

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

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

モンテルカスト錠 5mg「タナベ」
モンテルカスト錠 10mg「タナベ」

MONTELUKAST Tablets 5mg・Tablets 10mg

ロイコトリエン受容体拮抗剤
気管支喘息治療剤
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「タナベ」

MONTELUKAST Chewable Tablets 5mg

ロイコトリエン受容体拮抗剤
気管支喘息治療剤
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「タナベ」

MONTELUKAST Fine granules 4mg

剤形	錠：フィルムコーティング錠 チュアブル錠：素錠 細粒：細粒			
製剤の規制区分	該当しない			
規格・含量	錠 5mg：1錠 中日局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 中日局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 チュアブル錠 5mg：1錠 中日局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 細粒 4mg：1包 0.5g 中日局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）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	剤形	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, 錠 10mg	2016年8月15日	2016年12月9日	2016年12月9日
	チュアブル錠 5mg	2017年2月15日	2017年6月16日	2017年6月16日
	細粒 4mg	2017年2月15日	2017年6月16日	2017年6月16日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：ニプロ ES ファーマ株式会社			
医薬情報担当者の連絡先				
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL：0120-226-898 FAX：06-6375-0177 医療関係者向けホームページ https://www.nipro-es-pharma.co.jp			

本 IF は 2018 年 6 月改訂（モンテルカスト細粒 4mg「タナベ」）、2017 年 10 月改訂（モンテルカスト錠 5mg・10mg「タナベ」／チュアブル錠 5mg「タナベ」）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、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/> 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、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 IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF 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-IF）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-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF 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-IF 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-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF 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。

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、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

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 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。
- 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 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」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 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、「IF 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 IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 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 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等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等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があり、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、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	VI. 薬効薬理に関する項目	29
1. 開発の経緯	6	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	29
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	6	2. 薬理作用	29
II. 名称に関する項目	7	VII. 薬物動態に関する項目	30
1. 販売名	7	1. 血中濃度の推移・測定法	30
2. 一般名	7	2. 薬物速度論的パラメータ	36
3. 構造式又は示性式	7	3. 吸収	36
4. 分子式及び分子量	7	4. 分布	36
5. 化学名（命名法）	8	5. 代謝	37
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	8	6. 排泄	37
7. CAS 登録番号	8	7. トランスポーターに関する情報	38
III. 有効成分に関する項目	9	8. 透析等による除去率	38
1. 物理化学的性質	9	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	39
2. 有効成分の各種条件下における安定性	9	1. 警告内容とその理由	39
3. 有効成分の確認試験法	9	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	39
4. 有効成分の定量法	10	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	39
IV. 製剤に関する項目	11	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	39
1. 剤形	11	5. 慎重投与内容とその理由	39
2. 製剤の組成	11	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	39
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	12	7. 相互作用	41
4. 製剤の各種条件下における安定性	12	8. 副作用	41
5. 調製法及び溶解後の安定性	16	9. 高齢者への投与	42
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	16	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	43
7. 溶出性	16	11. 小児等への投与	43
8. 生物学的試験法	25	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	43
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	25	13. 過量投与	44
10. 製剤中の有効成分の定量法	26	14. 適用上の注意	44
11. 力価	26	15. その他の注意	44
12. 混入する可能性のある夾雑物	26	16. その他	44
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	26	IX. 非臨床試験に関する項目	45
14. その他	26	1. 薬理試験	45
V. 治療に関する項目	27	2. 毒性試験	45
1. 効能又は効果	27		
2. 用法及び用量	27		
3. 臨床成績	28		

X. 管理的事項に関する項目	46
1. 規制区分.....	46
2. 有効期間又は使用期限.....	46
3. 貯法・保存条件.....	46
4. 薬剤取扱い上の注意点.....	46
5. 承認条件等.....	46
6. 包装.....	47
7. 容器の材質.....	47
8. 同一成分・同効薬.....	47
9. 国際誕生年月日.....	47
10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	47
11. 薬価基準収載年月日.....	48
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.....	48
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日 及びその内容.....	48
14. 再審査期間.....	48
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	48
16. 各種コード.....	48
17. 保険給付上の注意.....	48
X I. 文献	49
1. 引用文献.....	49
2. その他の参考文献.....	49
X II. 参考資料	50
1. 主な外国での発売状況.....	50
2. 海外における臨床支援情報.....	50
X III. 備考	52
その他の関連資料.....	52

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

モンテルカスト錠 5mg「タナベ」、モンテルカスト錠 10mg「タナベ」、モンテルカストチュアブル錠 5mg「タナベ」及びモンテルカスト細粒 4mg「タナベ」は、モンテルカストナトリウムを有効成分とするロイコトリエン受容体拮抗薬である。

モンテルカスト錠 5mg「タナベ」及びモンテルカスト錠 10mg「タナベ」は後発医薬品として、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して加速試験及び生物学的同等性試験を実施し、田辺三菱製薬株式会社が 2016 年 8 月 15 日に承認を取得した。

その後、先発医薬品との効能又は効果等の相違を是正するため、2016 年 11 月に気管支喘息の効能・効果及び用法・用量の追加が一部変更承認され、2016 年 12 月 9 日より田辺製薬販売株式会社（現 ニプロ ES ファーマ株式会社）が販売を開始した。

2017 年 10 月にニプロ ES ファーマ株式会社が田辺三菱製薬株式会社より製造販売承認を承継した。

また、モンテルカストチュアブル錠 5mg「タナベ」及びモンテルカスト細粒 4mg「タナベ」は、後発医薬品として薬食発第 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して加速試験及び生物学的同等性試験を実施し、田辺三菱製薬株式会社が 2017 年 2 月に承認を取得、2017 年 6 月より田辺製薬販売株式会社（現 ニプロ ES ファーマ株式会社）が販売を開始した。

2017 年 10 月にニプロ ES ファーマ株式会社が田辺三菱製薬株式会社より製造販売承認を承継した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、「気管支喘息、アレルギー性鼻炎」（錠 5mg、錠 10mg）または「気管支喘息」（チュアブル錠 5mg、細粒 4mg）の効能・効果を有する。（「V. 治療に関する項目-1」参照）
- (2) 本剤の用法は 1 日 1 回投与である。（「V. 治療に関する項目-2」参照）
- (3) 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。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。（「VIII. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目-8」参照）

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

(2) 洋名：

MONTELUKAST Tablets 5mg
 MONTELUKAST Tablets 10mg
 MONTELUKAST Chewable Tablets 5mg
 MONTELUKAST Fine granules 4mg

(3) 名称の由来：

一般名+剤形+含量+「タナベ」

2. 一般名

(1) 和名（命名法）：

モンテルカストナトリウム（JAN）

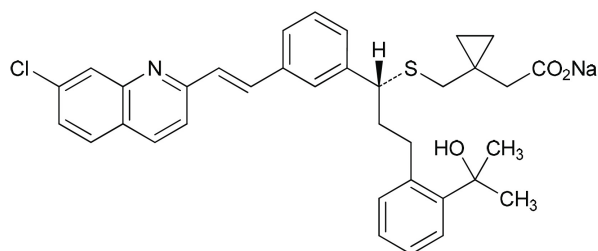
(2) 洋名（命名法）：

Montelukast Sodium（JAN）

(3) ステム：

-lukast：ロイコトリエン受容体拮抗薬

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₃₅H₃₅ClNaO₃S

分子量：608.17

II. 名称に関する項目

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)methylcyclopropyl)acetate (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

151767-02-1

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。
結晶多形が認められる。

(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

モンテルカスト錠

日局「モンテルカストナトリウム」の確認試験による

- (1) 強熱後，炭酸カリウム溶液及びヘキサヒドロキソアンチモン（V）酸カリウム試液による白色沈殿の有無
- (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）

モンテルカストチュアブル錠

日局「モンテルカストナトリウム」の確認試験による

- (1) 強熱後，炭酸カリウム溶液及びヘキサヒドロキソアンチモン（V）酸カリウム試液による白色沈殿の有無
- (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）

Ⅲ. 有効成分に関する項目

モンテルカスト細粒

日局「モンテルカストナトリウム」の確認試験による

- (1) 強熱後、炭酸カリウム溶液及びヘキサヒドロキソアンチモン（V）酸カリウム試液による白色沈殿の有無
- (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，臭化カリウム錠剤法又は ATR 法）

