後	15ヵ月後	24ヵ月後	36ヵ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠） <sup>a</sup>		適合	適合	適合	—	適合	適合
確認試験	ドラーゲンドルフ試液による定性反応	適合	適合 <sup>#</sup>	適合 <sup>#</sup>	—	適合 <sup>#</sup>	適合
	紫外可視吸光度測定法						
製剤均一性試験*		適合	適合 <sup>##</sup>	適合 <sup>##</sup>	—	適合 <sup>##</sup>	適合
溶出試験** （45分間の溶出率は80%以上 <sup>a</sup> ）		84.9 ～94.1	87.9 ～94.7 <sup>###</sup>	93.2 ～100.5 <sup>###</sup>	88.5 ～97.0	89.8 ～94.8 <sup>###</sup>	88.9 ～102.0
定量試験 （95.0～105.0%）		100.4 ～102.2	100.2 ～101.5	101.6 ～102.7	—	99.7 ～103.3	99.3 ～102.5
純度試験		適合	適合	適合	—	適合	適合
硬度*** （参考）規格設定なし		68.5 ～86.5	70.0 ～88.5	70.0 ～90.0	—	74.0 ～89.0	75.0 ～95.0

各試験は、各ロットn=3、ただし確認試験の6ヵ月、12ヵ月後及び24ヵ月後は#：n=1

\*：製剤均一性試験は、各ロットn=10×3、ただし6ヵ月、12ヵ月後及び24ヵ月後は##：n=10×1

\*\*：溶出試験は、各ロットn=6×3、ただし6ヵ月、12ヵ月後及び24ヵ月後は###：n=6×1

\*\*\*：硬度は、n=10×1

a：試験開始時～12ヵ月後は開始時、15～36ヵ月後は承認時の規格及び試験方法

② モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」

包装形態：PTP 包装（アルミピロー、乾燥剤入り、紙箱）

項及び規格		試験開始時	6 ヶ月後	12 ヶ月後	15 ヶ月後	24 ヶ月後	36 ヶ月後
性状（白色の割線入りフィルムコーティング錠） <sup>a</sup>		適合	適合	適合	—	適合	適合
確認試験	ドラーゲンドルフ試液による定性反応	適合	適合 <sup>#</sup>	適合 <sup>#</sup>	—	適合 <sup>#</sup>	適合
	紫外可視吸光度測定法						
製剤均一性試験*		適合	適合 <sup>#</sup>	適合 <sup>#</sup>	—	適合 <sup>#</sup>	適合
溶出試験** （45 分間の溶出率は 80% 以上 <sup>a</sup> ）		82.1 ～90.0	87.3 ～91.8 <sup>###</sup>	91.5 ～98.5 <sup>###</sup>	85.1 ～93.9	87.2 ～91.5 <sup>###</sup>	86.8 ～94.7
定量試験 （95.0～105.0%）		98.6 ～102.4	99.5 ～102.3	98.7 ～102.2	—	98.2 ～101.5	99.9 ～101.3
純度試験		適合	適合	適合	—	適合	適合
硬度*** （参考）規格設定なし		76.0 ～110.0	76.0 ～99.5	70.5 ～101.5	—	85.0 ～99.0	81.0 ～101.5

