

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2013に準拠して作成

ロイコトリエン受容体拮抗剤
気管支喘息・アレルギー性鼻炎治療剤
日本薬局方 モンテルカストナトリウム錠
J・P Montelukast Sodium Tablets
モンテルカスト錠 5mg「日新」
モンテルカスト錠 10mg「日新」

剤形	錠剤（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 5mg：1錠中に日本薬局方モンテルカストナトリウム 5.2mg （モンテルカストとして 5mg）含有 錠 10mg：1錠中に日本薬局方モンテルカストナトリウム 10.4mg （モンテルカストとして 10mg）含有			
一般名	和名：モンテルカストナトリウム 洋名：Montelukast Sodium			
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	薬価基準収載年月日	発売年月日
	錠 5mg	2016年8月15日	2016年12月9日	2016年12月9日
	錠 10mg	2016年8月15日	2016年12月9日	2016年12月9日
開発・製造販売 （輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：日新製薬株式会社			
医薬情報担当者の 連絡先				
問い合わせ窓口	日新製薬株式会社 安全管理部 TEL：023-655-2131 FAX：023-655-3419 医療関係者向けホームページ： http://www.yg-nissin.co.jp/			

本 I F は 2019 年 4 月 改 訂 （ 第 3 版 ） の 添 付 文 書 の 記 載 に 基 づ き 作 成 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」
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

I F 利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

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、I F と略す）の位置付け並びに I F 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 I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、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 I F 記載要領 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F を紙媒体の冊子として提供する方式から、P D F 等の電磁的データとして提供すること（e-I F）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-I F が提供されることとなった。

最新版の e-I F は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-I F を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F が添付文書を補完する適正使用上情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. I F とは

I F 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 I F 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 I F 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。

[I F の様式]

- ①規格は A 4 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、一色刷りとする。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。
- ② I F 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「I F 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。

[I F の作成]

- ① I F 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。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの I F 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 2013」（以下、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F 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（P D F）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[I F の発行]

- ① 「 I F 記載要領 2013 」 は、平成 25 年 10 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、「 I F 記載要領 2013 」 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 I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「 I F 記載要領 2013 」 においては、 P D F 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ある。

電子媒体の I F 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、 I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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、 I F 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、 I F 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、 I F 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

I F 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。 I F 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、 I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、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。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・ 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性・・・・・・・・・・・・・・・・ 1

II. 名称に関する項目

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・・・・・・・・・・・・・・・・ 2
7. CAS登録番号・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・ 2

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・ 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性・・・・・・・・ 3
3. 有効成分の確認試験法・・・・・・・・・・・・・・・・ 3
4. 有効成分の定量法・・・・・・・・・・・・・・・・ 3

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・ 4
2. 製剤の組成・・・・・・・・・・・・・・・・ 4
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意・・・・・・・・ 4
4. 製剤の各種条件下における安定性・・・・・・・・ 5
5. 調製法及び溶解後の安定性・・・・・・・・ 1 0
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）・・・・・・・・ 1 0
7. 溶出性・・・・・・・・・・・・・・・・ 1 1
8. 生物学的試験法・・・・・・・・・・・・・・・・ 1 6
9. 製剤中の有効成分の確認試験法・・・・・・・・ 1 6
10. 製剤中の有効成分の定量法・・・・・・・・ 1 6
11. 力価・・・・・・・・・・・・・・・・ 1 6
12. 混入する可能性のある夾雑物・・・・・・・・ 1 6
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報・・・・・・・・ 1 6
14. その他・・・・・・・・・・・・・・・・ 1 6

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果・・・・・・・・・・・・・・・・ 1 7
2. 用法及び用量・・・・・・・・・・・・・・・・ 1 7
3. 臨床成績・・・・・・・・・・・・・・・・ 1 7

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・・・・・・・・ 1 8
2. 薬理作用・・・・・・・・・・・・・・・・ 1 8

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法・・・・・・・・ 1 9
2. 薬物速度論的パラメータ・・・・・・・・ 2 0
3. 吸収・・・・・・・・・・・・・・・・ 2 0
4. 分布・・・・・・・・・・・・・・・・ 2 0
5. 代謝・・・・・・・・・・・・・・・・ 2 0
6. 排泄・・・・・・・・・・・・・・・・ 2 0
7. トランスポーターに関する情報・・・・・・・・ 2 1
8. 透析等による除去率・・・・・・・・ 2 1

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	2 2
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	2 2
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	2 2
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	2 2
5. 慎重投与内容とその理由	2 2
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	2 2
7. 相互作用	2 2
8. 副作用	2 3
9. 高齢者への投与	2 3
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	2 4
11. 小児等への投与	2 4
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	2 4
13. 過量投与	2 4
14. 適用上の注意	2 4
15. その他の注意	2 4
16. その他	2 4

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	2 5
2. 毒性試験	2 5

Ⅹ. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	2 6
2. 有効期間又は使用期限	2 6
3. 貯法・保存条件	2 6
4. 薬剤取扱い上の注意点	2 6
5. 承認条件等	2 6
6. 包装	2 6
7. 容器の材質	2 6
8. 同一成分・同効薬	2 6
9. 国際誕生年月日	2 6
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	2 6
11. 薬価基準収載年月日	2 6
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	2 7
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	2 7
14. 再審査期間	2 7
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	2 7
16. 各種コード	2 7
17. 保険給付上の注意	2 7

Ⅺ. 文献

1. 引用文献	2 8
2. その他の参考文献	2 8

Ⅻ. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	2 8
2. 海外における臨床支援情報	2 8

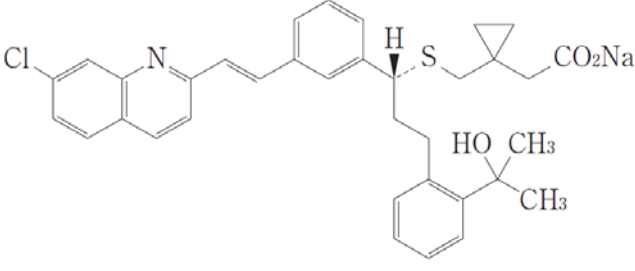
ⅫⅢ. 備考

その他の関連資料	2 8
----------	-----

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯	<p>モンテルカストナトリウムは Merck Frosst Canada & Co. で合成され、Merck & Co. Inc. で開発されたシテイニルロイコトリエンサブタイプ I 受容体拮抗薬である。</p> <p>日新製薬(株)は、『モンテルカスト錠 5mg 「日新」』、『モンテルカスト錠 10mg 「日新」』を後発医薬品として企画・開発し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2016 年 8 月に承認を取得し、2016 年 12 月に薬価収載された。</p> <p>・2016 年 11 月 効能・効果、用法・用量を追加。 「気管支喘息」</p>
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	<p>モンテルカストナトリウムは抗アレルギー薬である。アレルギーのメディエーターの 1 つであるロイコトリエン (LT) の受容体には、cysLT1 受容体と cysLT2 受容体があるが、モンテルカストナトリウムは cysLT1 受容体遮断薬である。</p> <p>重大な副作用として、アナフィラキシー、血管浮腫、劇症肝炎、肝炎、肝機能障害、黄疸、中毒性表皮壊死融解症 (Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)、皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson 症候群)、多形紅斑、血小板減少があらわれることがある。</p>