4. 有効成分の定量法

日局「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

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：238nm）

IV. 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 「タナベ」			モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」		
性状・剤形	淡橙色・フィルムコーティング錠					
外形						
規格	直径(mm) 6.6	厚さ(mm) 3.1	重量(mg) 103	直径(mm) 8.1	厚さ(mm) 4.1	重量(mg) 205
本体表示	モンテルカスト 5 タナベ			モンテルカスト 10 タナベ		
販売名	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」					
性状・剤形	うすい赤色・素錠					
外形						
規格	直径(mm) 9.5	厚さ(mm) 4.5	重量(mg) 300			
識別コード	TS60					
販売名	モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」					
性状・剤形	白色・細粒					

(2) 製剤の物性 :

該当資料なし

(3) 識別コード :

「(1) 剤形の区別, 外観及び性状」参照

(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 :

モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」 : 1錠中 日局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

モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」 : 1錠中 日局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

モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」 : 1錠中 日局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

モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」 : 1包 0.5g 中 日局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) 含有

IV. 製剤に関する項目

(2) 添加物：

モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」	モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」
D-マンニトール，軽質無水ケイ酸，低置換度ヒドロキシプロピルセルロース，結晶セルロース，ヒドロキシプロピルセルロース，無水リン酸水素カルシウム，ステアリン酸マグネシウム，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，黄色三二酸化鉄，三二酸化鉄	
モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」	モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」
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ナトリウム，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，軽質無水ケイ酸，ステアリン酸マグネシウム	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

(3) その他：

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) 加速試験

モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」

PTP をアルミニウム袋に入れた包装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 「タナベ」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¹⁾。

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
加速試験	40℃，75%RH	PTP + アルミニウム袋	6 ヶ月	変化なし

試験項目：性状，確認試験，純度試験，製剤均一性試験，溶出試験，含量

モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」

PTP をアルミニウム袋に入れた包装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 「タナベ」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¹⁾。

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
加速試験	40℃，75%RH	PTP + アルミニウム袋	6 ヶ月	変化なし

試験項目：性状，確認試験，純度試験，製剤均一性試験，溶出試験，含量

モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」

PTP をアルミニウム袋に入れた包装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 「タナベ」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⁾。

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
加速試験	40℃，75%RH	PTP + アルミニウム袋	6 ヶ月	変化なし

試験項目：性状，確認試験，純度試験，製剤均一性試験，溶出性試験，含量

モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」

アルミ分包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 「タナベ」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³⁾。

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
加速試験	40℃，75%RH	アルミ分包+ポリ袋+紙箱	6 ヶ月	変化なし

試験項目：性状，確認試験，純度試験，製剤均一性試験，溶出性試験，粒度，含量

(2) 無包装状態での安定性

モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」

無包装状態について，温度，湿度及び光に対する安定性試験を実施した結果は，以下のとおりであった⁴⁾。

保存条件		保存形態	保存期間	結果*2
温度*1	40℃	遮光・気密容器（瓶）	3 ヶ月	変化なし（◎）
湿度*1	75%RH/25℃	遮光・開放	3 ヶ月	変化なし（◎）
光*1	白色蛍光灯（2,000lx）	気密容器（瓶）	20 万 lx・h	変化なし（◎）
			60 万 lx・h	変化あり（△） ^{注1)}
			120 万 lx・h	変化あり（△） ^{注1)}

注 1) 純度試験（類縁物質質量）が規格外

*1. 試験項目：性状，純度試験，溶出試験，含量，硬度

*2. 「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」

（平成 11 年 8 月 20 日（社）日本病院薬剤師会）の評価分類（下記）に準じる。

◎：すべての試験項目において変化を認めなかった。

外観：変化をほとんど認めない。純度（類縁物質質量）：規格値内。含量：3%未満の低下。溶出性：規格値内。硬度：30%未満の変化。

○：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認めた。

外観：わずかな色調変化（退色等）を認めるが，品質上，問題とならない程度の変化であり，規格を満たしている。含量：3%以上の低下で，規格値内。硬度：30%以上の変化で，硬度が 2.0kgf（19.6N）以上。

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。

外観：形状変化や著しい色調変化を認め，規格を逸脱している。純度（類縁物質質量）：規格値外。含量：規格値外。溶出性：規格値外。硬度：30%以上の変化で，硬度が 2.0kgf（19.6N）未満。

IV. 製剤に関する項目

モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」

無包装状態について、温度、湿度及び光に対する安定性試験を実施した結果は、以下のとおりであった⁴⁾。

保存条件		保存形態	保存期間	結果*2
温度*1	40℃	遮光・気密容器（瓶）	3 ヶ月	変化あり（○） ^{注1)}
湿度*1	75%RH/25℃	遮光・開放	3 ヶ月	変化なし（◎）
光*1	白色蛍光灯（2,000lx）	気密容器（瓶）	20 万 lx・h	変化なし（◎）
			60 万 lx・h	変化なし（◎）
			120 万 lx・h	変化あり（△） ^{注2)}

注 1) 30%以上の硬度の上昇

注 2) 純度試験（類縁物質質量）が規格外

*1. 試験項目：性状、純度試験、溶出試験、含量、硬度

*2. 「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」

（平成 11 年 8 月 20 日（社）日本病院薬剤師会）の評価分類（下記）に準じる。

◎：すべての試験項目において変化を認めなかった。

○：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。
外観：変化をほとんど認めない。純度（類縁物質質量）：規格値内。含量：3%未満の低下。溶出性：規格値内。硬度：30%未満の変化。

△：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認めた。

○：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認めた。
外観：わずかな色調変化（退色等）を認めるが、品質上、問題とにならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：3%以上の低下で、規格値内。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf（19.6N）以上。

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。
外観：形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している。純度（類縁物質質量）：規格値外。含量：規格値外。溶出性：規格値外。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf（19.6N）未満。

モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」

無包装状態について、温度、湿度及び光に対する安定性試験を実施した結果は、以下のとおりであった⁵⁾。

保存条件		保存形態	保存期間	結果*2
温度*1	40℃	遮光・気密容器（瓶）	3 ヶ月	変化なし（◎）
湿度*1	75%RH/25℃	遮光・開放	3 ヶ月	変化あり（○） ^{注1)}
光*1	白色蛍光灯（2,000lx） 照射・25℃/60%RH	気密ガラス瓶（無色）	20 万 lx・h	変化あり（△） ^{注2)}
			60 万 lx・h	変化あり（△） ^{注3)}
			120 万 lx・h	変化あり（△） ^{注3)}

注 1) 30%以上の硬度の低下（ $\geq 3.0\text{kgf}$ ：実用上問題とにならない程度の変化）

注 2) 類縁物質質量の増加（規格外）

注 3) 類縁物質質量の増加（規格外）、含量の低下（規格外）

*1. 試験項目：性状、純度試験、溶出試験、含量、硬度

*2. 「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」

（平成 11 年 8 月 20 日（社）日本病院薬剤師会）の評価分類（下記）に準じる。

◎：すべての試験項目において変化を認めなかった。

○：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。
外観：変化をほとんど認めない。純度（類縁物質質量）：規格値内。含量：3%未満の低下。溶出性：規格値内。硬度：30%未満の変化。

△：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認めた。

○：いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認めた。
外観：わずかな色調変化（退色等）を認めるが、品質上、問題とにならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：3%以上の低下で、規格値内。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf（19.6N）以上。

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。

△：いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。
外観：形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している。純度（類縁物質質量）：規格値外。含量：規格値外。溶出性：規格値外。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf（19.6N）未満。

モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」

無包装状態について、温度、湿度及び光に対する安定性試験を実施した結果は、以下のとおりであった⁶⁾。

保存条件		保存形態	保存期間	結果*2
温度*1	40℃/75%RH	遮光・気密容器	3 ヶ月	変化なし (◎)
湿度*1	75%RH/25℃	遮光・開放	3 ヶ月	変化なし (◎)
光*1	白色蛍光灯 (2,500lx)	ガラスシャーレ (開放) +ラップ覆い	250lx・h	変化あり (△) 注1)
			625lx・h	変化あり (△) 注1)
			1,250lx・h	変化あり (△) 注1)

注 1) 純度試験 (類縁物質) において規格外の変化

*1. 試験項目: 性状, 純度試験, 溶出試験, 含量

*2. 「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について (答申)」

(平成 11 年 8 月 20 日 (社) 日本病院薬剤師会) の評価分類 (下記) に準じる。

◎: すべての試験項目において変化を認めなかった。

外観: 変化をほとんど認めない。純度 (類縁物質): 規格値内。含量: 3%未満の低下。溶出性: 規格値内。

○: いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認めた。

外観: わずかな色調変化 (退色等) を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量: 3%以上の低下で、規格値内。