各試験は、各ロット n=3、ただし確認試験の 6 ヶ月、12 ヶ月後及び 24 ヶ月後は # : n=1

\* : 製剤均一性試験は、各ロット n=10×3、ただし 6 ヶ月、12 ヶ月後及び 24 ヶ月後は ## : n=10×1

\*\* : 溶出試験は、各ロット n=6×3、ただし 6 ヶ月、12 ヶ月後及び 24 ヶ月後は ### : n=6×1

\*\*\* : 硬度は、n=10×1

a : 試験開始時～12 ヶ月後は開始時、15～36 ヶ月後は承認時の規格及び試験方法

包装形態：ポリエチレン製容器包装（装栓、紙箱）

項及び規格		試験開始時	6 ヶ月後	12 ヶ月後	15 ヶ月後	24 ヶ月後	36 ヶ月後
性状（白色の割線入りフィルムコーティング錠） <sup>a</sup>		適合	適合	適合	—	適合	適合
確認試験	ドラーゲンドルフ試液による定性反応	適合	適合 <sup>#</sup>	適合 <sup>#</sup>	—	適合 <sup>#</sup>	適合
	紫外可視吸光度測定法						
製剤均一性試験*		適合	適合 <sup>#</sup>	適合 <sup>#</sup>	—	適合 <sup>#</sup>	適合
溶出試験** （45 分間の溶出率は 80% 以上 <sup>a</sup> ）		82.1 ～90.0	88.1 ～93.9 <sup>###</sup>	89.3 ～99.0 <sup>###</sup>	86.7 ～91.8	86.4 ～92.5 <sup>###</sup>	84.0 ～94.3
定量試験 （95.0～105.0%）		98.6 ～102.4	99.6 ～102.9	99.1 ～103.0	—	98.6 ～101.4	100.0 ～101.8
純度試験		適合	適合	適合	—	適合	適合
硬度*** （参考）規格設定なし		76.0 ～110.0	77.5 ～94.5	68.5 ～103.0	—	69.0 ～86.5	70.0 ～98.0

各試験は、各ロット n=3、ただし確認試験の 6 ヶ月、12 ヶ月後及び 24 ヶ月後は # : n=1

\* : 製剤均一性試験は、各ロット n=10×3、ただし 6 ヶ月、12 ヶ月後及び 24 ヶ月後は ## : n=10×1

\*\* : 溶出試験は、各ロット n=6×3、ただし 6 ヶ月、12 ヶ月後及び 24 ヶ月後は ### : n=6×1

\*\*\* : 硬度は、n=10×1

a : 試験開始時～12 ヶ月後は開始時、15～36 ヶ月後は承認時の規格及び試験方法

(3) 無包装状態での安定性<sup>12)</sup>

試験条件：①温度：50℃（±2℃）（褐色ガラス瓶・開栓）

②湿度：30℃（±2℃）、75%RH（±5%）（褐色ガラス瓶・開栓）

③光：蛍光灯下（約1000Lx照射、シャーレ開放）

測定時期：①、②開始時、1、2、3ヵ月後

③開始時、総照度60万Lx・hr時点、120万Lx・hr時点

試験項目：性状、含量、溶出性

試験回数：性状3回、含量3回、溶出性1回（6ベッセル）

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「VTRS」

①温度に対する安定性試験 [50℃（±2℃）]

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	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
含量 (%) [対開始時 (%) ]	99.7 [100.0]	99.9 [100.2]	100.6 [100.9]	100.0 [100.3]
溶出性 (%) [最小値-最大値 (%) ]	93.3 [91.8-94.6]	93.9 [92.5-95.2]	90.9 [88.9-92.2]	91.2 [89.6-94.1]

②湿度に対する安定性試験 [30℃（±2℃）、75%RH（±5%）]

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	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
含量 (%) [対開始時 (%) ]	99.7 [100.0]	101.0 [101.3]	101.0 [101.3]	100.6 [100.9]
溶出性 (%) [最小値-最大値 (%) ]	93.3 [91.8-94.6]	90.1 [89.5-90.8]	86.0 [84.4-88.4]	87.1 [85.6-89.0]

③通常の環境下 [温度・湿度成り行き、室内散乱光]

測定項目	測定時期		
	開始時	60万Lx・hr	120万Lx・hr
性状	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
含量 (%) [対開始時 (%) ]	99.7 [100.0]	100.3 [100.6]	101.0 [101.3]
溶出性 (%) [最小値-最大値 (%) ]	93.3 [91.8-94.6]	93.5 [91.9-95.7]	92.2 [90.4-93.7]

※含量は平均値で記載

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」

①温度に対する安定性試験 [50°C (±2°C)]

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	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
含量 (%) [対開始時 (%) ]	100.3 [100.0]	100.4 [100.1]	100.7 [100.4]	100.8 [100.5]
溶出性 (%) [最小値-最大値(%)]	88.2 [86.5-89.9]	90.0 [89.5-90.9]	88.9 [88.4-89.1]	88.4 [86.7-90.2]

②湿度に対する安定性試験 [30°C (±2°C)、75%RH (±5%)]

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状	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
含量 (%) [対開始時 (%) ]	100.3 [100.0]	101.1 [100.8]	101.2 [100.9]	100.7 [100.4]
溶出性 (%) [最小値-最大値(%)]	88.2 [86.5-89.9]	83.5 [82.3-84.7]	81.0 [80.2-82.2]	81.5 [79.8-83.3]

③通常の環境下 [温度・湿度成り行き、室内散乱光]

測定項目	測定時期		
	開始時	60万Lx・hr	120万Lx・hr
性状	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
含量 (%) [対開始時 (%) ]	100.3 [100.0]	100.7 [100.4]	100.6 [100.3]
溶出性 (%) [最小値-最大値(%)]	88.2 [86.5-89.9]	86.0 [85.0-87.8]	84.5 [82.8-86.5]

