

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2013に準拠して作成

<p>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</p> <p>日本薬局方 モンテルカストナトリウム錠 モンテルカスト錠5mg「YD」 モンテルカスト錠10mg「YD」 MONTELUKAST TABLETS</p>	<p>ロイコトリエン受容体拮抗剤 気管支喘息治療剤</p> <p>日本薬局方 モンテルカストナトリウムチュアブル錠 モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」 MONTELUKAST CHEWABLE TABLETS</p> <p>日本薬局方 モンテルカストナトリウム顆粒 モンテルカスト細粒4mg「YD」 MONTELUKAST FINE GRANULES</p>
--	--

剤形	錠5mg、錠10mg：フィルムコーティング錠 チュアブル錠5mg：チュアブル錠 細粒4mg：細粒剤		
製剤の規制区分	該当しない		
規格・含量	錠5mg、チュアブル錠5mg：1錠中、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、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）を含有 細粒4mg：0.5g中、モンテルカストナトリウム4.16mg（モンテルカストとして4mg）を含有する。		
一般名	和名：モンテルカストナトリウム（JAN） 洋名：Montelukast Sodium（JAN）		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日		錠5mg、錠10mg	チュアブル錠5mg、細粒
	製造販売承認年月日	平成28年8月15日	平成29年2月15日
	薬価基準収載年月日	平成28年12月9日	平成29年6月16日
	発売年月日	平成28年12月9日	平成29年6月16日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：株式会社陽進堂		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	株式会社陽進堂 お客様相談室 0120-647-734 医療関係者向けホームページ https://www.yoshindo.co.jp		

本IFは2019年4月改訂（第3版）（モンテルカスト錠5mg「YD」、錠10mg「YD」）、2019年4月改訂（第3版）（モンテルカストチュアブル錠5mg「YD」）、2019年4月改訂（第3版）（モンテルカスト細粒4mg「YD」）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.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、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 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、PDF 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場合の 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情報として適切か審査・検討することとした。

平成 20 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（PDF）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、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、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。

(2013年4月改訂)

目 次

I.	概要に関する項目	6
1.	開発の経緯	
2.	製品の治療学的・製剤学的特性	
II.	名称に関する項目	7
1.	販売名	
2.	一般名	
3.	構造式又は示性式	
4.	分子式及び分子量	
5.	化学名（命名法）	
6.	慣用名、別名、略号、記号番号	
7.	C A S登録番号	
III.	有効成分に関する項目	9
1.	物理化学的性質	
2.	有効成分の各種条件下における安定性	
3.	有効成分の確認試験法	
4.	有効成分の定量法	
I V.	製剤に関する項目	10
1.	剤 形	
2.	製剤の組成	
3.	懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	
4.	製剤の各種条件下における安定性	
5.	調製法及び溶解後の安定性	
6.	他剤との配合変化（物理化学的変化）	
7.	溶出性	
8.	生物学的試験法	
9.	製剤中の有効成分の確認試験法	
10.	製剤中の有効成分の定量法	
11.	力価	
12.	混入する可能性のある夾雑物	
13.	注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	
14.	その他	
V.	治療に関する項目	21
1.	効能又は効果	
2.	用法及び用量	
3.	臨床成績	
V I.	薬効薬理に関する項目	23
1.	薬理学的に関連のある化合物又は化合物群	
2.	薬理作用	
V II.	薬物動態に関する項目	24
1.	血中濃度の推移・測定法	
2.	薬物速度論的パラメータ	
3.	吸 収	
4.	分 布	
5.	代 謝	
6.	排 泄	
7.	トランスポーターに関する情報	

8.	透析等による除去率	
V III.	安全性（使用上の注意等）に関する項目	32
1.	警告内容とその理由	
2.	禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	
3.	効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	
4.	用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	
5.	慎重投与内容とその理由	
6.	重要な基本的注意とその理由及び処置方法	
7.	相互作用	
8.	副作用	
9.	高齢者への投与	
10.	妊婦、産婦、授乳婦等への投与	
11.	小児等への投与	
12.	臨床検査結果に及ぼす影響	
13.	過量投与	
14.	適用上の注意	
15.	その他の注意	
16.	その他	
I X.	非臨床試験に関する項目	39
1.	薬理試験	
2.	毒性試験	
X.	管理的事項に関する項目	40
1.	規制区分	
2.	有効期間又は使用期限	
3.	貯法・保存条件	
4.	薬剤取扱い上の注意点	
5.	承認条件等	
6.	包装	
7.	容器の材質	
8.	同一成分・同効薬	
9.	国際誕生年月日	
10.	製造販売承認年月日及び承認番号	
11.	薬価基準収載年月日	
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	
13.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	
14.	再審査期間	
15.	投薬期間制限医薬品に関する情報	
16.	各種コード	
17.	保険給付上の注意	
X I.	文献	43
1.	引用文献	
2.	その他の参考文献	
X II.	参考資料	43
1.	主な外国での発売状況	
2.	海外における臨床支援情報	
X III.	備考	43
	その他の関連資料	

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

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、本薬はcysLT1受容体遮断薬であり、気管支喘息やアレルギー性鼻炎に用いられる。

モンテルカスト錠5mg「YD」及びモンテルカスト錠10mg「YD」は後発医薬品として開発を企画し、薬食発1121第2号(平成26年11月21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、平成28年8月に承認を得て、平成28年12月発売に至った。

モンテルカストチュアブル錠5mg「YD」及びモンテルカスト細粒4mg「YD」は後発医薬品として開発を企画し、薬食発1121第2号(平成26年11月21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、平成29年2月に承認を得て、平成29年6月発売に至った。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

小児用剤は、チュアブル錠と細粒剤の2剤形から選択できる。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

モンテルカスト錠 5mg「YD」
モンテルカスト錠 10mg「YD」
モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」
モンテルカスト細粒 4mg「YD」

(2) 洋名

MONTELUKAST TABLETS 5mg
MONTELUKAST TABLETS 10mg
MONTELUKAST CHEWABLE TABLETS 5mg
MONTELUKAST FINE GRANULES 4mg

(3) 名称の由来

成分名

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

モンテルカストナトリウム (JAN)

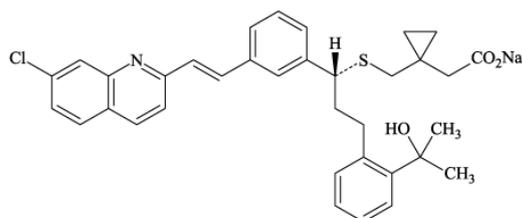
(2) 洋名 (命名法)

Montelukast Sodium (JAN)

(3) ステム

ロイコトリエン受容体拮抗薬 (-lukast)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₃₅H₃₅ClNNaO₃S