△: いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。

外観: 形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している。純度 (類縁物質): 規格値外。含量: 規格値外。溶出性: 規格値外。

(3) PTP (一次包装) での安定性

モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」

PTP (一次包装) での安定性試験を以下の条件で実施した。その結果、両製剤とも本試験条件下における高曝光下で安定であった⁷⁾。

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
過酷試験	白色蛍光灯 (2,000lx)	PTP + 気密容器 (瓶)	20 万 lx・h	変化なし
			60 万 lx・h	変化なし
			120 万 lx・h	変化なし

試験項目: 性状, 純度試験, 溶出試験, 含量, 硬度

モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」

PTP (一次包装) での安定性試験を以下の条件で実施した。その結果、両製剤とも本試験条件下における高曝光下で安定であった⁷⁾。

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
過酷試験	白色蛍光灯 (2,000lx)	PTP + 気密容器 (瓶)	20 万 lx・h	変化なし
			60 万 lx・h	変化なし
			120 万 lx・h	変化あり 注1)

注 1) 純度試験 (類縁物質) が規格外

試験項目: 性状, 純度試験, 溶出試験, 含量, 硬度

IV. 製剤に関する項目

モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」

PTP（一次包装）について光に対する安定性試験を実施した結果は、以下のとおりであった⁸⁾。

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果*1
過酷試験	白色蛍光灯 (2,000lx) 照射・25℃/60%RH	PTP 包装品 (アルミピロー無)	3 万 lx・h	変化あり (○) 注1)
			5 万 lx・h	変化あり (△) 注2)
			10 万 lx・h	変化あり (△) 注2)
			20 万 lx・h	変化あり (△) 注2)
			60 万 lx・h	変化あり (△) 注3)

注 1) 類縁物質量の増加 (規格内)

注 2) 類縁物質量の増加 (規格外)

注 3) 類縁物質量の増加 (規格外), 含量の低下 (規格外)

試験項目: 性状, 純度試験, 溶出試験, 含量, 硬度

* 1. 「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について (答申)」

(平成 11 年 8 月 20 日 (社) 日本病院薬剤師会) の評価分類 (下記) に準じる。

◎: すべての試験項目において変化を認めなかった。

外観: 変化をほとんど認めない。純度 (類縁物質量): 規格値内。含量: 3%未満の低下。溶出性: 規格値内。硬度: 30%未満の変化。

○: いずれかの試験項目で「規格内」の変化を認めた。

外観: わずかな色調変化 (退色等) を認めるが, 品質上, 問題とならない程度の変化であり, 規格を満たしている。含量: 3%以上の低下で, 規格値内。硬度: 30%以上の変化で, 硬度が 2.0kgf (19.6N) 以上。

△: いずれかの試験項目で「規格外」の変化を認めた。

外観: 形状変化や著しい色調変化を認め, 規格を逸脱している。純度 (類縁物質量): 規格値外。含量: 規格値外。溶出性: 規格値外。硬度: 30%以上の変化で, 硬度が 2.0kgf (19.6N) 未満。

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

モンテルカスト錠

モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」及びモンテルカスト錠 10mg 「タナベ」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⁹⁾。すなわち, 試験液にラウリル硫酸ナトリウム溶液 (1→200) 900mL を用い, パドル法により, 毎分 50 回転で試験を行うとき, 本品の 20 分間の溶出率は 85%以上である。

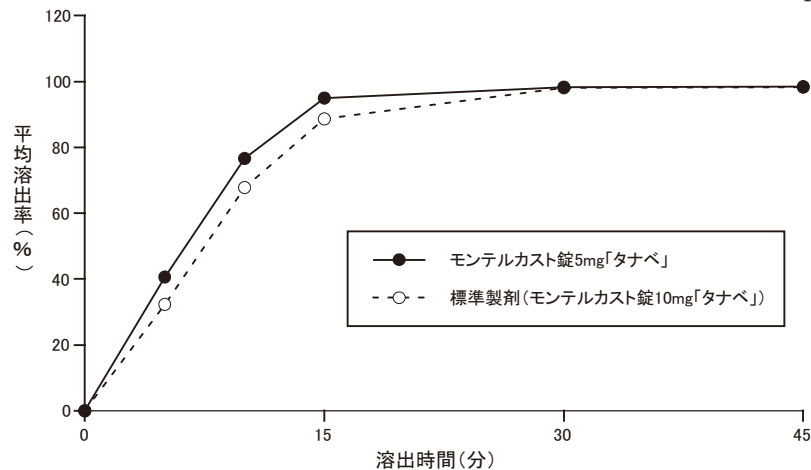
<参考> 溶出挙動の類似性

<モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」>

下記の条件について溶出試験を実施した結果, 判定基準に適合し, モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」と標準製剤の溶出挙動は同等であると判定された¹⁰⁾。(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による)

検体	モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」 (Lot No. ABMC) 標準製剤：モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」 (Lot No. ABNA)
試験法	パドル法
試験液 (試験液量) / 回転数	① ラウリル硫酸ナトリウム溶液 (1→200) (900mL) / 50rpm
判定基準	<ul style="list-style-type: none"> ・ 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$\pm 10\%$の範囲にある。 ・ 最終比較時点 (15 分) における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率$\pm 15\%$の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、$\pm 25\%$の範囲を超えるものがない。

①試験液：ラウリル硫酸ナトリウム溶液 (1→200) 回転数：50rpm



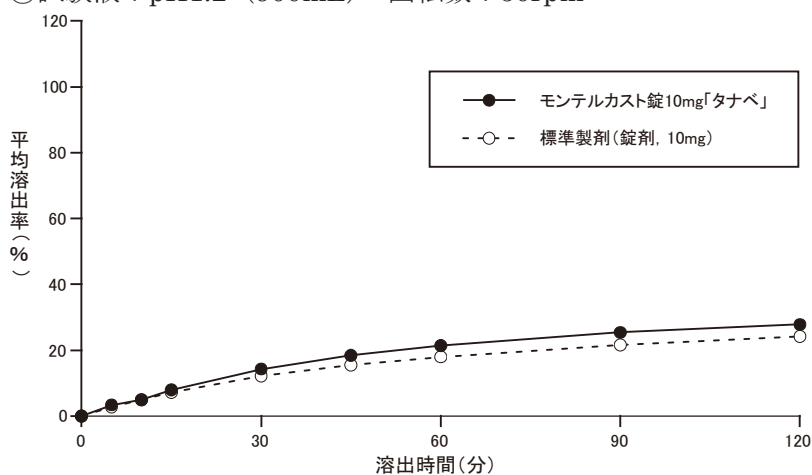
<モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」>

下記の 5 条件について溶出試験を実施した結果、それぞれが判定基準に適合し、モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断された¹⁰⁾。(後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインによる)

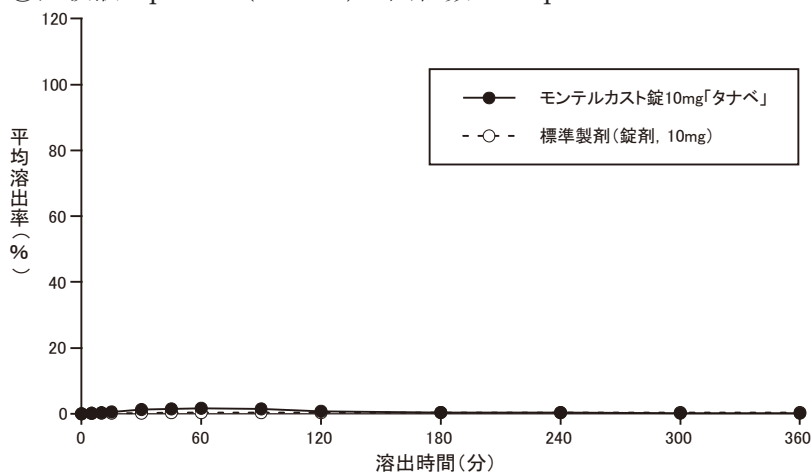
検体	モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」 (Lot No. ABNA) 標準製剤 (錠剤, 10mg)
試験法	パドル法
試験液 (試験液量) / 回転数	① pH1.2 (900mL) / 50rpm ② pH4.0 (900mL) / 50rpm ③ pH6.8 (900mL) / 50rpm ④ 水 (900mL) / 50rpm ⑤ pH1.2 (900mL) / 100rpm
判定基準	① 30 分及び 120 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲にある。 ② 360 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 9\%$ の範囲にある。 ③ 15 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 9\%$ の範囲にある。 ④ 15 分及び 30 分において、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。 ⑤ 15 分及び 120 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 9\%$ の範囲にある。