※含量は平均値で記載

注) 本剤の無包装状態での保存は弊社としては推奨していない。

## 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)

該当しない



## 7. 溶出性

溶出挙動<sup>13)、14)</sup>

### ① モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「VTRS」

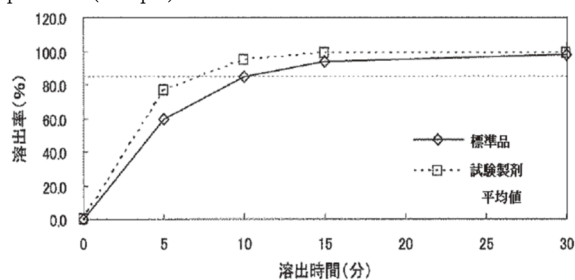
「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成12年2月14日 医薬審第64号、平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号）に基づき、モサプリドクエン酸塩錠5mg「VTRS」を標準品としてモサプリドクエン酸塩錠2.5mg「VTRS」の溶出試験を実施した結果、いずれの試験液においても溶出挙動の同等性が示され、両製剤は生物学的に同等とみなされた。

試験条件

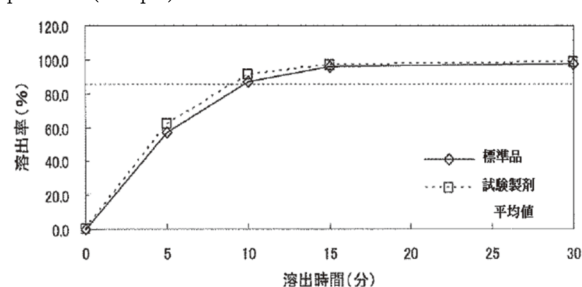
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液)	900mL	50rpm
	pH3.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液)		
	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)		
	水		
	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)	900mL	100rpm

n=12

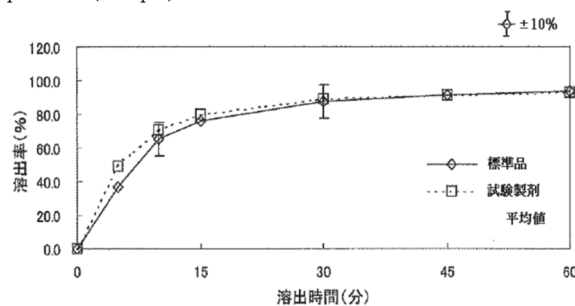
pH1.2 (50rpm)



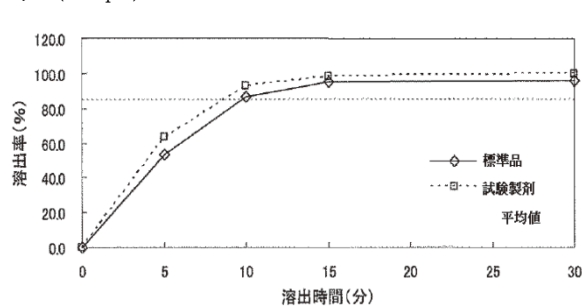
pH3.0 (50rpm)



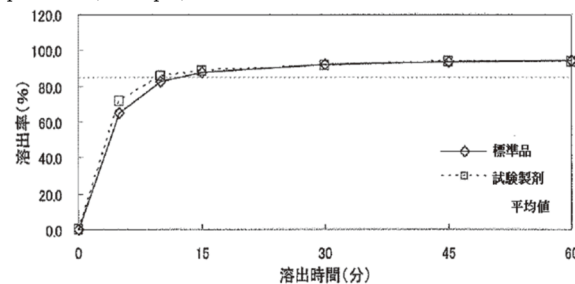
pH6.8 (50rpm)



水 (50rpm)



pH6.8 (100rpm)