分子量：608.17

5. 化学名 (命名法)

Monosodium (1-[[[(1*R*)-1-(3-[(1*E*)-2-(7-chloroquinolin-2-yl)ethenyl]phenyl)-3-[2-(1-hydroxy-1-methylethyl)phenyl]propyl)sulfanyl]-methyl]cyclopropyl)acetate

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

7. CAS登録番号

151767-02-1 (Montelukast Sodium)

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～微黄白色の粉末である。
光によって黄色に変化する。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

吸湿性である。

(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

(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(ペースト法)

4. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

I V. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	モンテルカスト錠 5mg「YD」		モンテルカスト錠 10mg「YD」		モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」		モンテルカスト細粒 4mg「YD」	
剤形	フィルムコーティング錠				チュアブル錠		細粒剤	
色調	淡橙色		淡橙色		うすい赤色		白色	
重量	103.15mg		205mg		300mg			
形状	表面		直径： 約6.6mm		直径： 約8.1mm		直径： 約9.5mm	/
	裏面							
	側面		厚さ 約3.1mm		厚さ 約4.1mm		厚さ 約4.5mm	

モンテルカスト錠 5mg「YD」

淡橙色のフィルムコーティング錠である。

モンテルカスト錠 10mg「YD」

淡橙色のフィルムコーティング錠である。

モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」

うすい赤色の円形の素錠である。

モンテルカスト細粒 4mg「YD」

白色の細粒剤である。

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

モンテルカスト錠 5mg「YD」

YD228 (PTP)

モンテルカスト錠 10mg「YD」

YD229 (PTP)

モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」

YD157 (PTP、錠剤)

モンテルカスト細粒 4mg「YD」

YD193 (PTP)

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

モンテルカスト錠 5mg「YD」

1錠中、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)を含有する。

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

1錠中、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) を含有する。

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

1錠中、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) を含有する。

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

0.5g 中、モンテルカストナトリウム 4.16mg (モンテルカストとして 4mg) を含有する。

(2) 添加物

モンテルカスト錠 5mg「Y D」

添加物として、D-マンニトール、無水ケイ酸、ヒドロキシプロピルセルロース、セルロース、リン酸水素Ca、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、プロピレングリコール、タルク、酸化チタン、三二酸化鉄を含有する。

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

添加物として、D-マンニトール、無水ケイ酸、ヒドロキシプロピルセルロース、セルロース、リン酸水素Ca、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、プロピレングリコール、タルク、酸化チタン、三二酸化鉄を含有する。

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

添加物として、D-マンニトール、ヒプロメロース酢酸エステルコハク酸エステル、クロスカルメロースNa、ヒドロキシプロピルセルロース、三二酸化鉄、香料、アスパルテーム (L-フェニルアラニン化合物)、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg を含有する。

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

添加物として、D-マンニトール、ヒプロメロース、ステアリン酸Mg を含有する。

(3) その他

該当記載事項なし

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⁾

モンテルカスト錠 5mg「Y D」

<加速試験>

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、モンテルカスト錠 5mg「Y D」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。

保存形態：PTP包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.8	99.4

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

<加速試験>

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、モンテルカスト錠 10mg「Y D」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。

保存形態：P T P包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.1	99.4

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

<加速試験>

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、モンテルカストチュアブル錠5mg「Y D」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。

保存形態：P T P包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.2	99.8

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

<加速試験>

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、モンテルカスト細粒4mg「Y D」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。

保存形態：分包包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.7	97.9

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)

該当資料なし

7. 溶出性²⁾

溶出挙動における類似性

モンテルカスト錠 5mg「Y D」

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移、測定法」を参照

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

「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日付医薬審査発第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

試験方法

装置 : 日本薬局方一般試験法溶出試験第2法(パドル法)

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5℃

回転数 : 50回転

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

水=日本薬局方精製水

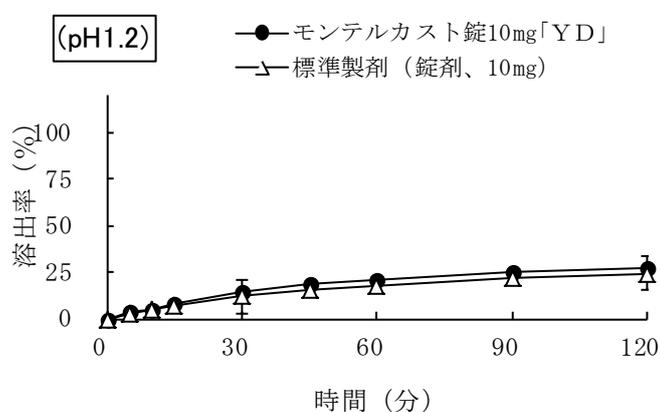
判定基準 : 【pH1.2、pH4.0、pH6.8】

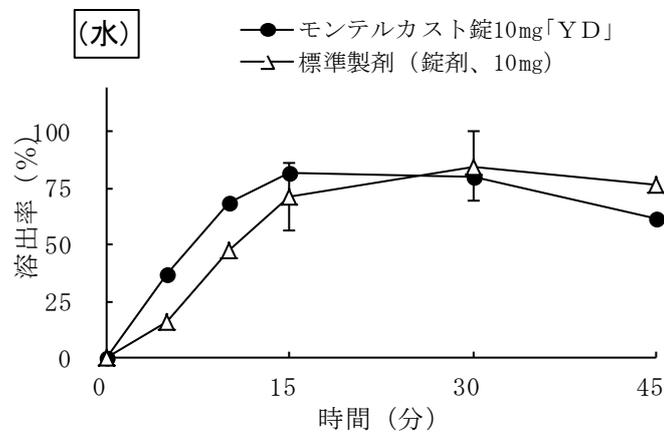
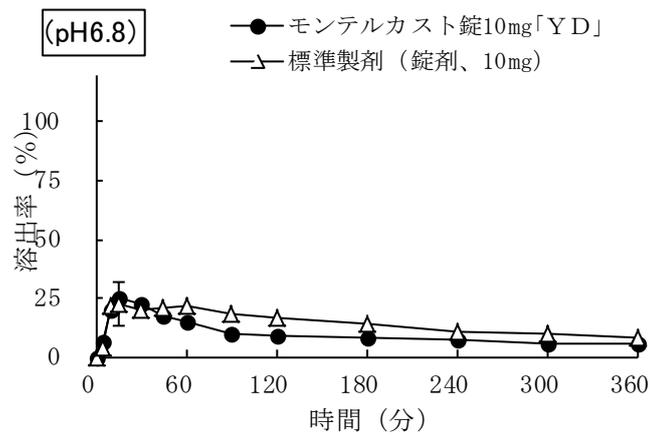
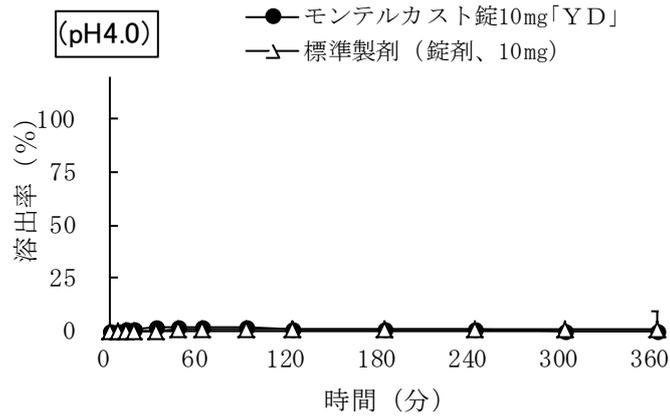
規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%に達しない場合、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又はf2関数の値が53以上である。ただし、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が10%以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にある。