IV. 製剤に関する項目

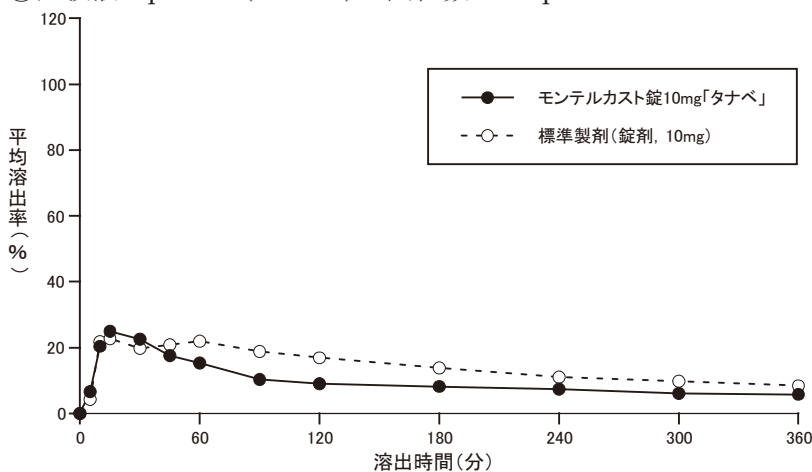
①試験液：pH1.2（900mL） 回転数：50rpm



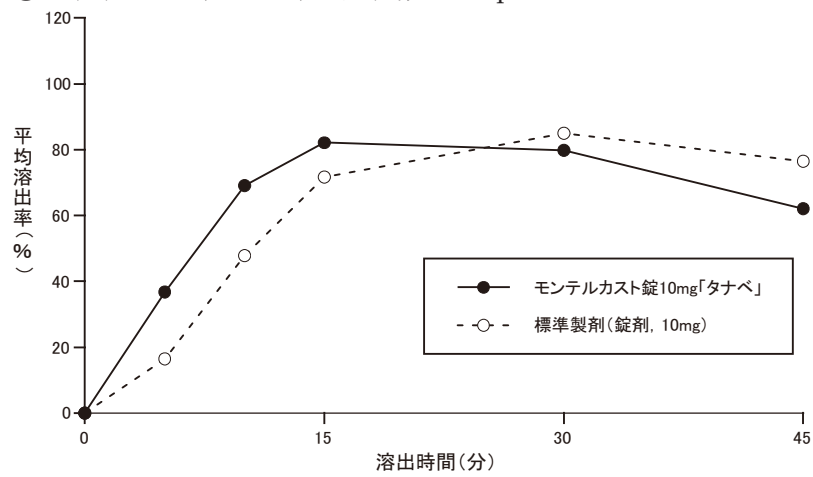
②試験液：pH4.0（900mL） 回転数：50rpm



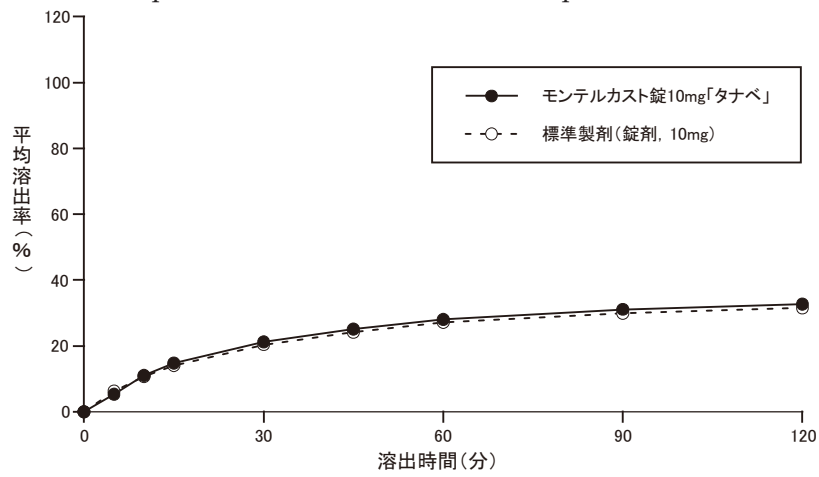
③試験液：pH6.8（900mL） 回転数：50rpm



④試験液：水（900mL） 回転数：50rpm



⑤試験液：pH1.2（900mL） 回転数：100rpm



IV. 製剤に関する項目

モンテルカストチュアブル錠

モンテルカストチュアブル錠 5mg「タナベ」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¹¹⁾。すなわち、試験液にラウリル硫酸ナトリウム溶液（1→200）900mLを用い、パドル法により、毎分50回転で試験を行うとき、本品の20分間の溶出率は85%以上である。

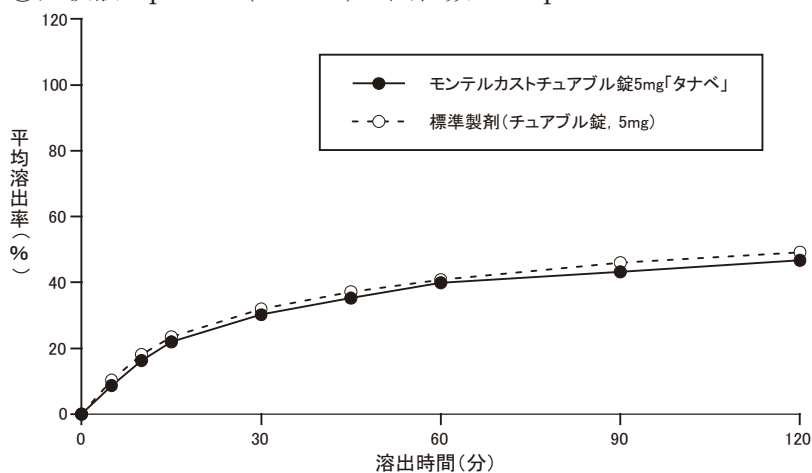
<参考>溶出挙動の類似性

<モンテルカストチュアブル錠 5mg「タナベ」>

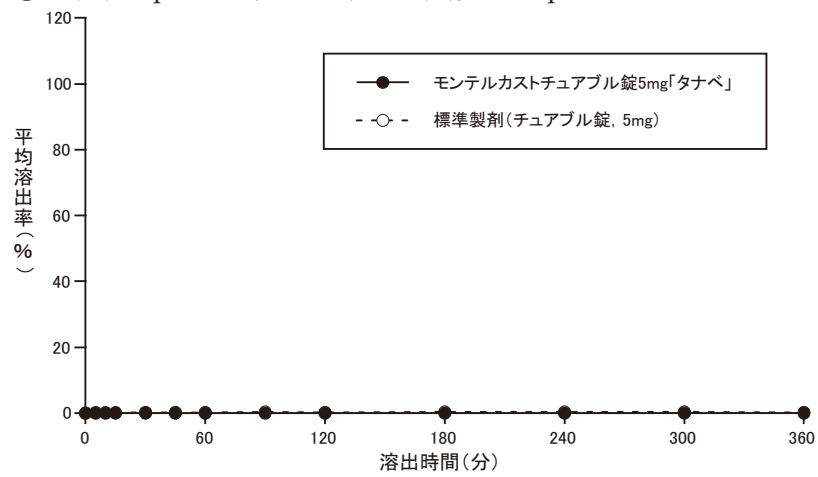
下記の8条件について溶出試験を実施した結果、「水」を除く他の試験液では両製剤の溶出挙動の類似性が認められたものの、「水」では溶出挙動の類似性は認められなかった¹²⁾。（後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインによる）

検体	モンテルカストチュアブル錠 5mg「タナベ」(Lot No. AGMB) 標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)
試験法	パドル法
試験液 (試験液量) / 回転数	① pH1.2 (900mL) / 50rpm ② pH4.0 (900mL) / 50rpm ③ pH6.8 (900mL) / 50rpm ④ 水 (900mL) / 50rpm ⑤ pH1.2 + 0.01% (W/V) ポリソルベート 80 (900mL) / 50rpm ⑥ pH4.0 + 0.01% (W/V) ポリソルベート 80 (900mL) / 50rpm ⑦ pH6.8 + 0.01% (W/V) ポリソルベート 80 (900mL) / 50rpm ⑧ pH6.8 + 0.01% (W/V) ポリソルベート 80 (900mL) / 100rpm
判定基準	① 15分及び120分において、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。 ② 360分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 9\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が53以上である。 ③ 90分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 9\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が53以上である。 ④ 5分及び90分において、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。 ⑤ 15分及び120分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 12\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が46以上である。 ⑥ 60分及び360分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 12\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が46以上である。 ⑦ 10分及び180分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が42以上である。 ⑧ 15分及び240分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率の $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が42以上である。