試験条件	薬剤	溶出率 (%)					
		5分	10分	15分	30分	45分	60分
pH1.2 50rpm	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg 「VTRS」	77.0 ±10.22	94.5 ±4.09	98.5 ±1.37	98.7 ±0.72	—	—
	標準品	59.2 ±5.70	84.9 ±4.21	94.0 ±3.28	97.8 ±1.11	—	—
pH3.0 50rpm	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg 「VTRS」	62.1 ±11.37	90.8 ±5.68	96.4 ±3.07	97.9 ±1.95	—	—
	標準品	57.3 ±9.55	87.0 ±5.84	95.8 ±2.00	97.8 ±1.04	—	—
pH6.8 50rpm	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg 「VTRS」	49.4 ±5.78	71.0 ±4.12	79.7 ±2.55	89.2 ±1.16	91.7 ±1.13	93.0 ±0.69
	標準品	37.2 ±4.33	65.5 ±2.92	76.0 ±1.62	87.9 ±1.11	91.5 ±1.28	93.6 ±0.91
水 50rpm	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg 「VTRS」	63.1 ±6.99	93.0 ±3.15	98.2 ±2.48	99.7 ±2.61	—	—
	標準品	53.8 ±5.38	86.7 ±3.11	95.3 ±1.80	96.1 ±2.49	—	—
pH6.8 100rpm	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg 「VTRS」	71.6 ±3.30	85.3 ±1.72	88.9 ±1.42	91.8 ±1.42	93.6 ±0.96	93.5 ±1.16
	標準品	65.3 ±7.76	82.7 ±2.48	87.5 ±1.25	92.4 ±1.57	93.9 ±1.60	94.7 ±1.67

平均値±標準偏差、n=12

#### 公的溶出試験

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「VTRS」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	判定時点	溶出率 (%)		
		ロットA	ロットB	ロットC
pH6.8 溶出試験第2液	45分	91.6~95.0	88.5~95.1	92.9~97.0
判定		適合	適合	適合

各ロット n=6×3

② モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」

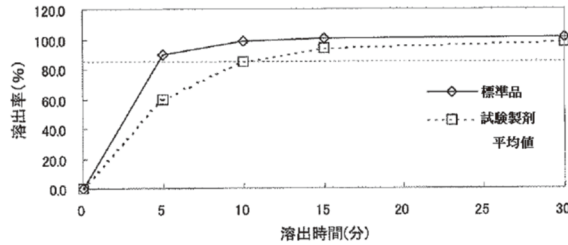
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」と標準品の溶出試験を実施した結果、モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

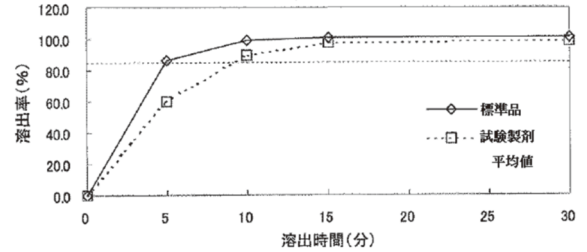
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液)	900mL	50rpm
	pH5.0 (薄めた McIlvaine 緩衝液)		
	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)		
	水		
	pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液)	900mL	100rpm

n=12

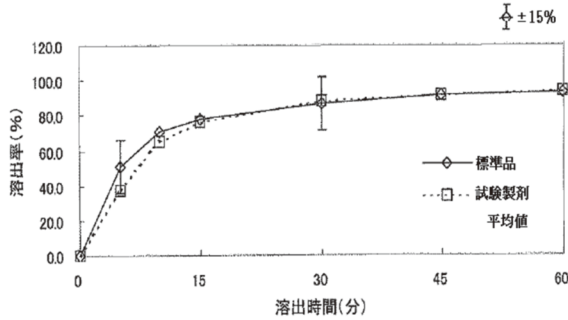
pH1.2 (50rpm)



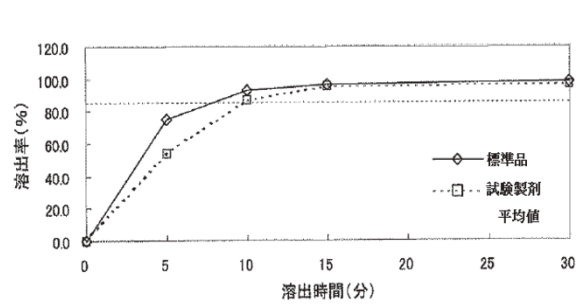
pH5.0 (50rpm)



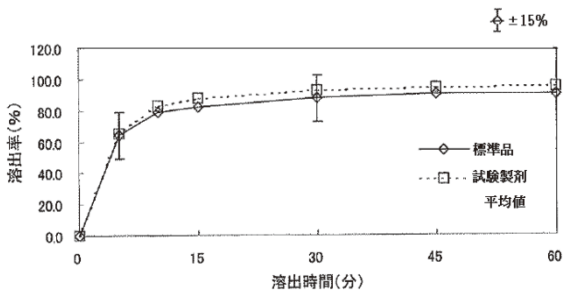
pH6.8 (50rpm)