II. 名称に関する項目

<p>1. 販売名 (1) 和名 (2) 洋名 (3) 名称の由来</p>	<p>モンテルカスト錠 5mg 「日新」 モンテルカスト錠 10mg 「日新」 Montelukast Tablets 5mg “NISSIN” Montelukast Tablets 10mg “NISSIN” 本剤の一般名「モンテルカストナトリウム」に由来する。</p>
<p>2. 一般名 (1) 和名 (命名法) (2) 洋名 (命名法) (3) ステム</p>	<p>モンテルカストナトリウム (JAN) Montelukast Sodium (JAN)、Montelukast (INN) ロイコトリエン拮抗薬：-lukast</p>
<p>3. 構造式又は示性式</p>	
<p>4. 分子式及び分子量</p>	<p>分子式：C₃₅H₃₅ClNNaO₃S 分子量：608.17</p>
<p>5. 化学名 (命名法)</p>	<p>Monosodium (1-{[(1<i>R</i>)-1-{3-[(1<i>E</i>)-2-(7-chloroquinolin-2-yl)ethenyl]phenyl}-3-[2-(1-hydroxy-1-methylethyl)phenyl]propyl]sulfanyl)methyl}cyclopropyl)acetate (IUPAC)</p>
<p>6. 慣用名、別名、略号、記号番号</p>	<p>該当資料なし</p>
<p>7. CAS登録番号</p>	<p>151767-02-1 (Montelukast Sodium) 158966-92-8 (Montelukast)</p>

Ⅲ. 有効成分に関する項目

<p>1. 物理化学的性質</p> <p>(1) 外観・性状</p> <p>(2) 溶解性</p> <p>(3) 吸湿性</p> <p>(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点</p> <p>(5) 酸塩基解離定数</p> <p>(6) 分配係数</p> <p>(7) その他の主な示性値</p>	<p>白色～微黄白色の粉末である。 結晶多形が認められる。 メタノール及びエタノール (99.5) に極めて溶けやすく、水に溶けやすい。 吸湿性である。 該当資料なし 該当資料なし 該当資料なし 該当資料なし</p>
<p>2. 有効成分の各種条件下における安定性</p>	<p>本品は光によって黄色に変化する。</p>
<p>3. 有効成分の確認試験法</p>	<p>日本薬局方モンテルカストナトリウムの確認試験法による。 (1) ナトリウム塩の定性反応 (2) 紫外可視吸光度測定法 (3) 赤外吸収スペクトル測定法 自社規格による。 (4) 赤外吸収スペクトル測定法 (ペースト法)</p>
<p>4. 有効成分の定量法</p>	<p>日本薬局方モンテルカストナトリウムの定量法による。 液体クロマトグラフィー</p>

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形 (1) 剤形の区別、外観及び性状 (2) 製剤の物性 (3) 識別コード (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	<table border="1"> <tr> <th>販売名</th> <th>モンテルカスト錠 5mg「日新」</th> <th>モンテルカスト錠 10mg「日新」</th> </tr> <tr> <th>区 別</th> <td colspan="2">錠剤（フィルムコーティング錠）</td> </tr> <tr> <th>性 状</th> <td colspan="2">明るい灰黄色のフィルムコーティング錠</td> </tr> <tr> <th>外 形</th> <td></td> <td></td> </tr> <tr> <th>大きさ</th> <td>錠径：6.1mm 錠厚：3.4mm 重量：107mg</td> <td>錠径：7.6mm 錠厚：3.6mm 重量：159mg</td> </tr> </table>	販売名	モンテルカスト錠 5mg「日新」	モンテルカスト錠 10mg「日新」	区 別	錠剤（フィルムコーティング錠）		性 状	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠		外 形			大きさ	錠径：6.1mm 錠厚：3.4mm 重量：107mg	錠径：7.6mm 錠厚：3.6mm 重量：159mg
	販売名	モンテルカスト錠 5mg「日新」	モンテルカスト錠 10mg「日新」													
	区 別	錠剤（フィルムコーティング錠）														
	性 状	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠														
	外 形															
大きさ	錠径：6.1mm 錠厚：3.4mm 重量：107mg	錠径：7.6mm 錠厚：3.6mm 重量：159mg														
該当資料なし 錠 5mg：NS 4 2 2 錠 10mg：NS 4 2 3 該当しない																
2. 製剤の組成 (1) 有効成分（活性成分）の含量 (2) 添加物 (3) その他	錠 5mg：1錠中に日本薬局方モンテルカストナトリウム 5.2mg（モンテルカストとして 5mg）含有 錠 10mg：1錠中に日本薬局方モンテルカストナトリウム 10.4mg（モンテルカストとして 10mg）含有 錠 5mg、錠 10mg： 乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ 該当しない															
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) 2)}

モンテルカスト錠 5mg 「日新」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、遮光保存において3年間安定であることが推測された。

加速試験

試験条件：最終包装製品（PTP包装し、ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルムでピロー包装し、紙箱に入れたもの）の状態、40±1℃、75±5% R. H.

項目及び規格	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
確認試験 紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 (含量均一性試験(%)) 判定値 : 15.0%を超えない	5.2	4.9	4.3	4.1
溶出性(%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 50回転、20分、85%以上	98~105	102~105	91~105	96~105
定量試験(%) 95.0~105.0	102.7	102.4	102.1	102.6

無包装状態における安定性試験（参考情報）

温度（40℃ 遮光・密栓）

項目及び規格	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量(%) 95.0~105.0	101.8	102.4	102.6	101.8
溶出性(%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	99~102	99~103	95~101	97~103
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合
硬度(N)	70	68	73	69

湿度 (30°C75%R. H. 遮光・開放)

項目及び規格	開始時	0.5 ヶ月
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量 (%) 95.0~105.0	101.8	103.0
溶出性 (%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	99~102	69~101 (規格外)
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合
硬度 (N)	70	35

光 (D65 ランプ 約 1000lx 開放)

項目及び規格	開始時	約 10 万 lx・hr (約 4 日)	約 20 万 lx・hr (約 8 日)
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量 (%) 95.0~105.0	101.6	102.2	101.4
溶出性 (%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	98~104	97~101	96~101
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	不適合
硬度 (N)	70	61	64

温度・湿度 成り行き* (遮光・開放)

* 温度 : 21~26°C、湿度 : 23~50%R. H.