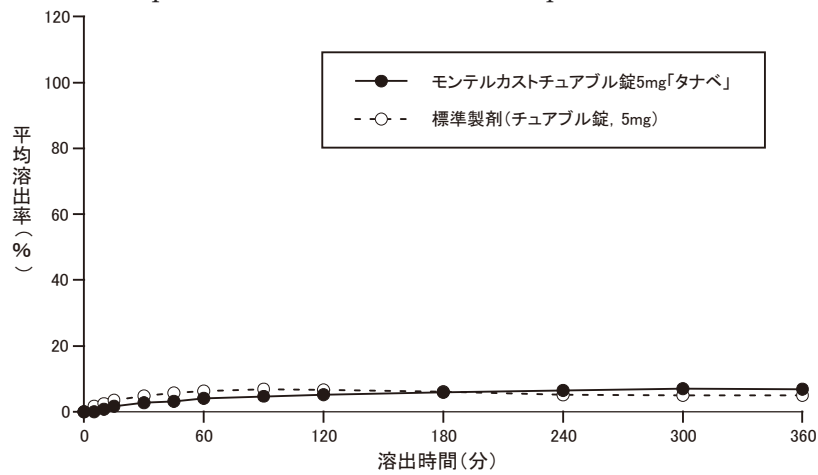
① 試験液：pH1.2 (900mL) 回転数：50rpm



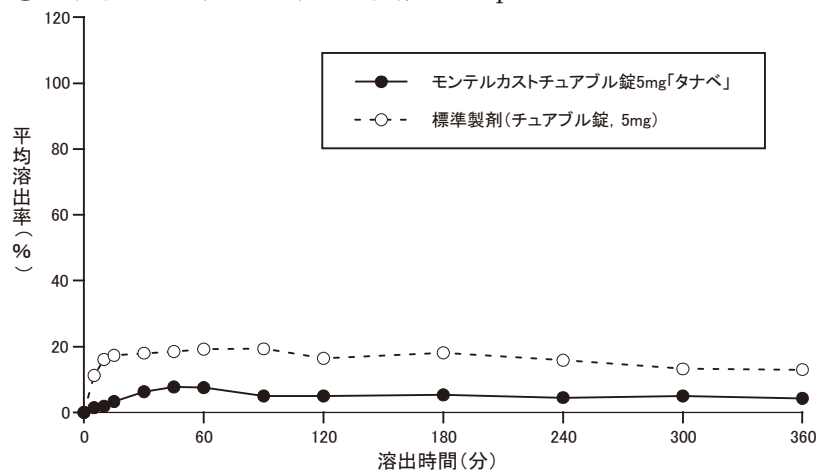
②試験液：pH4.0（900mL） 回転数：50rpm



③試験液：pH6.8（900mL） 回転数：50rpm

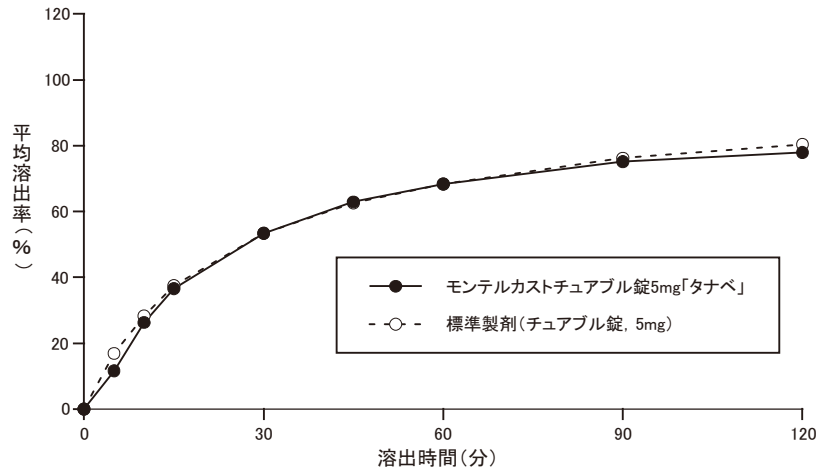


④試験液：水（900mL） 回転数：50rpm

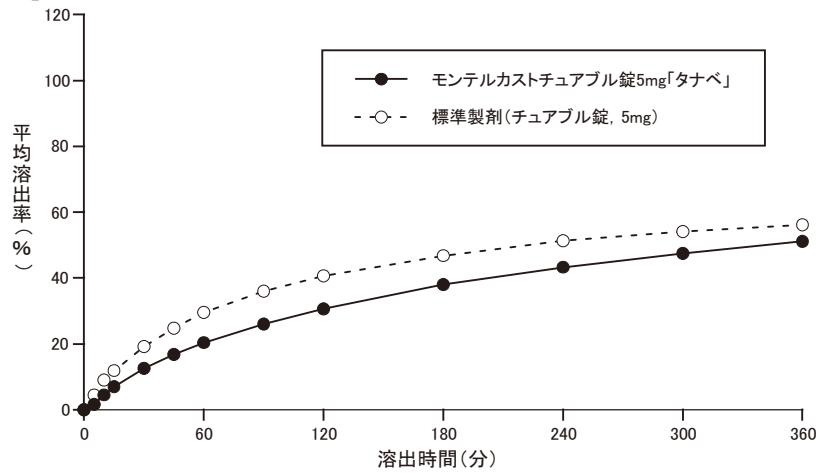


IV. 製剤に関する項目

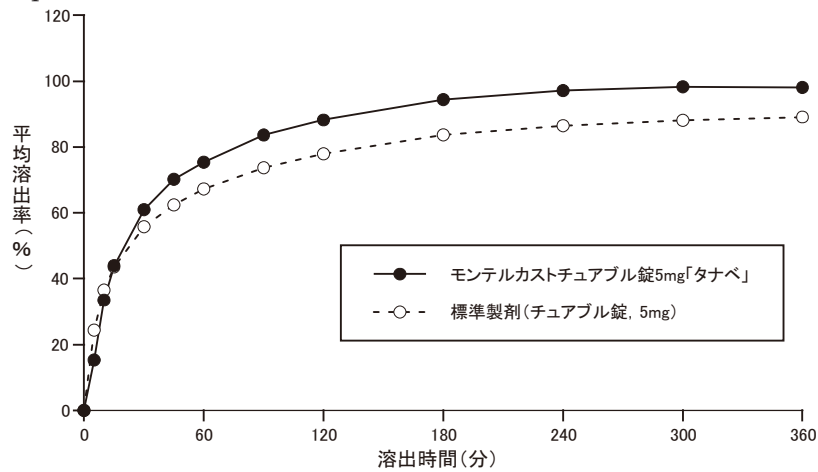
⑤試験液：pH1.2 + 0.01% (W/V) ポリソルベート 80 (900mL) 回転数：50rpm



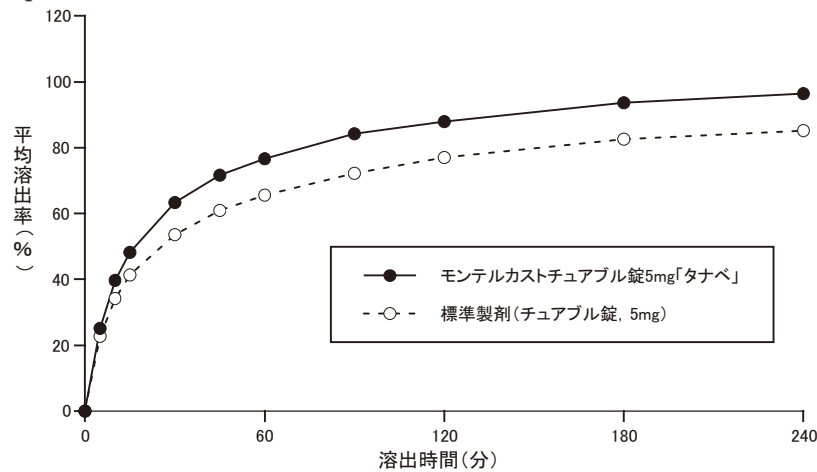
⑥試験液：pH4.0 + 0.01% (W/V) ポリソルベート 80 (900mL) 回転数：50rpm