水 (50rpm)



pH6.8 (100rpm)



試験条件	薬剤	溶出率 (%)					
		5分	10分	15分	30分	45分	60分
pH1.2 50rpm	モサプリドクエン酸塩錠5mg 「VTRS」	59.2 ±5.70	84.9 ±4.21	94.0 ±3.28	97.8 ±1.11	—	—
	標準品	89.7 ±8.48	98.7 ±2.38	100.2 ±1.05	100.9 ±0.83	—	—
pH5.0 50rpm	モサプリドクエン酸塩錠5mg 「VTRS」	60.2 ±11.02	89.9 ±4.29	97.7 ±1.04	98.5 ±0.88	—	—
	標準品	86.4 ±6.43	99.5 ±2.15	100.5 ±1.36	100.7 ±1.03	—	—
pH6.8 50rpm	モサプリドクエン酸塩錠5mg 「VTRS」	37.2 ±4.33	65.5 ±2.92	76.0 ±1.62	87.9 ±1.11	91.5 ±1.28	93.6 ±0.91
	標準品	51.0 ±4.92	70.4 ±3.50	77.7 ±3.28	86.7 ±2.37	91.0 ±2.12	92.9 ±2.18
水 50rpm	モサプリドクエン酸塩錠5mg 「VTRS」	53.8 ±5.38	86.7 ±3.11	95.3 ±1.80	96.1 ±2.49	—	—
	標準品	74.8 ±9.19	93.3 ±4.40	96.7 ±2.90	97.8 ±2.61	—	—
pH6.8 100rpm	モサプリドクエン酸塩錠5mg 「VTRS」	65.3 ±7.76	82.7 ±2.48	87.5 ±1.25	92.4 ±1.57	93.9 ±1.60	94.7 ±1.67
	標準品	64.1 ±1.62	78.7 ±1.72	81.9 ±1.53	87.5 ±1.47	90.0 ±1.89	90.4 ±1.58

平均値±標準偏差、n=12

#### 公的溶出試験

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「VTRS」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<sup>15)</sup>

日本薬局方 医薬品各条「モサプリドクエン酸塩錠」確認試験法による。

- (1) ドラーゲンドルフ試液による定性反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法

#### 10. 製剤中の有効成分の定量法<sup>15)</sup>

日本薬局方 医薬品各条「モサプリドクエン酸塩錠」定量法による。

紫外可視吸光度測定法

#### 11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

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

#### 4. 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。

[17.1.2 参照]

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

#### 6. 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。

#### (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

該当資料なし

#### 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

該当資料なし

### (7) その他

〈慢性胃炎に伴う消化器症状（胸やけ、悪心・嘔吐）〉

#### 国内臨床試験

二重盲検比較試験を含む総計 111 例についての臨床成績は次のとおりである<sup>16)</sup>。

対象疾患／症状		改善率
慢性胃炎	胸やけ	68.5% (37/54)
	悪心・嘔吐	71.2% (37/52)

〈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〉

#### 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、本剤と経口腸管洗浄剤（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。（「V-2. 効能又は効果に関連する注意」の項参照）

群	ブラウン変法群	本剤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（本剤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>17)</sup>。



---

## VI. 薬効薬理に関する項目

---

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

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

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、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

本剤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>1)~3)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 上部消化管運動促進作用

###### 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>1)</sup>（イヌ）。

###### ② 胃排出促進作用

a) 健康成人<sup>18)</sup>及び慢性胃炎患者<sup>19)</sup>を対象とした胃排出試験において、本剤 5mg1 回投与で胃排出促進作用を示す。

b) 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>2)、20)</sup>（ラット）。

##### 2) 下部消化管運動促進作用

###### 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>3)、21)</sup>（モルモット）。

###### 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>21)</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・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<sup>22)</sup>

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」 : 0.8±0.6 (hr)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 1) 単独投与時

(健康成人 5 例、空腹時本剤 5mg 1 回経口投与)<sup>23)</sup>

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

平均値±標準偏差

##### 2) 経口腸管洗浄剤併用時

(健康成人、空腹時本剤 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 時間後本剤 20mg (2 回目) 経口投与)<sup>24)</sup>