【水】

標準製剤が15分～30分に平均85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が60%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関数の値が42以上である。

試験結果 :





モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」

「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日付医薬審査発第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

試験方法

装置 : 日本薬局方一般試験法溶出試験第2法(パドル法)

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5℃

回転数 : 50回転

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

水 = 日本薬局方精製水

pH1.2 (日本薬局方溶出試験第1液) + 0.01% (M/V) ポリソルベート 80

pH4.0 (薄めた McIlvaine の緩衝液) + 0.01% (M/V) ポリソルベート 80

pH6.8 (日本薬局方溶出試験第2液) + 0.01% (M/V) ポリソルベート 80

判定基準: 【pH1.2、pH4.0、pH6.8、水】

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%に達しない場合、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 $\pm 9\%$ の範囲にあるか、又は f_2 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 $\pm 9\%$ の範囲にある。

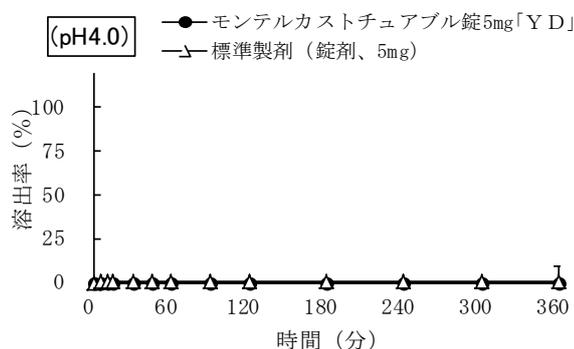
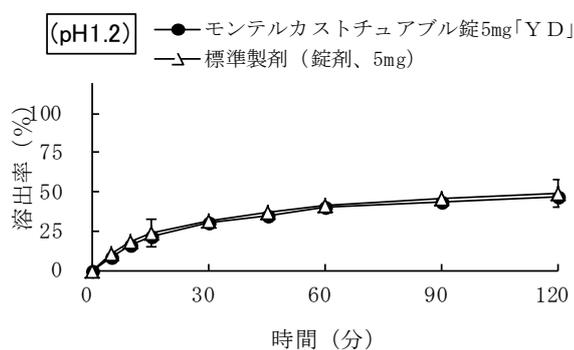
【pH1.2 + 0.01% (M/V) ポリソルベート 80、pH4.0 + 0.01% (M/V) ポリソルベート 80】

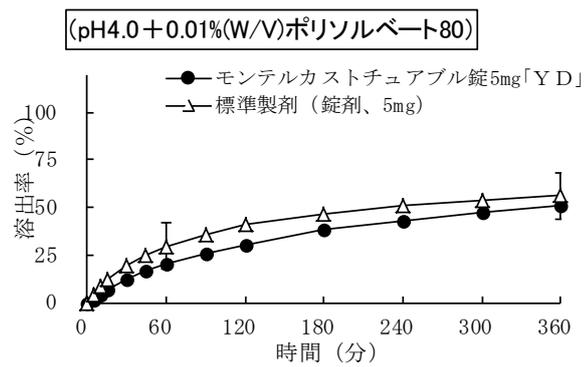
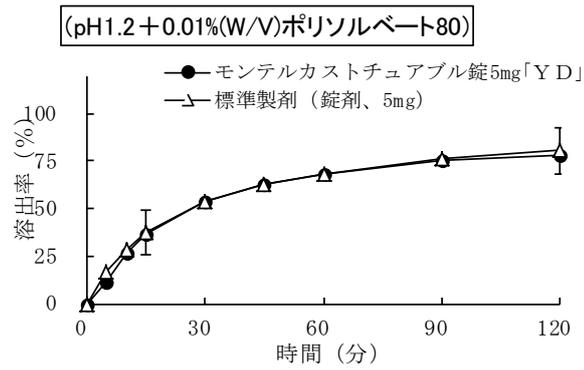
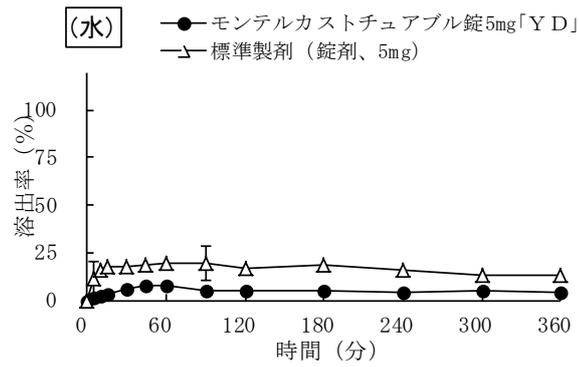
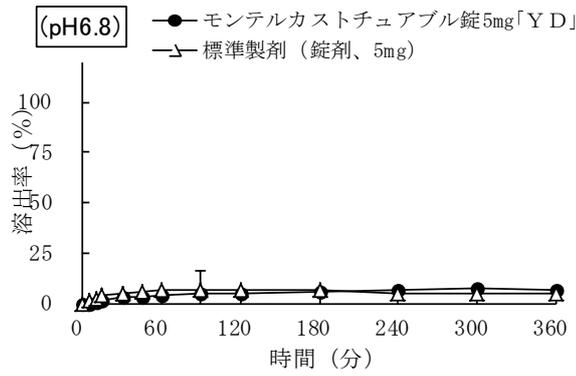
規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%以上85%に達しない場合、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が46以上である。