⑦試験液：pH6.8 + 0.01% (W/V) ポリソルベート 80 (900mL) 回転数：50rpm



⑧試験液：pH6.8 + 0.01% (W/V) ポリソルベート 80 (900mL) 回転数：100rpm



モンテルカスト細粒

<参考>溶出挙動の類似性

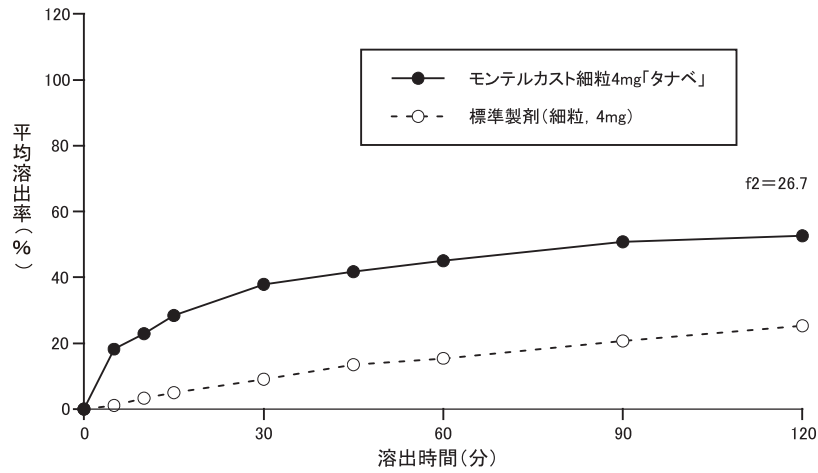
<モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」 >

下記の 5 条件について溶出試験を実施した結果、「水」で両製剤の溶出挙動の類似性が認められたものの、その他の条件 (pH1.2, pH6.5 及び pH7.5) ではいずれも溶出挙動の類似性は認められなかった¹³⁾。(後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインによる)

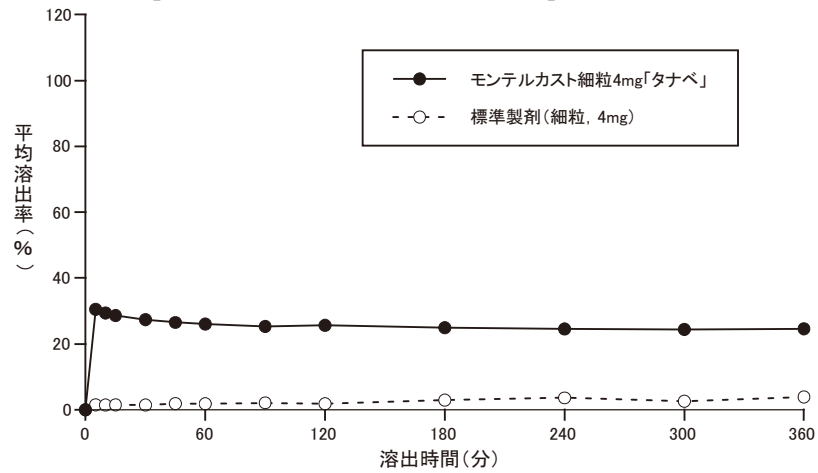
検体	モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」 (Lot No. 6244004) 標準製剤 (細粒, 4mg)
試験法	パドル法
試験液 (試験液量) ／回転数	① pH1.2 (900mL) / 50rpm ② pH6.5 (900mL) / 50rpm ③ pH7.5 (900mL) / 50rpm ④ 水 (900mL) / 50rpm ⑤ pH7.5 (900mL) / 100rpm
判定基準	① 45 分及び 120 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 53 以上である。 ② 360 分において、試験製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。 ③ 5 分及び 360 分において、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。 ④ 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。 ⑤ 5 分及び 360 分において、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。

IV. 製剤に関する項目

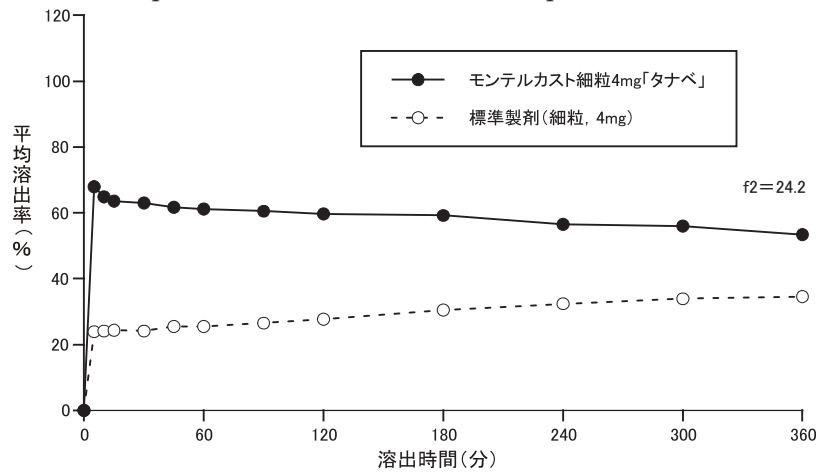
①試験液：pH1.2（900mL） 回転数：50rpm



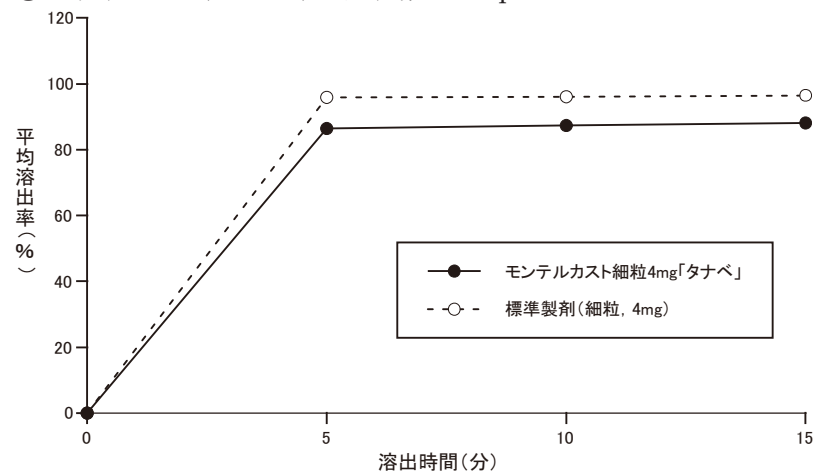
②試験液：pH6.5（900mL） 回転数：50rpm



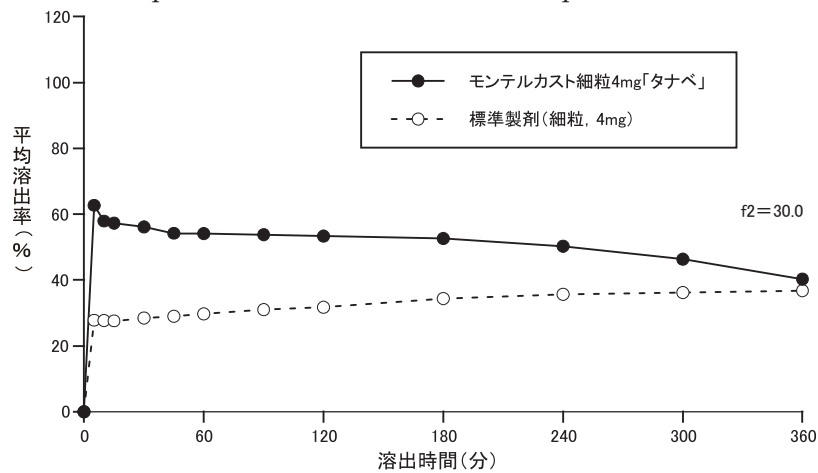
③試験液：pH7.5（900mL） 回転数：50rpm



④試験液：水（900mL） 回転数：50rpm



⑤試験液：pH7.5（900mL） 回転数：100rpm



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

モンテルカスト錠

日局「モンテルカストナトリウム錠」の確認試験による。

紫外可視吸光度測定法

モンテルカストチュアブル錠

日局「モンテルカストナトリウムチュアブル錠」の確認試験による。

紫外可視吸光度測定法

モンテルカスト細粒

紫外可視吸光度測定法

IV. 製剤に関する項目

10. 製剤中の有効成分の定量法

モンテルカスト錠

日局「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

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：255nm）

モンテルカストチュアブル錠

日局「モンテルカストナトリウムチュアブル錠」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：255nm）

モンテルカスト細粒

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. 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