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

平均値±標準偏差

### 3) 生物学的同等性試験

#### ① モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「VTRS」<sup>13)</sup>

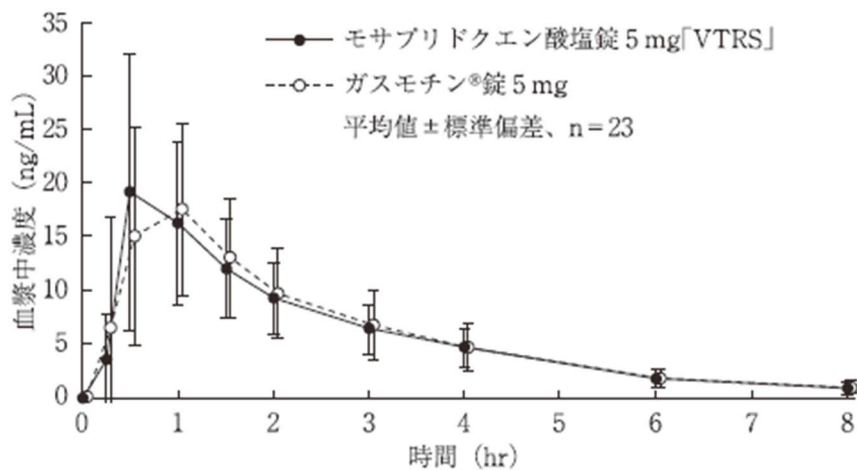
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「VTRS」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン (平成 12 年 2 月 14 日医薬審第 64 号、平成 18 年 11 月 24 日一部改正)」に基づき、モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」を標準製剤としたとき、溶出挙動に基づき生物学的に同等とみなされた。

#### ② モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」<sup>22)</sup>

健康成人男子にモサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」とガスモチン®錠のそれぞれ 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て血漿中モサプリドクエン酸塩濃度を測定し、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 (クロスオーバー法)。

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC <sub>0-8</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	AUC <sub>∞</sub> (ng·hr/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	MRT (hr)	Kel (/hr)
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTRS」	1錠 (5mg)	47.5 ±17.6	22.5 ±9.9	50.5 ±18.9	0.8 ±0.6	1.88 ±0.27	2.41 ±0.34	0.377 ±0.055
ガスモチン®錠 5mg	1錠 (5mg)	48.5 ±18.1	21.7 ±9.4	51.5 ±19.5	0.9 ±0.3	1.85 ±0.26	2.38 ±0.29	0.380 ±0.052

平均値±標準偏差、n=23



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

1) 食事の影響

該当資料なし

2) 併用薬の影響

エリスロマイシンとの相互作用

本剤 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、 $AUC_{0\sim4}$  は 62ng・hr/mL から 114ng・hr/mL に増加した<sup>25)</sup> (健康成人)。

(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<sup>22)</sup>

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」 : 0.377±0.055 (/hr)

(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

99.0% (*in vitro*、ヒト血清、1 μg/mL、限外ろ過法又は平衡透析法)<sup>26)</sup>

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

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

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>23)、27)</sup>。

主な代謝産物

4-フルオロベンジル基脱離体<sup>23)</sup>

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種  
主として CYP3A4<sup>28)</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  
尿中、糞便中

(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>23)</sup> (健康成人、空腹時本剤 5mg 1 回投与)。

(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

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」の項を参照すること。

### 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」の項を参照すること。

### 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]

### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### (1) 合併症・既往症等のある患者

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

### 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]

#### (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」参照

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

### 2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

---

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 1. 規制区分

製 剤：モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「V T R S」 該当しない  
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」 該当しない

有効成分：日局 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

有効期間：3年

「IV-4. 製剤の各種条件下における安定性」及び「X-4. 薬剤取扱い上の注意点」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

#### 20. 取扱い上の注意

開封後は湿気を避けて保存すること。

「VIII-11. 適用上の注意」の項を参照

くすりのしおり：有り、患者向医薬品ガイド：有り

### 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 「V T R S」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

〈モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10、乾燥剤入り]、500錠 [10錠 (PTP) ×50、乾燥剤入り]

500錠 [バラ]

### 7. 容器の材質

PTPシート：塩化ビニル、アルミ

ボトル（バラ）：ボトルーポリエチレン、キャップーポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ガスモチン錠 2.5mg・5mg、ガスモチン散 1%（住友ファーマ株式会社）

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

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「VTR S」：22400AMX01143

モサプリドクエン酸塩錠 5mg「VTR S」：22400AMX01144

11. 薬価基準収載年月日

2022年6月1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

効能又は効果追加	用法及び用量追加	追加年月日
○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	<p>〈慢性胃炎に伴う消化器症状（胸やけ、悪心・嘔吐）〉</p> <p>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。</p> <p>〈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〉</p> <p>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。</p>	2021年1月20日