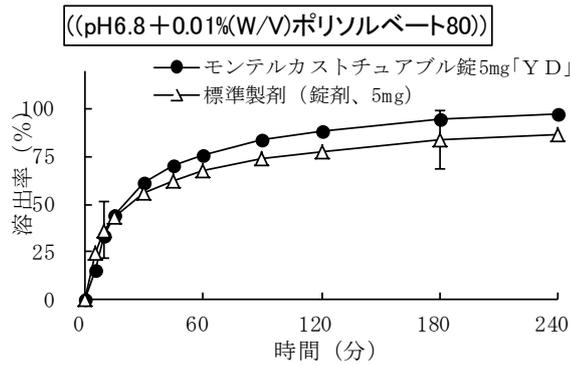
【pH6.8 + 0.01% (M/V) ポリソルベート 80】

標準製剤が30分～規定された時間に平均85%以上溶出する場合、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 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が42以上である。

試験結果:







水においては、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 \pm 9%の範囲になく非類似であった。

一部の試験条件で溶出挙動の判定基準に適合しなかったが、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」で「溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない」と記載されている。健康成人男子を被験者として生物学的同等性試験を実施した結果、モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」は、標準製剤との生物学的同等性が確認されている。

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

「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日付医薬審査発第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

試験方法

装置 : 日本薬局方一般試験法溶出試験第2法(パドル法)

試験液量 : 900mL

温度 : 37 \pm 0.5 $^{\circ}$ C

回転数 : 50回転

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

水=日本薬局方精製水

pH1.2 ポリソルベート 80 添加 0.1% (M/V)

pH4.0 ポリソルベート 80 添加 0.1% (M/V)

pH6.8 ポリソルベート 80 添加 0.1% (M/V)

判定基準 : 【pH1.2】

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%に達しない場合、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 \pm 12%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 46 以上である。

【pH4.0、pH6.8、pH4.0 ポリソルベート 80 添加 0.1% (M/V)】

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%に達しない場合、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 \pm 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 \pm 9 %の範囲にある。

【水】

標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合、試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にある。

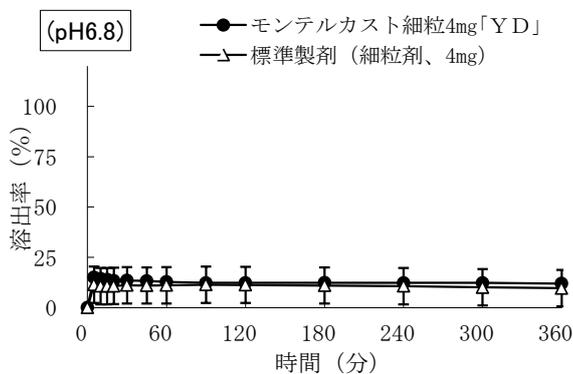
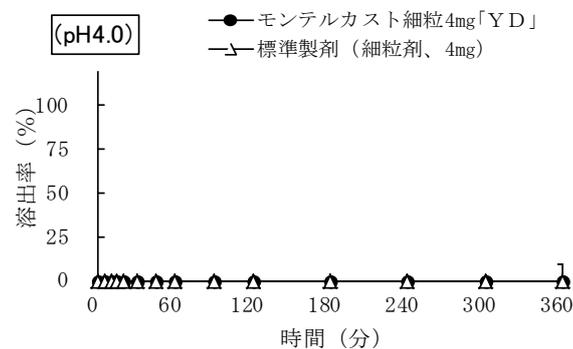
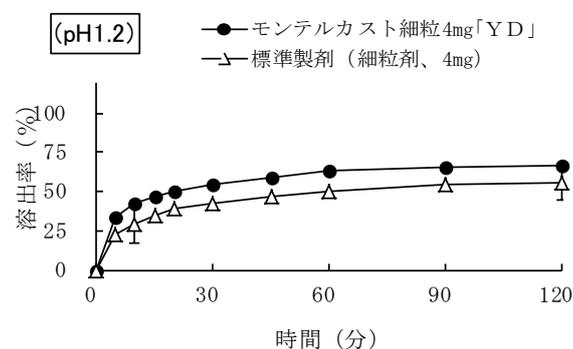
【pH1.2 ポリソルベート 80 添加 0.1% (M/V)】

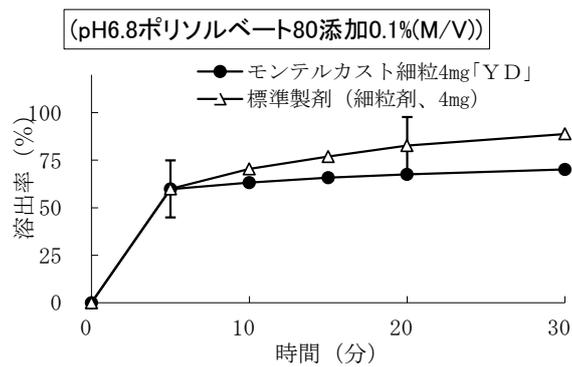
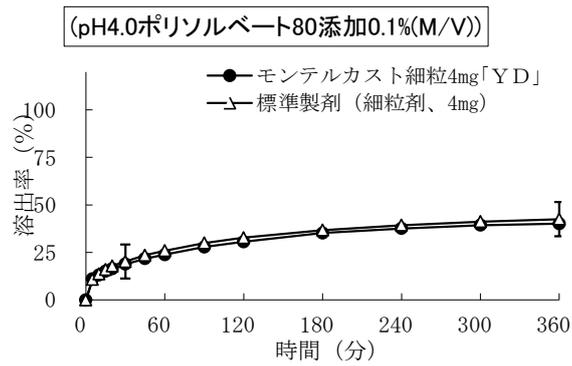
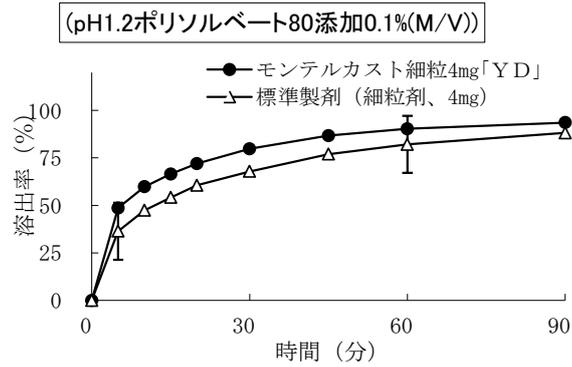
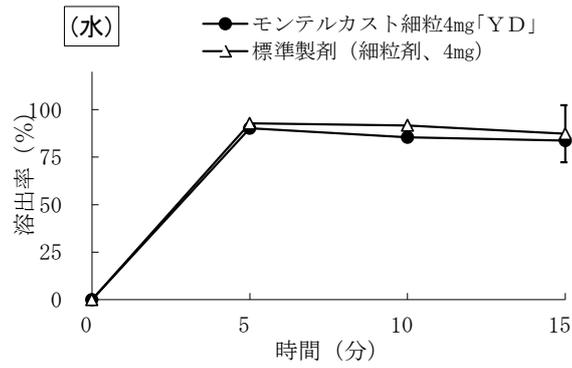
標準製剤が 30 分～規定された時間に平均 85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。