項目及び規格	開始時	約 8 日	約 13 日	約 25 日	約 50 日
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量 (%) 95.0~105.0	101.6	101.5	101.5	102.4	102.0
溶出性 (%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	98~104	98~100	99~103	100~104	101~104
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合	適合
硬度 (N)	70	48	50	63	61

一次包装状態（PTPシート）の安定性試験（参考情報）

湿度（30°C75%R.H. PTPシート）

項目及び規格	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量(%) 95.0~105.0	101.8	100.6	101.5	102.2
溶出性(%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	99~102	100~103	96~105	99~101
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合
硬度(N)	70	66	60	56

光（D65 ランプ 約1000lx PTPシート）

項目及び規格	開始時	約20万 lx・hr (約8日)	約30万 lx・hr (約13日)	約60万 lx・hr (約25日)	約120万 lx・hr (約50日)
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量(%) 95.0~105.0	101.6	101.7	101.3	101.1	101.0
溶出性(%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	98~104	100~102	98~101	100~104	99~102
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合	不適合
硬度(N)	70	67	69	68	66

モンテルカスト錠 10mg 「日新」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、遮光保存において3年間安定であることが推測された。

加速試験

試験条件：最終包装製品（P T P 包装し、ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルムでピロー包装し、紙箱に入れたもの）の状態、40±1℃、75±5% R. H.

項目及び規格	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
確認試験 紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合
製剤均一性※ (含量均一性試験(%)) 判定値 : 15.0%を超えない	2.8	4.1	3.5	3.6
溶出性 (%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 50 回転、20 分、85%以上	99~105	100~105	94~102	92~105
定量試験 (%) 95.0~105.0	102.0	102.7	101.7	102.4

※ 第十七改正日本薬局方収載に伴い、製剤均一性の試験方法が一部変更されたため、3 ヶ月後より日局に従い試験を実施した。

無包装状態における安定性試験（参考情報）

温度（40℃ 遮光・密栓）

項目及び規格	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量 (%) 95.0~105.0	102.7	101.6	101.6	101.8
溶出性 (%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20 分、85%以上	92~101	99~103	98~99	70*~99
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合
硬度 (N)	85	88	75	79

* 試料 6 個について試験を行った結果、規格不適合の試料が 1 個であったため、日本薬局方の試験法に従い、新たに試料 6 個をとって試験を繰り返した結果、12 個中 11 個が規定の値であったため適合とした。

湿度 (30°C75%R. H. 遮光・開放)

項目及び規格	開始時	0.5 ヶ月
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量 (%) 95.0~105.0	102.7	102.0
溶出性 (%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	92~101	29~93 (規格外)
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合
硬度 (N)	85	51

光 (D65 ランプ 約1000lx 開放)

項目及び規格	開始時	約10万 lx・hr (約4日)	約20万 lx・hr (約8日)
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量 (%) 95.0~105.0	101.7	100.8	100.4
溶出性 (%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	87~102	96~100	97~101
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	不適合
硬度 (N)	85	83	82

温度・湿度 成り行き* (遮光・開放)

* 温度 : 21~26°C、湿度 : 23~50%R. H.

項目及び規格	開始時	約8日	約13日	約25日	約50日
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量 (%) 95.0~105.0	101.7	101.2	100.6	101.6	101.7
溶出性 (%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	87~102	97~101	96~102	96~101	94~101
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合	適合
硬度 (N)	85	60	62	79	76

一次包装状態（PTPシート）の安定性試験（参考情報）

湿度（30°C75%R.H. PTPシート）

項目及び規格	開始時	1ヵ月	2ヵ月	3ヵ月
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量(%) 95.0~105.0	102.7	101.3	101.2	101.0
溶出性(%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	92~101	99~102	99~102	96~100
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合
硬度(N)	85	85	72	71

光（D65 ランプ 約1000lx PTPシート）

項目及び規格	開始時	約20万 lx・hr (約8日)	約30万 lx・hr (約13日)	約60万 lx・hr (約25日)	約120万 lx・hr (約50日)
性状 明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠	明るい灰黄色のフィルムコーティング錠
含量(%) 95.0~105.0	101.7	101.0	100.8	101.0	100.6
溶出性(%) ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)、 20分、85%以上	87~102	98~101	96~103	93~99	100~104
純度試験 類縁物質 ・RRT 約0.45 : 1.0%以下 ・RRT 約0.92 : 0.15%以下 ・モンテルカスト及び上記以外の個々 : 0.1%以下 ・モンテルカスト以外の総和 : 1.2%以下	適合	適合	適合	適合	不適合
硬度(N)	85	86	87	84	86

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
(物理化学的変化)

該当しない

7. 溶出性³⁾

モンテルカスト錠 5mg「日新」の溶出挙動における同等性

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 日付医薬審第 64 号（一部改正：平成 24 年 2 月 29 日付薬食審査発 0229 第 10 号）

試験方法：日本薬局方溶出試験法のパドル法

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH4.0 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液

及び、上記 3 試験液に各々ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v) 水 日本薬局方精製水

回転数：50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)、100rpm (pH6.8)

試験回数：各 12 ベッセル

試験時間：pH1.2 では 2 時間、その他の試験液では 6 時間とする。ただし、標準製剤の平均溶出率が 85% を越えた時点で、試験を終了することができる。

分析法：液体クロマトグラフィー

標準製剤：モンテルカスト錠 10mg「日新」

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って同等性を判定した。

【pH1.2(50rpm)、pH4.0(50rpm)、pH6.8(50rpm)、 pH4.0[ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)](50rpm)】

標準製剤が 30 分以内に平均 85% 以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 50% に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±6% の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 61 以上である。ただし、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 10% 以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±6% の範囲にある。

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、標準製剤の平均溶出率が 50% に達しないとき、試験製剤の平均溶出率±9% の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±15% の範囲を超えるものがない。

