

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「アメル」
モサプリドクエン酸塩錠 5mg「アメル」

MOSAPRIDE CITRATE

貯 法：
気密容器、室温保存
使用期限：
包装箱、ラベルに表示。
使用期限を過ぎた製品は使用しないこと。

	錠2.5mg	錠5mg
承認番号	22400AMX01102	22400AMX01103
薬価収載	2012年12月	2012年12月
販売開始	2012年12月	2012年12月
** 効能追加	2020年9月	2020年9月

【組成・性状】

1. 組成

販売名	モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「アメル」	モサプリドクエン酸塩錠5mg「アメル」
有効成分	1錠中、日局モサプリドクエン酸塩水和物2.645mg(モサプリドクエン酸塩として2.5mg)を含有する。	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)を含有する。
添加物	乳糖水和物、トモロコシデンプン、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、クエン酸トリエチル、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ	乳糖水和物、トモロコシデンプン、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、クエン酸トリエチル、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ

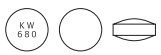
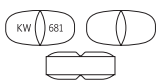
**【用法・用量】

- 慢性胃炎に伴う消化器症状(胸やけ、悪心・嘔吐)
通常、成人には、モサプリドクエン酸塩として1日15mgを3回に分けて食前または食後に経口投与する。
- 経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助
通常、成人には、経口腸管洗浄剤の投与開始時にモサプリドクエン酸塩として20mgを経口腸管洗浄剤(約180mL)で経口投与する。
また、経口腸管洗浄剤投与終了後、モサプリドクエン酸塩として20mgを少量の水で経口投与する。

** (用法・用量に関連する使用上の注意)

＜経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助の場合＞
経口腸管洗浄剤の「用法・用量」及び「用法・用量に関連する使用上の注意」を必ず確認すること。

2. 製剤の性状

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「アメル」	フィルムコーティング錠		KW680
	白色	直径：約5.6mm 厚さ：約2.9mm 質量：約71.2mg	
モサプリドクエン酸塩錠5mg「アメル」	割線入りフィルムコーティング錠		KW681
	白色	短径：約4.6mm 長径：約9.1mm 厚さ：約3.6mm 質量：約140mg	

**【効能・効果】

- 慢性胃炎に伴う消化器症状(胸やけ、悪心・嘔吐)
- 経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助

** (効能・効果に関連する使用上の注意)

＜経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助の場合＞
塩化ナトリウム、塩化カリウム、炭酸水素ナトリウム及び無水硫酸ナトリウム含有経口腸管洗浄剤(ニフレック配合内用剤)以外の経口腸管洗浄剤との併用による臨床試験は実施されていない。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

- (1)本剤を慢性胃炎に伴う消化器症状に用いる際には、一定期間(通常2週間)投与後、消化器症状の改善について評価し、投与継続の必要性について検討すること。
- (2)劇症肝炎や重篤な肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、長期にわたって漫然と投与しないこと。なお、本剤投与中は、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、患者に対し、本剤投与後に倦怠感、食欲不振、尿濃染、眼球結膜黄染等の症状があらわれた場合は、本剤を中止し、医師等に連絡するよう指導すること。

- ** (3)本剤を経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助に用いる際には、経口腸管洗浄剤の添付文書に記載されている警告、禁忌、慎重投与、重要な基本的注意、重大な副作用等の使用上の注意を必ず確認すること。

2. 相互作用

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。

3. 副作用

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。

(1) 重大な副作用 (頻度不明)

劇症肝炎、肝機能障害、黄疸：劇症肝炎、著しいAST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTPの上昇等を伴う重篤な肝機能障害、黄疸があらわれることがあり、死亡に至った例もあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

** (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)の場合>

	頻度不明
過敏症	浮腫、蕁麻疹、発疹
血液	好酸球増多、白血球減少
消化器	下痢・軟便、口渇、腹痛、嘔気・嘔吐、味覚異常、腹部膨満感、口内しびれ感(舌、口唇等を含む)
肝臓	ALT(GPT)、AST(GOT)、ALP、 γ -GTP、ビリルビンの上昇
循環器	心悸亢進
精神神経系	めまい・ふらつき、頭痛
その他	倦怠感、中性脂肪の上昇、振戦