【pH6.8 ポリソルベート 80 添加 0.1% (M/V)】

標準製剤が 15 分～30 分に平均 85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が 60%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 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。

試験結果：





モンテルカスト錠 5mg「YD」

モンテルカスト錠 5mg「YD」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。

溶出規格

表示量	試験液	回転数	測定時間	溶出率
5mg 錠	ラウリル硫酸ナトリウム溶液 (1→200)	50 回転	20 分	85%以上

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

モンテルカスト錠 10mg「Y D」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。

溶出規格

表示量	試験液	回転数	測定時間	溶出率
10mg 錠	ラウリル硫酸ナトリウム 溶液 (1→200)	50 回転	20 分	85%以上

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」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チュアブル錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

溶出規格

表示量	試験液	回転数	測定時間	溶出率
5mg チュアブル錠	ラウリル硫酸ナトリウム 溶液 (1→200)	50 回転	20 分	85%以上

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」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顆粒の溶出規格に適合していることが確認されている。

溶出規格

表示量	試験液	回転数	測定時間	溶出率
4mg 顆粒	ラウリル硫酸ナトリウム 溶液 (1→200)	50 回転	15 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

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

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・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

モンテルカスト錠 5mg「Y D」、モンテルカスト錠 10mg「Y D」
気管支喘息、アレルギー性鼻炎

※効能又は効果に関連する使用上の注意

該当記載なし

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」、モンテルカスト細粒 4mg「Y D」
気管支喘息

※効能又は効果に関連する使用上の注意

該当記載なし

2. 用法及び用量

モンテルカスト錠 5mg「Y D」、モンテルカスト錠 10mg「Y D」

<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。

<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。

※用法及び用量に関連する使用上の注意

- (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。

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

通常、6歳以上の小児にはモンテルカストとして 5mg を 1 日 1 回就寝前に経口投与する。

※用法及び用量に関連する使用上の注意

- (1)本剤は、口中で溶かすか、噛み砕いて服用すること。
- (2)モンテルカストチュアブル錠はモンテルカストフィルムコーティング錠及びモンテルカスト口腔内崩壊錠と生物学的に同等ではないため、モンテルカストチュアブル錠 5mg とモンテルカストフィルムコーティング錠 5mg 及びモンテルカスト口腔内崩壊錠 5mg をそれぞれ相互に代用しないこと。

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

通常、1歳以上6歳未満の小児にはモンテルカストとして 4mg（本剤1包）を 1 日 1 回就寝前に経口投与する。

※用法及び用量に関連する使用上の注意

- (1)体重、年齢、症状等による用量調節をせず、全量を服用すること。
- (2)光に不安定であるため、開封後直ちに（15分以内）に服用すること。（「適用上の注意」の項参照）

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(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) 無作為化並行用量反応試験

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

V I . 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薬(プラナルカスト水和物)

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序³⁾

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、本薬は cysLT1 受容体遮断薬であり、気管支喘息やアレルギー性鼻炎に用いられる。

(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

V II. 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²⁾

モンテルカスト錠 5mg「YD」

該当資料なし

モンテルカスト錠 10mg「YD」

約 3.6 時間

モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」

口中溶解後、水で服用した場合：約 2.8 時間

口中溶解後、水なしで服用した場合：約 3.0 時間

咀嚼後、水で服用した場合：約 3.0 時間

咀嚼後、水なしで服用した場合：約 2.7 時間

モンテルカスト細粒 4mg「YD」

約 1.6 時間

(3) 臨床試験で確認された血中濃度²⁾

モンテルカスト錠 5mg「YD」

モンテルカスト錠 5mg「YD」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「YD」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。

試験方法

装置 : 日本薬局方一般試験法溶出試験第 2 法(パドル法)

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5°C

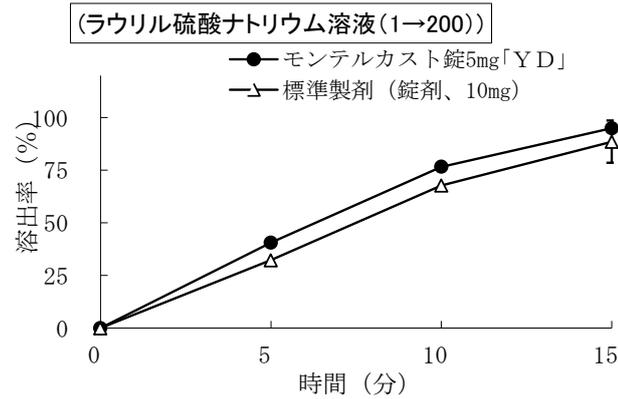
回転数 : 50 回転

試験液 : ラウリル硫酸ナトリウム溶液 (1→200)

判定基準 : 【ラウリル硫酸ナトリウム溶液 (1→200)】

標準製剤が 30 分～規定された時間に平均 85%以上溶出する場合、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 関数の値が 50 以上である。また、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、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。

試験結果：



判定時点での試験製剤の溶出率

判定時点：	15分	平均溶出率：	95.0%								
1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12
96.9%	97.6%	88.3%	97.6%	96.0%	92.6%	97.3%	86.9%	97.4%	94.8%	97.1%	97.2%

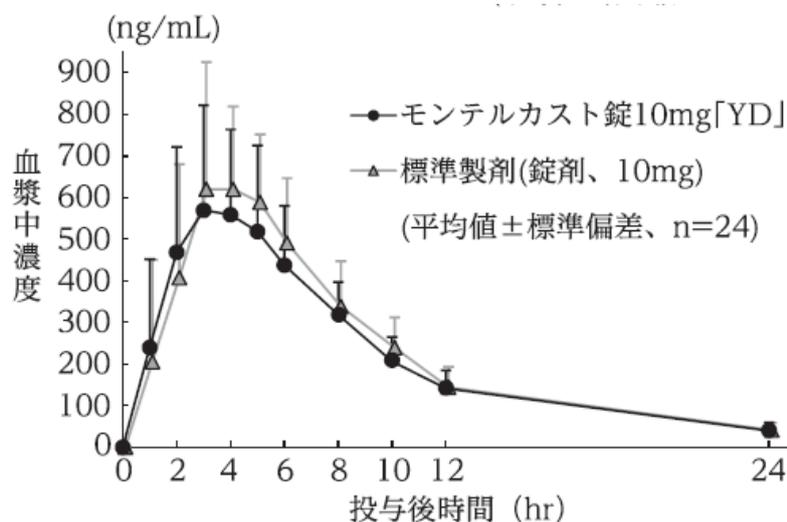
モンテルカスト錠 10mg「YD」

「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日付医薬審査発第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