【水(50rpm)、pH1.2[ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)](50rpm)】

標準製剤が 30 分以内に平均 85% 以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 50% 以上 85% に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±8% の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 55 以上である。

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、標準製剤の平均溶出率が 50% 以上に達し 85% に達しないとき、試験製剤の平均溶出率±12% の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±20% の範囲を超えるものがない。

【pH6.8[ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)] (50rpm)、
pH6.8[ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)] (100rpm)】

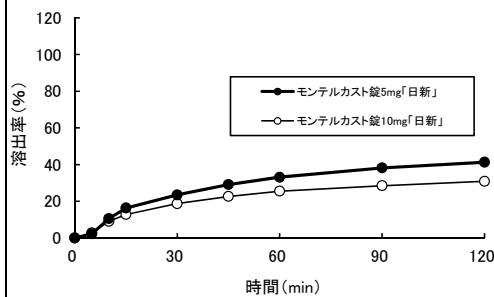
標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又は f2 関数の値は 50 以上である。

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±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い。

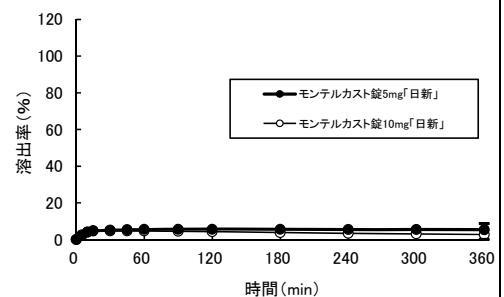
結果：平均溶出率及び個々の溶出率ともにガイドラインの基準を全て満たし溶出挙動が同等と判断されたため、両製剤は生物学的に同等とみなされた。

pH1.2 50rpm

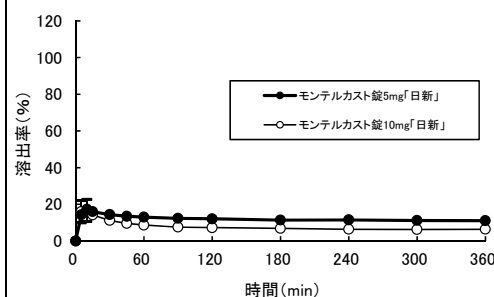


f2 関数の値 ≥ 61 : 適合

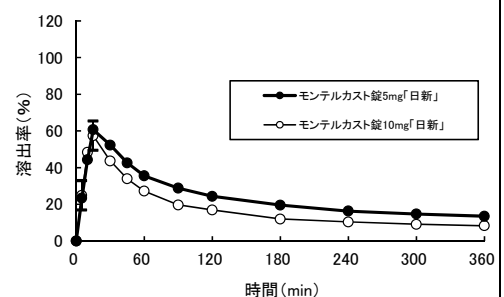
pH4.0 50rpm



pH6.8 50rpm

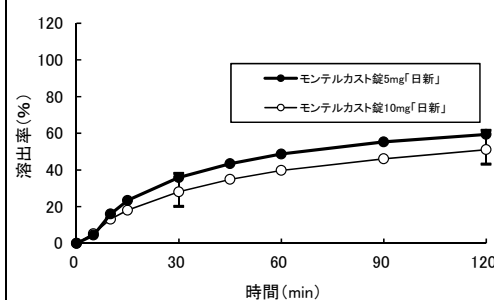


水 50rpm



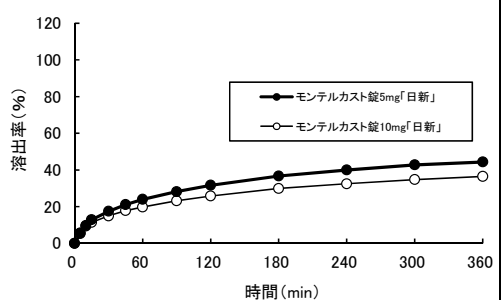
pH1.2 50rpm

ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)

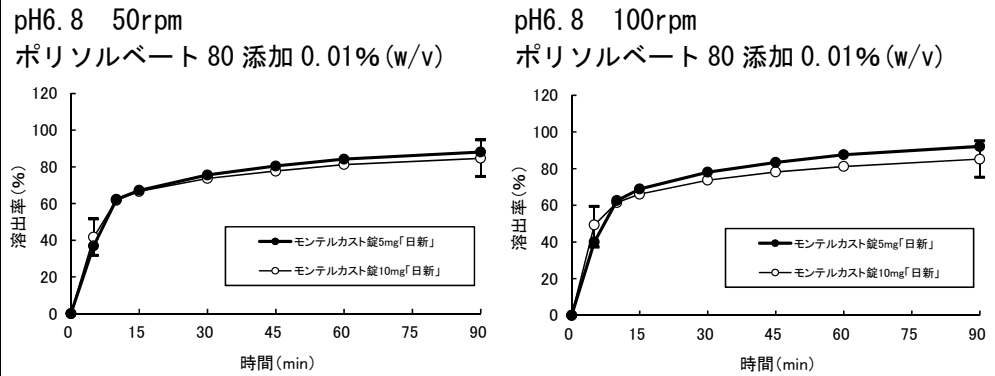


pH4.0 50rpm

ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)



f2 関数の値 ≥ 61 : 適合



表：溶出挙動における同等性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件				標準製剤 (モンテルカスト錠 10mg「日新」)	モンテルカスト錠 5mg「日新」	判定
回転数	界面活性剤	試験液	採取時間	平均溶出率%	平均溶出率%	
50rpm	無添加	pH1.2	60分	25.5	f2 関数の値 61.5	適合
		pH4.0	360分	2.7	5.4	適合
		pH6.8	5分	16.0	14.3	適合
			10分	16.6	17.3	適合
	水	5分	24.9	23.4	適合	
		15分	57.4	60.7	適合	
	ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)	pH1.2	30分	28.1	35.9	適合
			120分	51.1	59.4	適合
pH4.0		180分	29.9	f2 関数の値 63.0	適合	
		5分	41.7	36.9	適合	
pH6.8	90分	84.7	88.1	適合		
	5分	49.3	40.0	適合		
100rpm	pH6.8	90分	85.2	92.1	適合	

(n=12)