モンテルカスト錠

気管支喘息，アレルギー性鼻炎

モンテルカストチュアブル錠

気管支喘息

モンテルカスト細粒

気管支喘息

2. 用法及び用量

モンテルカスト錠

〈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・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

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・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

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・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：

該当資料なし

(2) 臨床効果：

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：

該当資料なし

(4) 探索的試験：

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

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薬（ザフィルルカスト，プラナルカスト水和物）

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序：

抗アレルギー薬。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¹⁴⁾。

(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

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：

モンテルカスト錠

健康成人男子にモンテルカスト錠 10mg 「タナベ」 1 錠を絶食時単回経口投与した場合の T_{max} は、 3.6 ± 1.6 時間 (Mean \pm S.D., $n=24$) であった¹⁵⁾。

モンテルカストチュアブル錠

健康成人男子にモンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」 1 錠を絶食時単回経口投与した場合の T_{max} は、 3.00 ± 0.56 時間 (口中溶解後水なし投与, Mean \pm S.D., $n=20$), 2.75 ± 0.84 時間 (口中溶解後水あり投与, Mean \pm S.D., $n=20$), 2.65 ± 0.81 時間 (咀嚼後水なし投与, Mean \pm S.D., $n=20$), 2.95 ± 1.04 時間 (咀嚼後水あり投与, Mean \pm S.D., $n=20$) であった¹⁶⁾。

モンテルカスト細粒

健康成人男子にモンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」 1 包を絶食時単回経口投与した場合の T_{max} は、 1.6 ± 0.3 時間 (Mean \pm S.D., $n=20$) であった¹⁷⁾。

(3) 臨床試験で確認された血中濃度：

生物学的同等性試験

1) モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」¹⁵⁾

モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」は、ヒトを対象とした生物学的同等性試験により先発医薬品との同等性が確認されているモンテルカスト錠 10mg 「タナベ」を標準製剤として、「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 (薬食審査発 0229 第 10 号：平成 24 年 2 月 29 日一部改正)」に基づき溶出試験を行い、比較検討を行った。その結果、モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」は標準製剤との間で溶出挙動が同等と判定されたため、両製剤は生物学的に同等であると判断した。(「IV. 製剤に関する項目-7. 溶出性」の項参照)

2) モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」¹⁵⁾

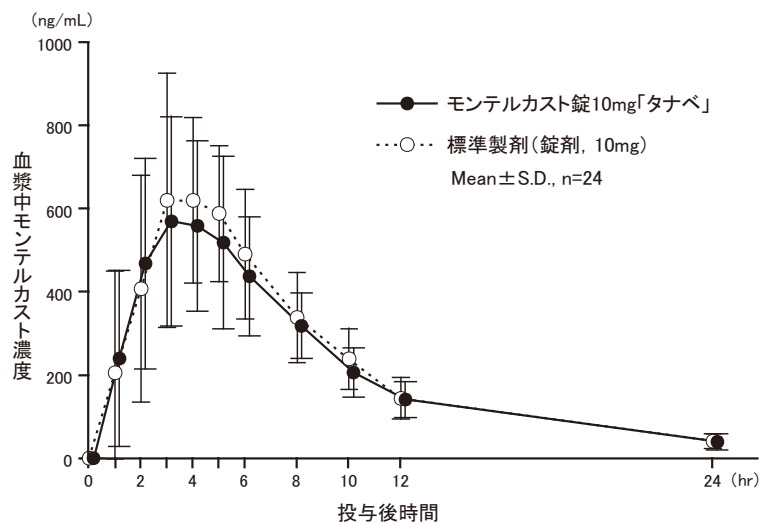
モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」(試験製剤)について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(医薬審第 487 号：平成 9 年 12 月 22 日、薬食審査発 0229 第 10 号：平成 24 年 2 月 29 日)に準拠して、生物学的同等性試験を実施した。

試験製剤 (Lot No. ABNA) と標準製剤 (先発医薬品；錠剤, 10mg) をそれぞれ 1 錠 (モンテルカストナトリウムをモンテルカストとして 10mg 含有), 2 剤 2 期クロスオーバー法 (休薬期間：7 日間) により健康成人男子 (12 名/群, 計 24 名) に投与前 10 時間以上の絶食後、150mL の水とともに単回経口投与して、血漿中モンテルカスト (未変化体) 濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータを評価した結果、両剤の C_{max} 及び AUC_{0-24} の対数変換データを用いて計算した両製剤の平均値の差の 90%信頼区間は、それぞれ $\log (0.8699) \sim \log (0.9995)$ 及び $\log (0.8944) \sim \log (1.0019)$ であり、いずれもガイドラインの基準である $\log (0.80) \sim \log (1.25)$ の範囲内であった。以上の結果より、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

＜薬物動態パラメータ＞

	モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」	標準製剤（錠剤, 10mg）
Cmax (ng/mL)	722.35 ± 212.15	776.41 ± 234.50
AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	5281.69 ± 1181.40	5583.84 ± 1295.10
AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	5639.85 ± 1365.35	5942.12 ± 1449.30
Tmax (hr)	3.6 ± 1.6	3.8 ± 1.2
MRT ₀₋₂₄ (hr)	7.26 ± 0.95	7.35 ± 0.85
kel (hr ⁻¹)	0.1218 ± 0.0205	0.1256 ± 0.0220
t _{1/2} (hr)	5.86 ± 1.09	5.72 ± 1.20

(Mean ± S.D., 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。

3) モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」¹⁶⁾

モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」(試験製剤)について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(医薬審第 487 号：平成 9 年 12 月 22 日、薬食審査発 0229 第 10 号：平成 24 年 2 月 29 日一部改正)に準拠して、生物学的同等性試験を実施した。

口中溶解による服用

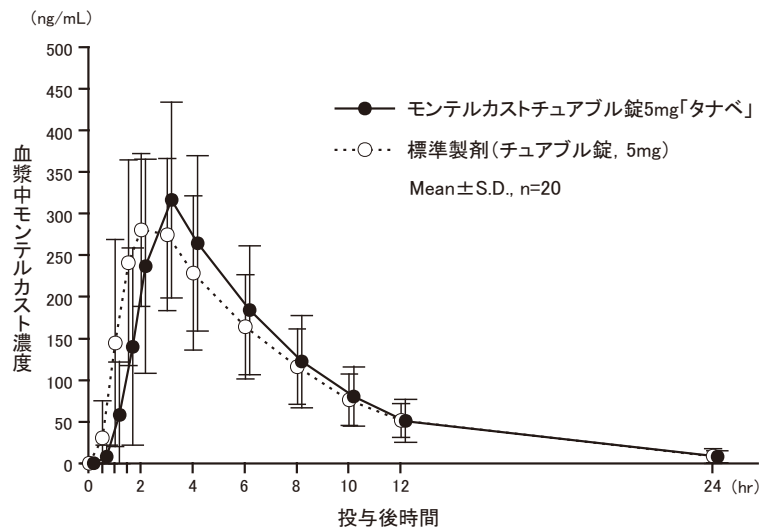
試験製剤 (Lot No. AGMB) と標準製剤 (先発医薬品；チュアブル錠, 5mg) をそれぞれ 1 錠 (モンテルカストとして 5mg 含有) を、2 剤 2 期クロスオーバー法 (休薬期間：7 日間以上) により健康成人男子 (10 名/群, 計 20 名) に投与前 10 時間以上の絶食後、口中溶解後、水なし及び水あり (水 150mL) で単回経口投与して、血漿中モンテルカスト (未変化体) 濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータを評価した結果、両剤の Cmax 及び AUC₀₋₂₄ の対数変換データを用いて計算した両製剤の平均値の差の 90%信頼区間は、それぞれ log (0.8953) ~ log (0.9999) 及び log (0.9239) ~ log (1.0381), log (0.8432) ~ log (1.0611) 及び log (0.8757) ~ log (1.1035) であり、いずれもガイドラインの基準である log (0.80) ~ log (1.25) の範囲内であった。以上の結果より、試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

VII. 薬物動態に関する項目

<薬物動態パラメータ：水なしで服用>

	モンテルカストチュアブル錠 5mg「タナベ」	標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)
Cmax (ng/mL)	328.910±108.922	339.619±70.628
AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	2171.45±876.88	2160.72±649.17
AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	2214.23±926.69	2212.39±734.19
Tmax (hr)	3.00±0.56	2.50±1.17
MRT (hr)	6.48±0.67	6.28±0.77
kel (hr ⁻¹)	0.1772±0.0584	0.1641±0.0400
t _{1/2} (hr)	4.18±0.90	4.46±1.06