モンテルカスト錠 10mg「YD」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24名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	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「YD」	5281.69 ±1181.40	722.35 ±212.15	3.6±1.6	5.9±1.1
標準製剤 (錠剤、10mg)	5583.84 ±1295.10	776.41 ±234.50	3.8±1.2	5.7±1.2

(平均値±標準偏差、n=24)



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。

モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」

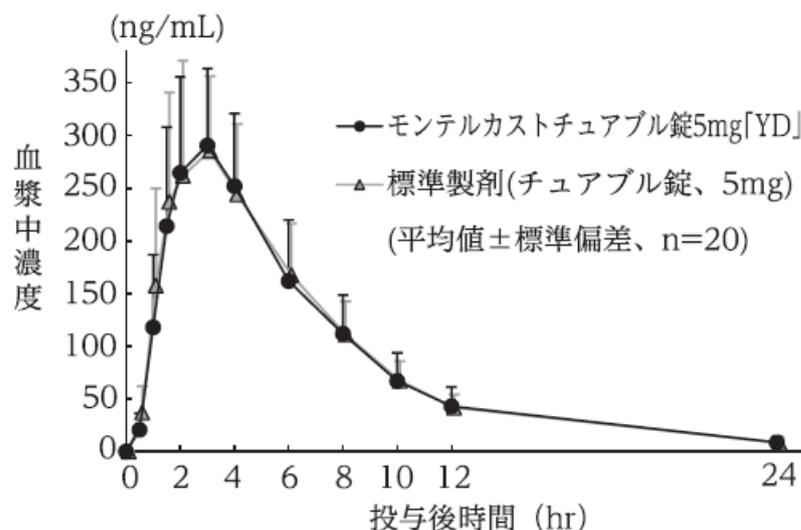
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審査発第487号、平成24年2月29日付薬食審査発0229第10号一部改正)」

(1) 口中溶解後、水で服用した場合

モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」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5mg)、健康成人男子20名に絶食下、口内溶解後、単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	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 チュアブル錠 5mg「YD」	2077.73 ±604.43	309.63 ±72.49	2.75±0.84	4.69±1.09
標準製剤 (チュアブル錠、 5mg)	2097.48 ±469.83	326.54 ±68.79	2.55±0.87	4.69±1.13

(平均値±標準偏差、n=20)



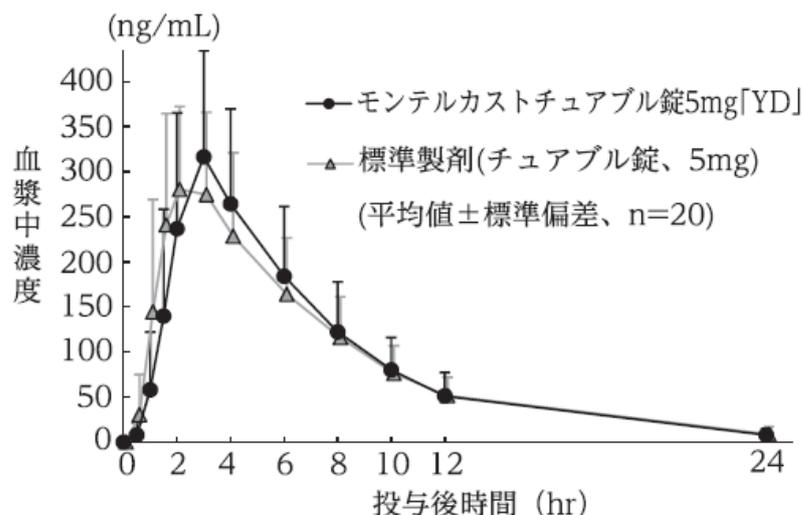
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2) 口中溶解後、水なしで服用した場合

モンテルカストチュアブル錠 5mg「YD」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5mg)、健康成人男子20名に絶食下、口内溶解後、単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
モンテルカスト チュアブル錠 5mg「YD」	2171.45 ±876.88	328.91 ±108.92	3.00±0.56	4.18±0.90
標準製剤 (チュアブル錠、 5mg)	2160.72 ±649.17	339.62 ±70.63	2.50±1.17	4.46±1.06

(平均値±標準偏差、n=20)



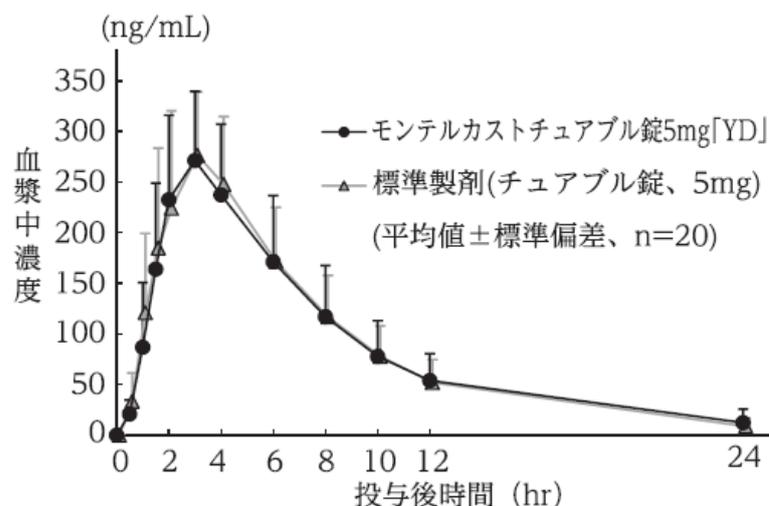
血漿中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) 咀嚼後、水で服用した場合

モンテルカストチュアブル錠 5 mg「YD」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5mg)、健康成人男子 20 名に絶食下、咀嚼後、単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
モンテルカスト チュアブル錠 5mg「YD」	2121.58 ±733.63	286.23 ±62.31	2.95±1.04	5.18±2.94
標準製剤 (チュアブル錠、 5mg)	2134.42 ±598.88	308.24 ±58.13	2.80±0.82	4.34±1.04

(平均値±標準偏差、n=20)



