



**2015年8月改訂(第18版)

*2012年4月改訂

貯法：気密容器・室温保存
使用期限：外箱等に記載

日本標準商品分類番号

872399

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

ガスモチン[®]錠5mgガスモチン[®]錠2.5mg

日本薬局方 モサプリドクエン酸塩散

ガスモチン[®]散1%GASMOTIN[®]

© 登録商標

	錠5mg	錠2.5mg	散1%
承認番号	21000AMZ00660	21000AMZ00659	22100AMX01778
薬価収載	1998年9月	1998年9月	2009年9月
販売開始	1998年10月	1998年10月	1998年10月
**再審査結果	2015年6月		
効能追加	2009年4月		
国際誕生	1998年6月		

■組成・性状

販売名	ガスモチン錠5mg	ガスモチン錠2.5mg
成分・含量	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	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
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、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、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、タルク	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、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、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、タルク
剤形	白色の割線入りフィルムコート錠	白色のフィルムコート錠
外形		
大きさ	短・長径(mm) 4.7・9.2 厚さ(mm) 3.7 重さ(g) 0.14	直径(mm) 6.2 厚さ(mm) 3.1 重さ(g) 0.08
識別コード	P218	P217

販売名	ガスモチン散1%
成分・含量	1g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10mg
添加物	D-マンニトール、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、軽質無水ケイ酸
剤形	白色の散剤
におい・味	においはなく、味は甘い。

■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。〔「臨床成績」の項参照〕

■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。

■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	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。

3. 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>

承認時までの臨床試験における調査症例998例中40例(4.0%)に副作用がみられた。その主なものは下痢・軟便(1.8%)、口渇(0.5%)、倦怠感(0.3%)等であった。臨床検査値の異常変動は792例中30例(3.8%)にみられた。その主なものは好酸球増多(1.1%)、中性脂肪の

上昇(1.0%)、AST(GOT)、ALT(GPT)、ALP及びγ-GTPの上昇(各0.4%)等であった。(承認時)

市販後の使用成績調査・特別調査(長期使用調査)症例3,014例中74例(2.5%)に副作用がみられた。その主なものは下痢・軟便(0.8%)、腹痛(0.4%)、口渇(0.3%)等であった。(再審査終了時)

**<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>

承認時までの臨床試験における調査症例241例中35例(14.5%)に副作用(臨床検査値異常を含む)がみられた。その主なものは腹部膨満感(3.7%)、嘔気(3.3%)、尿潜血(2.1%)、腹痛(1.2%)、頭痛(1.2%)、尿蛋白(1.2%)等であった。(承認時)

市販後の使用成績調査症例1,306例中3例(0.2%)に副作用がみられた。(再審査終了時)

(1)重大な副作用

劇症肝炎、肝機能障害、黄疸(いずれも0.1%未満)

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>

分類	0.1~2%未満	0.1%未満	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)の上昇	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>

分類	0.1~5%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	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(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

1. 血漿中濃度

(1)単独投与時¹⁾

(健康成人5例、空腹時本剤5mg1回投与)

Tmax(h)	Cmax(ng/mL)	T _{1/2} (h)	AUC _{0-∞} (ng・h/mL)
0.8±0.1	30.7±2.7	2.0±0.2	67±8

平均値±標準誤差

(2)経口腸管洗浄剤併用時²⁾

〔健康成人、空腹時本剤20mg(1回目)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)投与〕

投与時期	Tmax(h)	Cmax(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

2. 血清蛋白結合率³⁾

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

3. 主な代謝産物及び代謝経路

主な代謝産物¹⁾: 4-フルオロベンジル基脱離体

代謝経路^{1,4)}: 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。

4. 排泄経路及び排泄率

排泄経路: 尿中、糞便中

排泄率¹⁾: 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。(健康成人、空腹時本剤5mg1回投与)