（下線部が追加箇所）

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、厚生労働省告示第 107 号（平成 18 年 3 月 6 日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準収 載医薬品コード	レセプト電算処理 システムコード
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「VTR S」	122062903	統一名：2399010F1010 個別：2399010F1303	統一名：622895600 個別：622206203
モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「VTR S」	122063603	統一名：2399010F2016 個別：2399010F2300	統一名：622895700 個別：622206303

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) Yoshida N., et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther. 1991 ; 257 : 781-787
- 2) 薬理試験 (ガスモチン®錠 : 2009年4月22日承認、CTD 2.6.2)
- 3) Inui A., et al. : Jpn. J. Pharmacol. 2002 ; 90 : 313-320
- 4) 中野 泰志ほか : 「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (1) - 明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較 -」 : 第35回感覚代行シンポジウム講演論文集 : 2009 : 25
- 5) 新井 哲也ほか : 「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (2) - 低視力状態での可視性の比較 -」 : 第35回感覚代行シンポジウム講演論文集 : 2009 ; 29
- 6) 山本 亮ほか : 「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (3) - 低コントラスト状態での可視性の比較 -」 : 第35回感覚代行シンポジウム講演論文集 : 2009 ; 33
- 7) 日本薬局方解説書編集委員会編 : “モサプリドクエン酸塩水和物” 第十八改正 日本薬局方解説書 廣川書店 : 2021 ; C-5832-5836
- 8) 社内資料 : 安定性試験 (加速試験) (モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「V T R S」)
- 9) 社内資料 : 安定性試験 (加速試験) (モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」)
- 10) 社内資料 : 安定性試験 (長期保存試験) (モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「V T R S」)
- 11) 社内資料 : 安定性試験 (長期保存試験) (モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」)
- 12) 社内資料 : 無包装状態の安定性 (モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg・5mg 「V T R S」)
- 13) 社内資料 : 溶出試験 (モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「V T R S」)
- 14) 社内資料 : 溶出試験 (モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」)
- 15) 日本薬局方解説書編集委員会編 : “モサプリドクエン酸塩錠” 第十八改正 日本薬局方解説書 廣川書店 : 2021 ; C-5836-5839
- 16) 三好 秋馬ほか : 臨床医薬. 1998 ; 14 : 1037-1053
- 17) 杉野 吉則ほか : 日本大腸検査学会雑誌. 2008 ; 25 : 99-114
- 18) 金泉 年郁ほか : 日本平滑筋学会雑誌. 1990 ; 26 : 161-174
- 19) 須山 哲次ほか : 内科宝函. 1993 ; 40 : 175-183
- 20) 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
- 21) Mine Y., et al. : J. Pharmacol. Sci. 2009 ; 110 : 415-423
- 22) 社内資料 : 生物学的同等性試験 (モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」)
- 23) Sakashita M., et al. : Arzneim.-Forsch./Drug Res. 1993 ; 43 : 867-872
- 24) 降旗 謙一ほか : 診療と新薬. 2009 ; 46 : 262-271
- 25) 加藤 貴雄ほか : 臨床医薬. 1999 ; 15 : 753-763
- 26) Matsumoto S., et al. : Arzneim.-Forsch./Drug Res. 1993 ; 43 : 1084-1094
- 27) Matsumoto S., et al. : Arzneim.-Forsch./Drug Res. 1993 ; 43 : 1095-1102
- 28) 代謝酵素 (ガスモチン®錠 : 2009年4月22日承認、CTD2.6.4)

### 2. その他の参考文献

- 参考文献 1) 藤島 一郎 監修 : 内服薬経管投与ハンドブック第2版, 東京, じほう. 2006 : 37-43

---

## XII. 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

#### (1) 妊婦に関する海外情報

該当資料なし

#### (2) 小児等に関する海外情報

該当資料なし

## XIII. 備考

### その他の関連資料

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。

(掲載根拠：「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するQ&Aについて(その3)」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課事務連絡)

本剤の粉砕後の安定性並びに簡易懸濁法試験(崩壊懸濁試験および通過性試験)の報告を以下に示す。なお、本剤を粉砕あるいは簡易懸濁しての投与は、承認された剤形での投与ではなく、適正使用の観点から、弊社としては推奨していない。

本剤を粉砕あるいは簡易懸濁しての投与については、各医療担当者の裁量と判断により行うこと。

#### (1) 粉砕

##### 【試験方法】

試料の調整方法：乳鉢により粉砕・均一とする

保存条件：①湿度：30℃(±2℃)、75%RH(±5%) (シャーレ開放)