<経口腸管洗浄剤によるバリウム注腸X線造影検査前処置の補助の場合>

	頻度不明
消化器	腹部膨満感、嘔気、腹痛、胃部不快感、おこび
肝臓	ビリルビンの上昇
精神神経系	頭痛、眠気
その他	胸部不快感、寒気、倦怠感、顔面腫脹、尿潜血、尿蛋白、LDHの上昇

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では腎機能、肝機能等の生理機能が低下しているため、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。なお、慢性胃炎に伴う消化器症状に用いる際に、副作用が発現した場合には、減量(例えば1日7.5mg)するなど適切な処置を行うこと。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合は、授乳を中止させること。〔動物実験(ラット)で乳汁への移行が報告されている。〕

6. 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。〕

7. 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。〕

8. その他の注意

げっ歯類に臨床通常用量の100~330倍(30~100mg/kg/日)を長期間経口投与した試験(ラット104週間、マウス92週間)において、腫瘍(肝細胞腺腫及び甲状腺濾胞性腫瘍)の発生率の上昇が認められた。

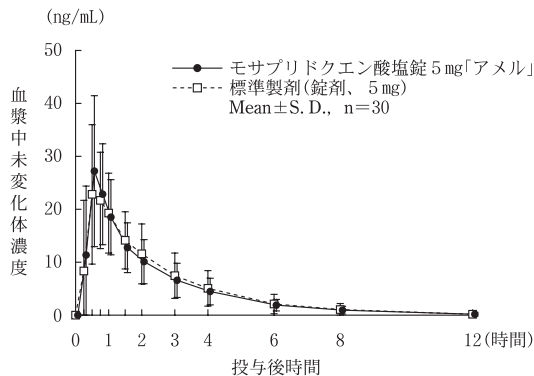
【薬物動態】

<生物学的同等性試験>

モサプリドクエン酸塩錠5mg「アメル」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(モサプリドクエン酸塩として5mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾ また、モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「アメル」について、「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(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「アメル」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。²⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₁₂₎ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
モサプリドクエン酸塩錠5mg「アメル」	56.54±23.91	31.20±12.08	0.7±0.4	1.90±0.49
標準製剤(錠剤、5mg)	59.04±26.83	29.53±11.09	0.8±0.4	1.84±0.57

(Mean ± S. D., n = 30)



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。

<溶出挙動>³⁾

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「アメル」・錠5mg「アメル」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。

【薬効薬理】

選択的セロトニン5-HT₄受容体作用薬。消化管壁内神経叢に存在する5-HT₄受容体を刺激し、アセチルコリン遊離の増大を介して消化管運動促進及び胃排出促進作用を示すと考えられている。⁴⁾

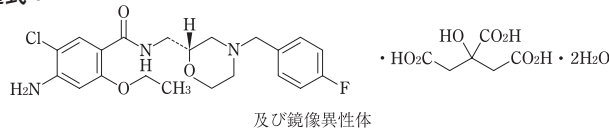
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：モサプリドクエン酸塩水和物
(Mosapride Citrate Hydrate)

分子式：C₂₁H₂₅ClFN₃O₃ · C₆H₅O₇ · 2H₂O

分子量：650.05

構造式：



化学名：4-Amino-5-chloro-2-ethoxy-N-[(2RS)-4-(4-fluorobenzyl)morpholin-2-yl]methyl benzamide monocitrate dihydrate

性状：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。
本品の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。

【取扱い上の注意】

〈安定性試験〉⁵⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「アメル」・錠5mg「アメル」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。

【包 装】

モサプリドクエン酸塩錠2.5mg「アメル」：

PTP100錠(10錠×10)

モサプリドクエン酸塩錠5mg「アメル」：

PTP100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

バラ1,000錠

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- 1) 共和薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 共和薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験(溶出挙動比較)
- 3) 共和薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験
- * * 4) 第十七改正日本薬局方解説書, 廣川書店, C-5558(2016)
- 5) 共和薬品工業株式会社 社内資料：安定性試験

* 〈文献請求先〉

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口

〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4

 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

* 製造販売元

 共和薬品工業株式会社
大阪市北区中之島3-2-4