5. 代謝酵素⁵⁾

チトクロームP-450分子種: 主としてCYP3A4

6. 相互作用⁶⁾

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、AUC₀₋₄は62ng・h/mLから114ng・h/mLに増加した。(健康成人)

■臨床成績

1. 慢性胃炎に伴う消化器症状(胸やけ、悪心・嘔吐)

二重盲検比較試験⁷⁾を含む総計435例についての臨床成績は次のとおりである。

対象疾患/症状	改善率
慢性胃炎	胸やけ 74%(130/176)
	悪心・嘔吐 77%(150/196)

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

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⁸⁾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。

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)。

■薬効薬理

1. 臨床薬理

健康成人⁹⁾及び慢性胃炎患者¹⁰⁾を対象とした胃排出試験において、本剤5mg 1回投与で胃排出促進作用を示す。

2. 上部消化管運動促進作用

(1)胃、十二指腸運動促進作用¹¹⁾

用量依存的に、食後期の胃、十二指腸運動促進作用を示す(イヌ)。

(2)胃排出促進作用¹²⁾

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(ラット)。

3. 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^{13,14)}

用量依存的に結腸運動及び内容物輸送促進作用を示す(モルモット)。

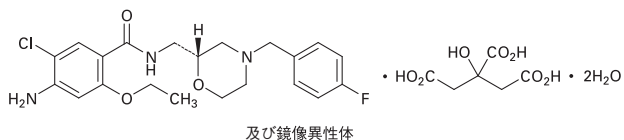
(2)結腸内の洗浄増強効果及び水分重量減少作用(経口腸管洗浄剤併用時)¹³⁾

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(モルモット)。

4. 作用機序^{11,12,14)}

本剤は選択的なセロトニン5-HT₄受容体アゴニストであり、消化管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。

■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

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

分子式：C₂₁H₂₅ClFN₃O₃・C₆H₈O₇・2H₂O

分子量：650.05

分配係数：9.1×10²(クロロホルム/水系溶媒、pH7.0、室温)

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。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。

■包装

ガスモチン錠5mg：

[PTP]100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)、1,050錠(21錠×50)

[バラ]1,000錠

ガスモチン錠2.5mg：

[PTP]100錠(10錠×10)

ガスモチン散1%：

[分包]300g(0.5g×600)

[バラ]100g、500g

■主要文献

- 1) Sakashita, M., et al. : *Arzneim.-Forsch./Drug Res.*, 43 : 867, 1993
- 2) 降旗謙一, ほか : *診療と新薬*, 46 : 262, 2009
- 3) Matsumoto, S., et al. : *Arzneim.-Forsch./Drug Res.*, 43 : 1084, 1993
- 4) Matsumoto, S., et al. : *Arzneim.-Forsch./Drug Res.*, 43 : 1095, 1993

5) 大日本住友製薬資料：代謝酵素

6) 加藤貴雄, ほか : *臨床医薬*, 15 : 753, 1999

7) 三好秋馬, ほか : *臨床医薬*, 14 : 1037, 1998

8) 杉野吉則, ほか : *日本大腸検査学会雑誌*, 25 : 99, 2008

9) 金泉年郁, ほか : *日本平滑筋学会雑誌*, 26 : 161, 1990

10) 須山哲次, ほか : *内科室函*, 40 : 175, 1993

11) Yoshida, N., et al. : *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, 257 : 781, 1991

12) 大日本住友製薬資料：薬効薬理

13) Mine, Y., et al. : *J. Pharmacol. Sci.*, 110 : 415, 2009

14) Inui, A., et al. : *Jpn. J. Pharmacol.*, 90 : 313, 2002

■文献請求先、製品に関するお問い合わせ先

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。

大日本住友製薬株式会社

〒541-0045 大阪市中央区道修町2-6-8

くすり情報センター

TEL 0120-034-389

製造販売元

大日本住友製薬株式会社

大阪市中央区道修町2-6-8