表：溶出挙動における同等性（試験製剤の個々の溶出率）

試験条件			最終比較 時点	モンテルカスト錠 5mg「日新」		判定基準	判定
回転数	界面活性剤	試験液		平均 溶出率%	個々の 溶出率%		
50rpm	無添加	pH1.2	120分	41.3	39.9~42.4	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがない。	適合
		pH4.0	360分	5.4	4.7~6.1	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがない。	適合
		pH6.8	10分	17.3	16.4~18.2	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがない。	適合
			15分	60.7	49.4~66.8	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±20%の範囲を超えるものがない。	適合
	ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)	pH1.2	120分	59.4	56.8~61.2	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがない。	適合
			pH4.0	360分	44.4	42.6~45.8	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがない。
		pH6.8	90分	88.1	85.3~92.7	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±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い。	適合
			90分	92.1	88.8~95.4	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±15%の範囲を超えるものがない。	適合
100rpm	pH6.8	90分	92.1	88.8~95.4	試験製剤の最終比較時点の平均溶出率±15%の範囲を超えるものがない。	適合	

(n=12)

モンテルカスト錠 5mg「日新」は、日本薬局方医薬品各条に定められたモンテルカストナトリウム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	回転数	規定時間	溶出規格
ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)	50rpm	20分	85%以上

モンテルカスト錠 10mg「日新」の溶出挙動における類似性

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成 9 年 12 月 22 日付医薬審第 487 号（一部改正：平成 24 年 2 月 29 日付薬食審査発 0229 第 10 号）

試験方法：日本薬局方溶出試験法のパドル法

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH4.0 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH6.8 日本薬局方溶出試験第 2 液

及び、上記 3 試験液に各々ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)

水 日本薬局方精製水

回転数：50rpm (pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)、100rpm (pH6.8)

試験回数：各 12 ベッセル

試験時間：pH1.2 では 2 時間、その他の試験液では 6 時間とする。ただし、標準製剤の平均溶出率が 85% を越えた時点で、試験を終了することができる。

分析法：液体クロマトグラフィー

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って類似性を判定した。

**【pH1.2(50rpm)、pH4.0(50rpm)、pH6.8(50rpm)、
pH4.0[ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)](50rpm)】**

標準製剤が 30 分以内に平均 85% 以上溶出しない場合

規定された試験時間において、標準製剤の平均溶出率が 50% に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9% の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。ただし、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 10% 以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9% の範囲にある。

【水(50rpm)、pH1.2[ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)](50rpm)】

標準製剤が 30 分以内に平均 85% 以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 50% 以上 85% に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±12% の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 46 以上である。

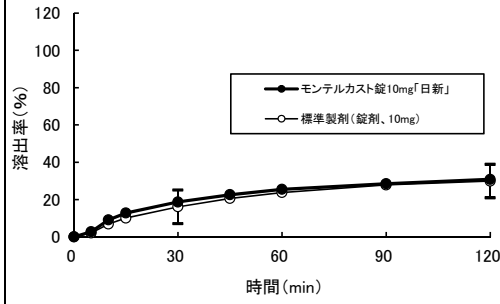
**【pH6.8[ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)](50rpm)、
pH6.8[ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)](100rpm)】**

標準製剤が 30 分以内に平均 85% 以上溶出しない場合

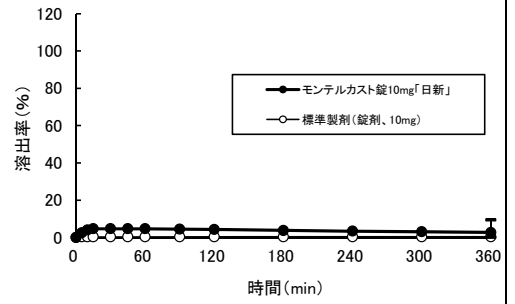
規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85% 以上となる時、標準製剤の平均溶出率が 40% 及び 85% 付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15% の範囲にあるか、又は f2 関数の値は 42 以上である。

結果：いずれの場合においても溶出挙動が類似していると判定された。

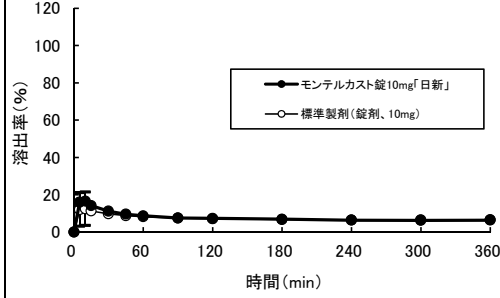
pH1.2 50rpm



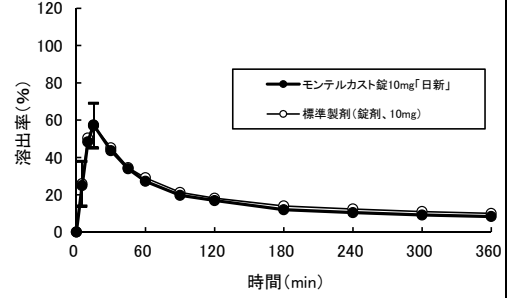
pH4.0 50rpm



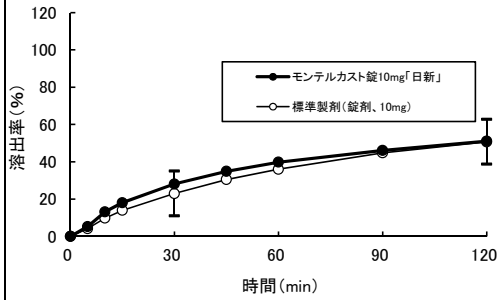
pH6.8 50rpm



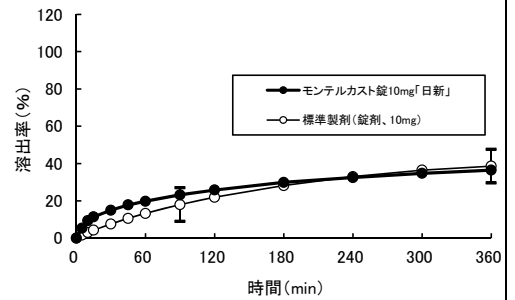
水 50rpm



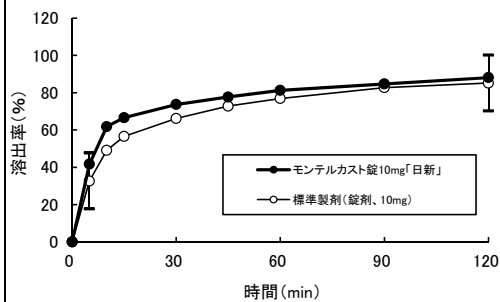
pH1.2 50rpm
ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)