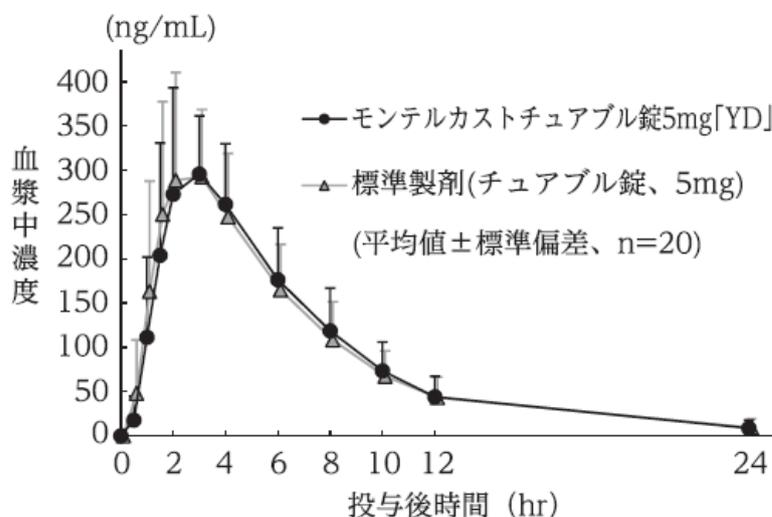
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(4) 咀嚼後、水なしで服用した場合

モンテルカストチュアブル錠5mg「YD」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5mg)、健康成人男子20名に絶食下、咀嚼後、単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	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 チュアブル錠 5mg「YD」	2157.02 ±689.98	323.19 ±80.22	2.65±0.81	4.19±1.55
標準製剤 (チュアブル錠、 5mg)	2149.09 ±671.26	339.86 ±90.64	2.15±0.71	4.49±1.63

(平均値±標準偏差、n=20)



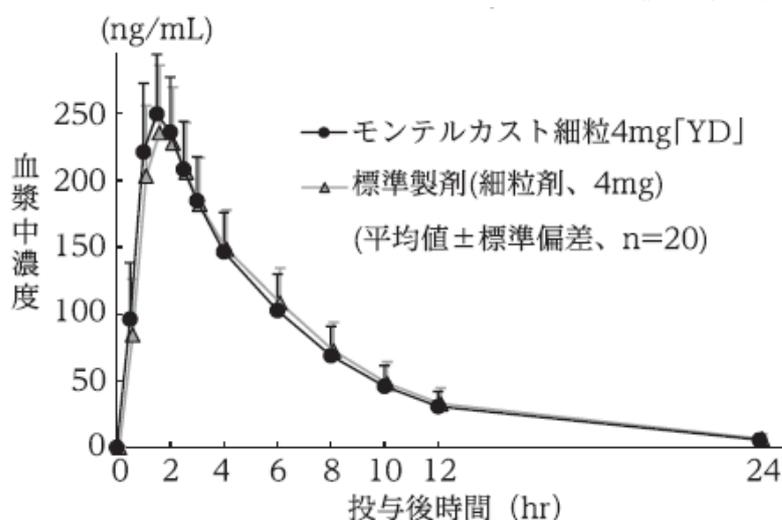
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

モンテルカスト細粒 4mg「YD」

モンテルカスト細粒 4mg「YD」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 包 0.5 g (モンテルカストとして 4mg)、健康成人男子 20 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ (AUC、C_{max}) 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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
モンテルカスト 細粒 4mg「YD」	1546.8 ±314.4	257.0 ±39.5	1.6±0.5	4.5±0.9
標準製剤 (細粒剤、4mg)	1561.2 ±352.5	239.5 ±43.9	1.7±0.4	4.8±0.7

(平均値±標準偏差、n=20)



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

該当資料なし

(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) 解析方法

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³⁾

健康成人における生物学的利用率は、58～67%である。

(4) 消失速度定数²⁾

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

該当資料なし

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

0.12 (hr⁻¹)

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

口中溶解後、水で服用した場合：0.16 (hr⁻¹)

口中溶解後、水なしで服用した場合：0.18 (hr⁻¹)

咀嚼後、水で服用した場合：0.16 (hr⁻¹)

咀嚼後、水なしで服用した場合：0.20 (hr⁻¹)

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

0.16 (hr⁻¹)

(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³⁾

ヒト血漿蛋白結合率は 99.6%であり、生理的な濃度のアルブミン及びα1-糖蛋白質の両方に 99%以上結合する。

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

(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³⁾

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。

(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³⁾

モンテルカストの排泄経路は主に糞中であり、健康成人男性に 400mg を単回経口投与した場合、尿中に未変化体は検出されない。

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

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

V Ⅲ. 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

該当記載なし

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

[禁忌] (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

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当記載なし

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 2. 用法及び用量」を参照。

5. 慎重投与内容とその理由

該当記載なし

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

モンテルカスト錠 5mg「Y D」、モンテルカスト錠 10mg「Y D」

- (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。
- (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。
- (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。
- (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。
- (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。
- (6) モンテルカスト製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）。
- (7) モンテルカスト製剤を含めロイコトリエン拮抗剤使用時に Churg-Strauss 症候群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。
- (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。

重要な基本的注意

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

- (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、患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に十分説明しておくこと。
- (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、保護者又はそれに代わり得る適切な者に十分説明しておく必要がある。

- (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。
- (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。
- (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。
- (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)
- (7) 本剤を含めロイコトリエン拮抗剤使用時に Churg-Strauss 症候群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。
- (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。

重要な基本的注意

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

- (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、患者、保護者又はそれに代わり得る適切な者に十分説明しておくこと。
- (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、保護者又はそれに代わり得る適切な者に十分説明しておく必要がある。
- (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。
- (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。
- (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。
- (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)。
- (7) 本剤を含めロイコトリエン拮抗剤使用時に Churg-Strauss 症候群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。
- (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。
- (9) 小児では一般に自覚症状を訴える能力が劣るので、本剤の投与に際しては、保護者等に対し、患者の状態を十分に観察し、異常が認められた場合には速やかに主治医に連絡する等の適切な処置をするように注意を与えること。

7. 相互作用

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。

(1) 併用禁忌とその理由

該当記載なし

(2) 併用注意とその理由

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
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。

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
1) アナフィラキシー (頻度不明) アナフィラキシー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直ちに投与を中止し適切な処置を行うこと。
2) 血管浮腫 (頻度不明) 血管浮腫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直ちに投与を中止し適切な処置を行うこと。
3) 劇症肝炎、肝炎、肝機能障害、黄疸 (いずれも頻度不明) 劇症肝炎、肝炎、肝機能障害、黄疸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し適切な処置を行うこと。
4) 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 (いずれも頻度不明) 中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群、多形紅斑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し適切な処置を行うこと。
5) 血小板減少 (頻度不明) 血小板減少 (初期症状：紫斑、鼻出血、歯肉出血等の出血傾向) があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