②光：蛍光灯下(約1000Lx照射) (シャーレ開放)

③通常的环境下：温度・湿度成り行き、室内散乱光(シャーレ開放)

測定時期：開始時、0.5ヵ月、1ヵ月後

試験項目：外観、含量

試験回数：外観1回、含量3回

##### 【試験結果】

モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg 「V T R S」

①湿度に対する安定性試験 [30℃/75%RH]

測定項目	測定時期		
	開始時	0.5ヵ月	1ヵ月
外観	白い粉末	白い粉末	白い粉末
含量 (%) [対開始時 (%)]	100.7 [100.0]	100.5 [99.8]	101.2 [100.5]

②光に対する安定性試験 [蛍光灯下(約1000Lx照射)]

測定項目	測定時期		
	開始時	0.5ヵ月	1ヵ月
外観	白い粉末	白い粉末	白い粉末
含量 (%) [対開始時 (%)]	100.7 [100.0]	100.6 [99.9]	99.2 [98.5]



③通常の環境下 [温度・湿度成り行き、室内散乱光]

測定項目	測定時期		
	開始時	0.5ヵ月	1ヵ月
外観	白い粉末	白い粉末	白い粉末
含量 (%) [対開始時 (%) ]	100.7 [100.0]	100.7 [100.0]	100.6 [99.9]

モサプリドクエン酸塩錠 5mg 「V T R S」

①湿度に対する安定性試験 [30℃/75%RH]

測定項目	測定時期		
	開始時	0.5ヵ月	1ヵ月
外観	白い粉末	白い粉末	白い粉末
含量 (%) [対開始時 (%) ]	99.4 [100.0]	100.3 [100.9]	100.4 [101.0]

②光に対する安定性試験 [蛍光灯 (約 1000Lx 照射) ]

測定項目	測定時期		
	開始時	0.5ヵ月	1ヵ月
外観	白い粉末	白い粉末	白い粉末
含量 (%) [対開始時 (%) ]	99.4 [100.0]	100.0 [100.6]	100.0 [100.6]

③通常の環境下 [温度・湿度成り行き、室内散乱光]

測定項目	測定時期		
	開始時	0.5ヵ月	1ヵ月
外観	白い粉末	白い粉末	白い粉末
含量 (%) [対開始時 (%) ]	99.4 [100.0]	101.0 [101.6]	101.1 [101.7]

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

【試験方法】 「内服薬経管投与ハンドブック第2版」<sup>参考文献1)</sup> に準じて実施。

①崩壊懸濁試験

1錠又は1カプセルをカテーテル用ディスペンサーに入れ、これに55℃の温湯20mLを吸い取り、ディスペンサーの先端に蓋をし、横向きに5分間放置する。5分後、ディスペンサーを手で90度の角度で15回往復横転し、「崩壊・懸濁」を観察する。

5分後に崩壊・懸濁しないものは更に5分間放置し、同様の操作を行う。それでも「崩壊・懸濁」しないものは、この方法による試料調製を中止する。

中止した薬剤は、粉碎可能な錠剤は、シート (PTP、SP) の上から乳棒で数回叩いてコーティング破壊をするか、開封可能なカプセル剤は開封してカテーテル用ディスペンサーに入れ、以下、上記と同様に操作を行う。

②通過性試験

ディスペンサー内で、崩壊懸濁試験で得られた試料溶液を経管栄養カテーテルの注入先端より約2～3mL/秒の速度で注入する。カテーテルはベッド上の患者を想定して、体内挿入端から2/3を水平にする。他端 (ディスペンサー注入先) は30cmの高さにセットする。経管栄養カテーテルのサイズは「8Fr」を用いる。

薬剤注入後、適量の水 (約10mL) で洗浄するとき、薬剤の残存を確認する。

【試験結果】

剤型	崩壊懸濁試験				通過性試験
	水 (約 55°C)		破壊→水 (約 55°C)		通過サイズ
	5分	10分	5分	10分	
モサプリドクエン酸塩錠 2.5mg「VTRS」	○	/	/	/	8Fr.
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「VTRS」	○	/	/	/	8Fr.

○：崩壊・懸濁した

### 文献請求先・製品情報お問い合わせ先

---

ヴィアトリス製薬合同会社 メディカルインフォメーション部  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号  
フリーダイヤル 0120-419-043

### 製造販売元

---

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号

### 販売元

---

ヴィアトリス製薬合同会社  
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号