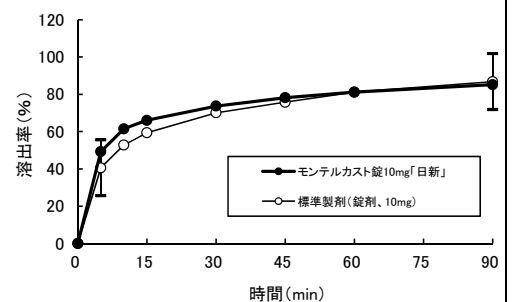
pH4.0 50rpm
ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)



pH6.8 50rpm
ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)



pH6.8 100rpm
ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)



表：溶出挙動における類似性（試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較）

試験条件				標準製剤 (錠剤、10mg)	モンテルカスト錠 10mg「日新」	判定
回転数	界面活性剤	試験液	採取時間	平均溶出率%	平均溶出率%	
50rpm	無添加	pH1.2	30分	16.1	18.7	適合
			120分	29.9	30.9	
		pH4.0	360分	0.4	2.7	適合
			pH6.8	5分	12.1	16.0
		10分		12.5	16.6	
		水	5分	25.9	24.9	適合
	15分		57.0	57.4		
	ポリソルベート 80 添加 0.01% (w/v)	pH1.2	30分	23.0	28.1	適合
			120分	50.7	51.1	
		pH4.0	90分	18.0	23.2	適合
			360分	38.6	36.5	
		pH6.8	5分	32.7	41.7	適合
120分			85.2	88.1		
100rpm	pH6.8	5分	40.6	49.3	適合	
		90分	86.8	85.2		

(n=12)

モンテルカスト錠 10mg「日新」は、日本薬局方医薬品各条に定められたモンテルカストナトリウム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	回転数	規定時間	溶出規格
ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)	50rpm	20分	85%以上

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

日本薬局方モンテルカストナトリウム錠の確認試験法による。
紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方モンテルカストナトリウム錠の定量法による。
液体クロマトグラフィー

11. 力価

本剤は力価表示に該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

スルホキシド体、シス異性体、マイケル付加体、メチルケトン体、メチルスチレン体、メチルエステル酸体、 α -ヒドロキシ酸体、ビスオレフィン体、ケトカルビノール体

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	気管支喘息、アレルギー性鼻炎
2. 用法及び用量	<p>〈気管支喘息〉 通常、成人にはモンテルカストとして10mgを1日1回就寝前に経口投与する。</p> <p>〈アレルギー性鼻炎〉 通常、成人にはモンテルカストとして5～10mgを1日1回就寝前に経口投与する。</p> <div style="border: 1px dashed black; padding: 5px;"> <p>〈用法・用量に関連する使用上の注意〉</p> <ol style="list-style-type: none"> 1. モンテルカストフィルムコーティング錠はモンテルカストチュアブル錠と生物学的に同等ではないため、モンテルカストフィルムコーティング錠5mgとモンテルカストチュアブル錠5mgをそれぞれ相互に代用しないこと。 2. 気管支喘息及びアレルギー性鼻炎を合併し本剤を気管支喘息の治療のために用いる成人患者には、モンテルカストとして10mgを1日1回就寝前に経口投与すること。 </div>
<p>3. 臨床成績</p> <p>(1) 臨床データパッケージ</p> <p>(2) 臨床効果</p> <p>(3) 臨床薬理試験</p> <p>(4) 探索的試験</p> <p>(5) 検証的試験</p> <ol style="list-style-type: none"> 1) 無作為化並行用量反応試験 2) 比較試験 3) 安全性試験 4) 患者・病態別試験 <p>(6) 治療的使用</p> <ol style="list-style-type: none"> 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) 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 	該当資料なし

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	ロイコトリエン受容体拮抗剤 プラナルカスト水和物
2. 薬理作用 (1) 作用部位・作用機序 ⁴⁾ (2) 薬効を裏付ける試験成績 (3) 作用発現時間・持続時間	モンテルカストナトリウムは抗アレルギー薬である。アレルギーのメディエーターの1つであるロイコトリエン (LT) の受容体には、cysLT1 受容体と cysLT2 受容体があるが、モンテルカストナトリウムは cysLT1 受容体遮断薬である。 該当資料なし 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
- (2) 最高血中濃度到達時間
- (3) 臨床試験で確認された血中濃度³⁾

該当資料なし

「VII. 薬物動態に関する項目 1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」を参照

【モンテルカスト錠 5mg 「日新」】

モンテルカスト錠 5mg 「日新」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 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、モンテルカスト錠 10mg 「日新」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。

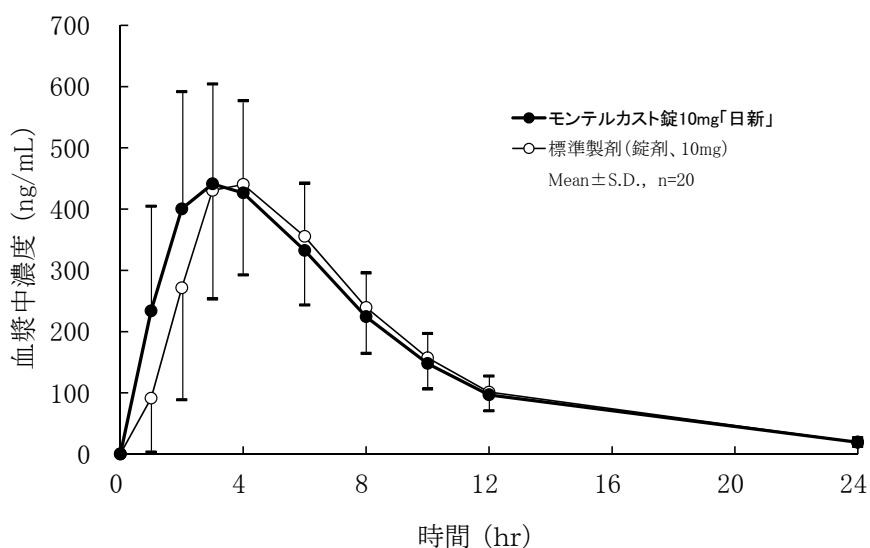
【モンテルカスト錠 10mg 「日新」】

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成 9 年 12 月 22 日付医薬審第 487 号（一部改正：平成 24 年 2 月 29 日付薬食審査発 0229 第 10 号）

モンテルカスト錠 10mg 「日新」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（モンテルカストとして 10mg）健康成人男子に絶食時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、両製剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
モンテルカスト錠 10mg 「日新」	3918±991	513±134	3.1±1.3	4.9±0.6
標準製剤 (錠剤、10mg)	3782±822	499±127	3.8±1.2	4.7±0.5