その他の副作用	
次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。	
	頻度不明
過敏症	皮疹、そう痒、蕁麻疹、肝臓の好酸球浸潤
精神神経系	頭痛、傾眠、情緒不安、不眠、幻覚、めまい、感覚異常（しびれ等）、異夢、易刺激性、痙攣、激越、振戦、夢遊症、失見当識、集中力低下、記憶障害、せん妄、強迫性症状
呼吸器	肺好酸球増多症
消化器系	下痢、腹痛、胃不快感、嘔気、胸やけ、嘔吐、便秘、口内炎、消化不良
肝臓	肝機能異常、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、 γ -GTP上昇、総ビリルビン上昇
筋・骨格系	筋痙攣を含む筋痛、関節痛
その他	口渇、尿潜血、血尿、尿糖、浮腫、倦怠感、白血球数増加、尿蛋白、トリグリセリド上昇、出血傾向（鼻出血、紫斑等）、動悸、頻尿、発熱、脱毛、挫傷、脱力、疲労、遺尿

(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

[禁忌](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

重大な副作用

1) アナフィラキシー（頻度不明）

アナフィラキシー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直ちに投与を中止し適切な処置を行うこと。

その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

頻度不明	
過敏症	皮疹、そう痒、蕁麻疹、肝臓の好酸球浸潤

9. 高齢者への投与

該当記載なし

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦、産婦、授乳婦等への投与

モンテルカスト錠 5mg「YD」、モンテルカスト錠 10mg「YD」

(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、妊娠中にモンテ

ルカスト製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。モンテルカスト製剤とこれらの事象の因果関係は明らかにされていない。]

(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。]

妊婦、産婦、授乳婦等への投与

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

(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、妊娠中にモンテルカスト製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。モンテルカスト製剤とこれらの事象の因果関係は明らかにされていない。]

(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。]

妊婦、産婦、授乳婦等への投与

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

(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、妊娠中にモンテルカスト製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。モンテルカスト製剤とこれらの事象の因果関係は明らかにされていない。]

(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。]

注：本剤の承認用法・用量は、1歳以上6歳未満小児に対してモンテルカストとして1日1回4mgである。

11. 小児等への投与

小児等への投与

モンテルカスト錠 5mg「Y D」、モンテルカスト錠 10mg「Y D」

<気管支喘息>

(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。

(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。

(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。]

<アレルギー性鼻炎>

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。]

小児等への投与

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

(1) 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。

(2) 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。)

小児等への投与

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

- (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。
- (2) 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。]

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当記載なし

13. 過量投与

該当記載なし

14. 適用上の注意

適用上の注意

モンテルカスト錠 5mg「Y D」、モンテルカスト錠 10mg「Y D」、
モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

(1) 薬剤交付時

P T P包装の薬剤はP T Pシートから取り出して服用するよう指導すること。(P T P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報告されている)

- (2) 本剤は、食事の有無にかかわらず投与できる。

適用上の注意

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

- (1) 本剤は、食事の有無にかかわらず投与できる。
- (2) 本剤は口に直接入れるか、スプーン1杯程度の柔らかい食物(室温以下)と混ぜて服用することができる。またスプーン1杯(約5mL)の調製ミルク又は母乳(室温以下)と混ぜて服用することもできる。本剤服用後は水などの飲み物を摂取してもよい。
- (3) 本剤は光に不安定であるため、服用の準備ができるまで開封しないこと。柔らかい食物、調製ミルク又は母乳と混ぜた場合も、放置せずに直ちに(15分以内に)服用すること。
- (4) 本剤は光に不安定であるため、再分包しないこと。

15. その他の注意

その他の注意

モンテルカスト錠 5mg「Y D」、モンテルカスト錠 10mg「Y D」

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

他社が実施した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、モンテルカスト製剤投与群 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。

また、他社が実施し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、モンテルカスト製剤投与群 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。

その他の注意

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

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。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。

16. その他

I X. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験(「V I. 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

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

室温保存、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

モンテルカスト錠 5mg「Y D」、モンテルカスト錠 10mg「Y D」

開封後は湿気を避けて保存して下さい。

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

光、湿気を避けて保存してください。

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

特になし

(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）

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

「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。

(3) 調剤時の留意点について

特になし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

モンテルカスト錠 5mg「Y D」

PTP：28錠（14錠×2）

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

PTP：28錠（14錠×2）、100錠（10錠×10）

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

PTP：28錠（14錠×2）、100錠（10錠×10）

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

分包品：0.5g×14包、0.5g×140包

7. 容器の材質

モンテルカスト錠 5mg「Y D」

PTP：ポリプロピレン・環状ポリオレフィンラミネートフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

モンテルカスト錠 10mg「Y D」

PTP：ポリプロピレン・環状ポリオレフィンラミネートフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」

P T P : ポリプロピレン・環状ポリオレフィンラミネートフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」

分包品 : ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルム

8. 同一成分・同効薬

同一成分 : キプレス、シングレア

同効薬 : ロイコトリエン受容体拮抗薬(プラナルカスト水和物)

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

承認年月日

モンテルカスト錠 5mg「Y D」 : 平成 28 年 8 月 15 日

モンテルカスト錠 10mg「Y D」 : 平成 28 年 8 月 15 日

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」 : 平成 29 年 2 月 15 日

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」 : 平成 29 年 2 月 15 日

承認番号

モンテルカスト錠 5mg「Y D」 : 22800AMX00645000

モンテルカスト錠 10mg「Y D」 : 22800AMX00646000

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」 : 22900AMX00285000

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」 : 22900AMX00181000

11. 薬価基準収載年月日

モンテルカスト錠 5mg「Y D」 : 平成 28 年 12 月 9 日

モンテルカスト錠 10mg「Y D」 : 平成 28 年 12 月 9 日

モンテルカストチュアブル錠 5mg「Y D」 : 平成 29 年 6 月 16 日

モンテルカスト細粒 4mg「Y D」 : 平成 29 年 6 月 16 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

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. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は投与期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
モンテルカスト錠 5mg「YD」	125107401	4490026F3012	622510701
モンテルカスト錠 10mg「YD」	125108101	4490026F2016	622510801
モンテルカストチュ アブル錠 5mg「YD」	125464801	4490026F1133	622546401
モンテルカスト細粒 4mg「YD」	125463101	4490026C1064	622546301

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。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) ㈱陽進堂 社内資料：安定性試験
- 2) ㈱陽進堂 社内資料：生物学的同等性試験
- 3) 第十七改正日本薬局方解説書 廣川書店

2. その他の参考文献

X II . 参 考 資 料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

X III . 備 考

その他の関連資料
該当資料なし

[MEMO]

[MEMO]

[MEMO]



株式会社 陽進堂

富山県富山市婦中町萩島3697番地8号