(Mean±S. D., n=20)



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。

<p>(4) 中毒域</p> <p>(5) 食事・併用薬の影響</p> <p>(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</p>	<p>該当資料なし</p> <p>「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 7. 相互作用」を参照 食事の有無にかかわらず投与できる。 （「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14. 適用上の注意」を参照）</p> <p>該当資料なし</p>
<p>2. 薬物速度論的パラメータ</p> <p>(1) 解析方法</p> <p>(2) 吸収速度定数</p> <p>(3) バイオアベイラビリティ</p> <p>(4) 消失速度定数</p> <p>(5) クリアランス</p> <p>(6) 分布容積</p> <p>(7) 血漿蛋白結合率⁴⁾</p>	<p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」を参照</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>99.6%（ヒト血漿）</p>
<p>3. 吸収</p>	<p>該当資料なし</p>
<p>4. 分布</p> <p>(1) 血液－脳関門通過性</p> <p>(2) 血液－胎盤関門通過性</p> <p>(3) 乳汁への移行性</p> <p>(4) 髄液への移行性</p> <p>(5) その他の組織への移行性</p>	<p>該当資料なし</p> <p>「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与(1)」を参照</p> <p>「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与(2)」を参照</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p>
<p>5. 代謝</p> <p>(1) 代謝部位及び代謝経路</p> <p>(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種⁴⁾</p> <p>(3) 初回通過効果の有無及びその割合</p> <p>(4) 代謝物の活性の有無及び比率</p> <p>(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ</p>	<p>該当資料なし</p> <p>ヒトにおける主要代謝物は側鎖メチル基の水酸化体及びベンジル位メチレン基の水酸化体である。これらの代謝物の生成にはそれぞれチトクローム P450 (CYP) の分子種である CYP2C8/2C9 及び 3A4 が関与しており、CYP2C8 がモンテルカストの主要代謝酵素であった。更に側鎖メチル基の水酸化体はカルボン酸体まで酸化的代謝を受ける。</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p>
<p>6. 排泄</p> <p>(1) 排泄部位及び経路⁴⁾</p> <p>(2) 排泄率</p> <p>(3) 排泄速度</p>	<p>主に糞中</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p>

7. トランスポーターに関する情報	該当資料なし
8. 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	該当記載事項なし						
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	<div style="border: 1px solid red; padding: 5px;"> <p>次の患者には投与しないこと 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者</p> </div>						
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	「V. 治療に関する項目」を参照すること。						
5. 慎重投与内容とその理由	該当記載事項なし						
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	<p>(1) 本剤は、喘息の悪化時ばかりでなく、喘息が良好にコントロールされている場合でも継続して服用するよう、喘息患者に十分説明しておくこと。</p> <p>(2) 本剤は気管支拡張剤、ステロイド剤等と異なり、すでに起こっている喘息発作を緩解する薬剤ではないので、このことは患者に十分説明しておく必要がある。</p> <p>(3) 気管支喘息患者に本剤を投与中、大発作をみた場合は、気管支拡張剤あるいはステロイド剤を投与する必要がある。</p> <p>(4) 長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は十分な管理下で徐々に行うこと。</p> <p>(5) 本剤投与によりステロイド維持量を減量し得た患者で、本剤の投与を中止する場合は、原疾患再発のおそれがあるので注意すること。</p> <p>(6) 本剤との因果関係は明らかではないが、うつ病、自殺念慮、自殺及び攻撃的行動を含む精神症状が報告されているので、患者の状態を十分に観察すること（「その他の注意」の項参照）。</p> <p>(7) 本剤を含めロイコトリエン拮抗剤使用時に好酸球性多発血管炎性肉芽腫様様の血管炎を生じたとの報告がある。これらの症状は、おおむね経口ステロイド剤の減量・中止時に生じている。本剤使用時は、特に好酸球数の推移及びしびれ、四肢脱力、発熱、関節痛、肺の浸潤影等の血管炎症状に注意すること。</p> <p>(8) 本剤投与により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。</p>						
7. 相互作用 (1) 併用禁忌とその理由 (2) 併用注意とその理由	<p>本剤は、主として薬物代謝酵素チトクローム P450 (CYP) 2C8/2C9 及び 3A4 で代謝される。</p> <p>該当記載事項なし</p> <p>併用に注意すること</p> <table border="1" data-bbox="491 1783 1425 1933"> <thead> <tr> <th>薬剤名等</th> <th>臨床症状・措置方法</th> <th>機序・危険因子</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>フェノバルビタール</td> <td>本剤の作用が減弱するおそれがある。</td> <td>フェノバルビタールが CYP3A4 を誘導し、本剤の代謝が促進される。</td> </tr> </tbody> </table>	薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子	フェノバルビタール	本剤の作用が減弱するおそれがある。	フェノバルビタールが CYP3A4 を誘導し、本剤の代謝が促進される。
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子					
フェノバルビタール	本剤の作用が減弱するおそれがある。	フェノバルビタールが CYP3A4 を誘導し、本剤の代謝が促進される。					

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	<p>(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。海外の市販後において、妊娠中に本剤を服用した患者から出生した新生児に先天性四肢奇形がみられたとの報告がある。これらの妊婦のほとんどは妊娠中、他の喘息治療薬も服用していた。本剤とこれらの事象の因果関係は明らかにされていない。〕</p> <p>(2) 授乳中の婦人に投与する場合は慎重に投与すること。〔動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。〕</p>
11. 小児等への投与	<p><気管支喘息></p> <p>(1) 6歳以上の小児に対しては、モンテルカストチュアブル錠 5mg を1日1回就寝前に投与すること。</p> <p>(2) 1歳以上6歳未満の小児に対しては、モンテルカスト細粒 4mg を1日1回就寝前に投与すること。</p> <p>(3) 1歳未満の乳児、新生児、低出生体重児に対するモンテルカスト製剤の安全性は確立していない。〔国内でのモンテルカスト製剤の使用経験がない。〕</p> <p><アレルギー性鼻炎></p> <p>小児等に対するモンテルカスト製剤の安全性は確立していない。〔国内でのモンテルカスト製剤の使用経験がない。〕</p>
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	該当記載事項なし
13. 過量投与	該当記載事項なし
14. 適用上の注意	<p>(1) 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）。</p> <p>(2) 食事の有無にかかわらず投与できる。</p>
15. その他の注意	<p>プラセボ対照臨床試験 41 試験を対象に統合解析を行った結果、本剤投与群 9,929 例中 1 例において自殺念慮が認められたのに対して、プラセボ群 7,780 例において自殺念慮は認められなかった。</p> <p>また、プラセボ対照臨床試験 46 試験を対象に統合解析を行った結果、行動変化に関連する事象（不眠、易刺激性等）が、本剤投与群 11,673 例中 319 例（2.73%）、プラセボ群 8,827 例中 200 例（2.27%）において認められたが、統計学的な有意差は認められなかった。</p>
16. その他	該当しない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

<p>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 (3) 安全性薬理試験 (4) その他の薬理試験</p>	該当資料なし
<p>2. 毒性試験 (1) 単回投与毒性試験 (2) 反復投与毒性試験 (3) 生殖発生毒性試験 (4) その他の特殊毒性</p>	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：該当しない 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（安定性試験結果に基づく）									
3. 貯法・保存条件	遮光保存、気密容器									
4. 薬剤取扱い上の注意点 (1) 薬局での取り扱い上の留意点について (2) 薬剤交付時の取り扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等） (3) 調剤時の留意点について	保管方法 (1) 使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること。 (2) 開封後は湿気を避けて保存すること。 「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法(1)、(2)、14. 適用上の注意」を参照 「X. 管理的事項に関する項目 4. (1)」を参照 患者向医薬品ガイド：有り くすりのしおり：有り 特になし									
5. 承認条件等	該当しない									
6. 包装	錠 5mg P T P 包装：100 錠 錠 10mg P T P 包装：28 錠 (14 錠×2)、100 錠、140 錠 (14 錠×10)、500 錠									
7. 容器の材質	【P T P 製品】 P T P 包装：ポリ塩化ビニル、アルミニウム ピロー包装：ポリエチレンラミネートアルミニウム 化粧箱：紙									
8. 同一成分・同効薬	同一成分薬：キプレス錠 5mg・10mg（杏林） シングレア錠 5mg・10mg（MSD） 同 効 薬：プラシルカスト水和物									
9. 国際誕生年月日	不明									
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	<table border="1"> <thead> <tr> <th>販売名</th> <th>製造販売承認年月日</th> <th>承認番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>モンテルカスト錠 5mg「日新」</td> <td>2016年8月15日</td> <td>22800AMX00488000</td> </tr> <tr> <td>モンテルカスト錠 10mg「日新」</td> <td>2016年8月15日</td> <td>22800AMX00489000</td> </tr> </tbody> </table>	販売名	製造販売承認年月日	承認番号	モンテルカスト錠 5mg「日新」	2016年8月15日	22800AMX00488000	モンテルカスト錠 10mg「日新」	2016年8月15日	22800AMX00489000
販売名	製造販売承認年月日	承認番号								
モンテルカスト錠 5mg「日新」	2016年8月15日	22800AMX00488000								
モンテルカスト錠 10mg「日新」	2016年8月15日	22800AMX00489000								
11. 薬価基準収載年月日	<table border="1"> <thead> <tr> <th>販売名</th> <th>薬価基準収載年月日</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>モンテルカスト錠 5mg「日新」</td> <td>2016年12月9日</td> </tr> <tr> <td>モンテルカスト錠 10mg「日新」</td> <td>2016年12月9日</td> </tr> </tbody> </table>	販売名	薬価基準収載年月日	モンテルカスト錠 5mg「日新」	2016年12月9日	モンテルカスト錠 10mg「日新」	2016年12月9日			
販売名	薬価基準収載年月日									
モンテルカスト錠 5mg「日新」	2016年12月9日									
モンテルカスト錠 10mg「日新」	2016年12月9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	2016年11月16日付 効能・効果、用法・用量を追加。 「気管支喘息」																									
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、投薬期間に関する制限は定められていない。																									
16. 各種コード	<table border="1" data-bbox="491 685 1425 983"> <thead> <tr> <th data-bbox="491 685 887 786">販売名</th> <th data-bbox="887 685 1054 786">HOT 番号 (9桁)</th> <th data-bbox="1054 685 1257 786">厚生労働省 薬価基準収載 医薬品コード</th> <th data-bbox="1257 685 1425 786">レセプト 電算コード</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="491 786 887 913" rowspan="2">モンテルカスト錠 5mg「日新」</td> <td data-bbox="887 786 1054 913" rowspan="2">125194401</td> <td data-bbox="1054 786 1257 831">統一名</td> <td data-bbox="1257 786 1425 831">統一名</td> </tr> <tr> <td data-bbox="1054 831 1257 875">4490026F3012</td> <td data-bbox="1257 831 1425 875">622616500</td> </tr> <tr> <td data-bbox="491 913 887 983"></td> <td data-bbox="887 913 1054 983"></td> <td data-bbox="1054 875 1257 920">個別</td> <td data-bbox="1257 875 1425 920">個別</td> </tr> <tr> <td data-bbox="491 920 887 983"></td> <td data-bbox="887 920 1054 983"></td> <td data-bbox="1054 920 1257 983">4490026F3276</td> <td data-bbox="1257 920 1425 983">622519401</td> </tr> <tr> <td data-bbox="491 983 887 1016">モンテルカスト錠 10mg「日新」</td> <td data-bbox="887 983 1054 1016">125195101</td> <td data-bbox="1054 983 1257 1016">4490026F2296</td> <td data-bbox="1257 983 1425 1016">622519501</td> </tr> </tbody> </table>				販売名	HOT 番号 (9桁)	厚生労働省 薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード	モンテルカスト錠 5mg「日新」	125194401	統一名	統一名	4490026F3012	622616500			個別	個別			4490026F3276	622519401	モンテルカスト錠 10mg「日新」	125195101	4490026F2296	622519501
販売名	HOT 番号 (9桁)	厚生労働省 薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード																							
モンテルカスト錠 5mg「日新」	125194401	統一名	統一名																							
		4490026F3012	622616500																							
		個別	個別																							
		4490026F3276	622519401																							
モンテルカスト錠 10mg「日新」	125195101	4490026F2296	622519501																							
17. 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。																									

XI. 文献

1. 引用文献	1) 日新製薬株式会社 社内資料 (安定性) 2) 日新製薬株式会社 社内資料 (無包装安定性) 3) 日新製薬株式会社 社内資料 (生物学的同等性) 4) 第十七改正日本薬局方解説書, C-5593, 廣川書店 (2016)
2. その他の参考文献	該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	該当資料なし
2. 海外における臨床支援情報	該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料	該当資料なし
----------	--------