(Mean±S.D., n=20)

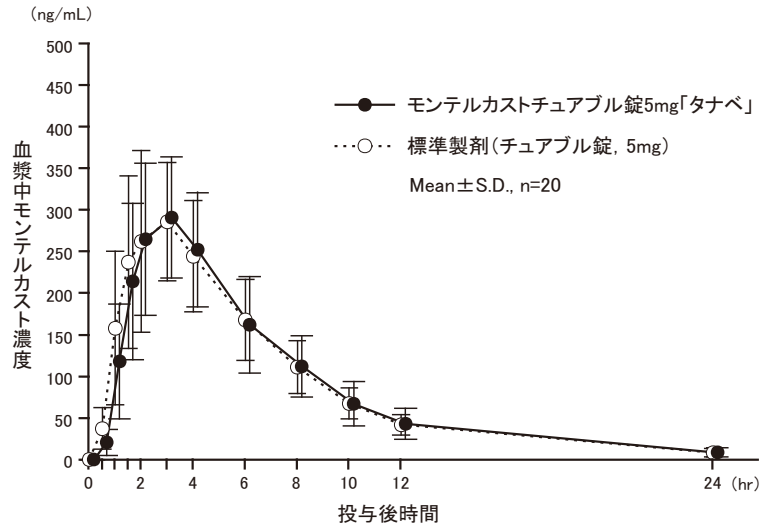


血漿中濃度並びに AUC, Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

<薬物動態パラメータ：水で服用>

	モンテルカストチュアブル錠 5mg「タナベ」	標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)
Cmax (ng/mL)	309.631±72.491	326.535±68.791
AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	2077.73±604.43	2097.48±469.83
AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	2134.68±650.66	2149.61±514.38
Tmax (hr)	2.75±0.84	2.55±0.87
MRT (hr)	6.15±0.71	6.04±0.58
kel (hr ⁻¹)	0.1578±0.0469	0.1601±0.0564
t _{1/2} (hr)	4.69±1.09	4.69±1.13

(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。

咀嚼による服用

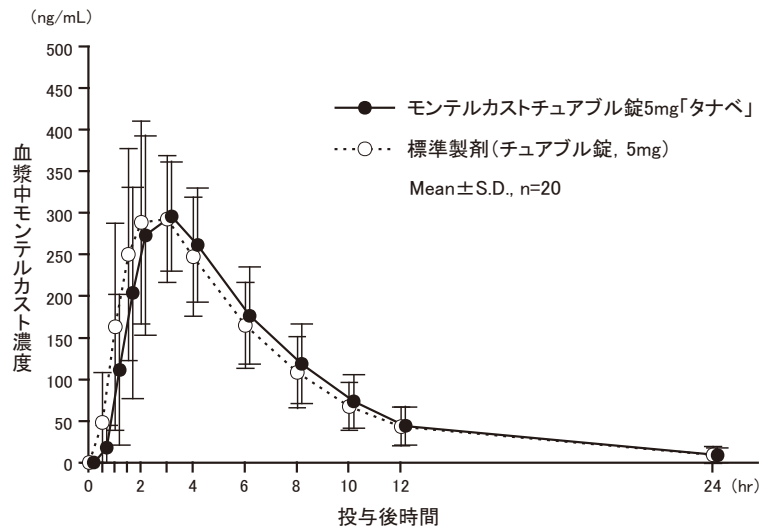
試験製剤 (Lot No. AGMB) と標準製剤 (先発医薬品 ; チュアブル錠, 5mg) をそれぞれ 1 錠 (モンテルカストとして 5mg 含有) を, 2 剤 2 期クロスオーバー法 (休薬期間 : 7 日間以上) により健康成人男子 (10 名/群, 計 20 名) に投与前 10 時間以上の絶食後, 咀嚼後, 水なし及び水あり (水 150mL) で単回経口投与して, 血漿中モンテルカスト (未変化体) 濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータを評価した結果, 両剤の Cmax 及び AUC₀₋₂₄ の対数変換データを用いて計算した両剤の平均値の差の 90% 信頼区間は, それぞれ log (0.8716) ~ log (1.0611) 及び log (0.9181) ~ log (1.0923), log (0.8463) ~ log (1.0074) 及び log (0.8973) ~ log (1.0675) であり, いずれもガイドラインの基準である log (0.80) ~ log (1.25) の範囲内であった。以上の結果より, 試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

<薬物動態パラメータ : 水なしで服用>

	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」	標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)
Cmax (ng/mL)	323.193±80.221	339.860±90.635
AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	2157.02±689.98	2149.09±671.26
AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	2206.39±784.30	2211.37±780.82
Tmax (hr)	2.65±0.81	2.15±0.71
MRT (hr)	6.11±0.86	5.93±0.83
kel (hr ⁻¹)	0.1967±0.0947	0.1817±0.0848
t _{1/2} (hr)	4.19±1.55	4.49±1.63

(Mean±S.D., n=20)

VII. 薬物動態に関する項目

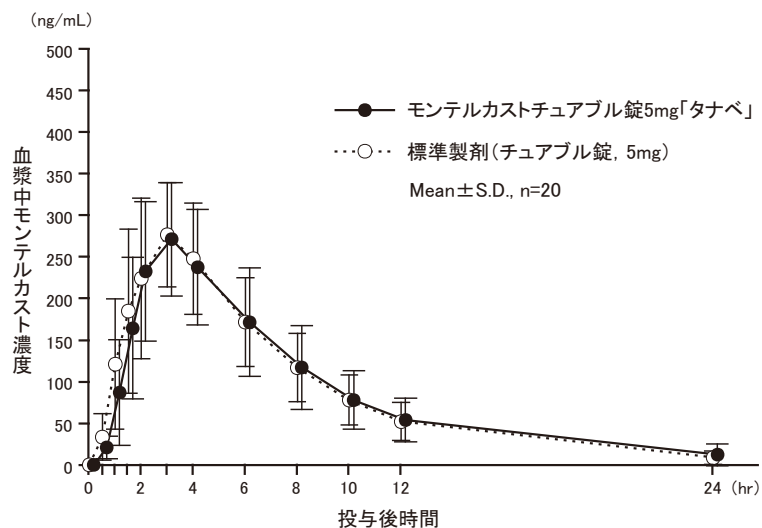


血漿中濃度並びに AUC, Cmax 等のパラメータは, 被験者の選択, 体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

<薬物動態パラメータ：水で服用>

	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」	標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)
Cmax (ng/mL)	286.231 ± 62.306	308.242 ± 58.134
AUC ₀₋₂₄ (ng · hr/mL)	2121.58 ± 733.63	2134.42 ± 598.88
AUC _{0-∞} (ng · hr/mL)	2245.63 ± 900.45	2183.40 ± 676.68
Tmax (hr)	2.95 ± 1.04	2.80 ± 0.82
MRT (hr)	6.64 ± 0.97	6.41 ± 0.77
kel (hr ⁻¹)	0.1577 ± 0.0564	0.1690 ± 0.0424
t _{1/2} (hr)	5.18 ± 2.94	4.34 ± 1.04

(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。

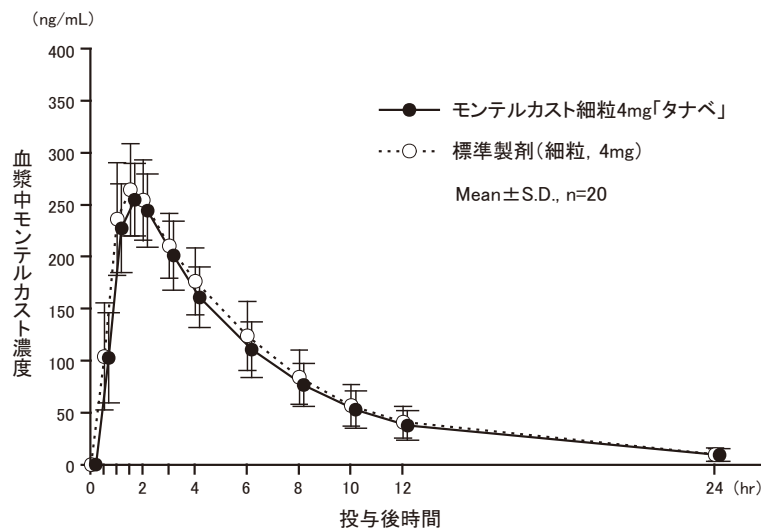
4) モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」¹⁷⁾

モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」(試験製剤)について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(医薬審第 487 号：平成 9 年 12 月 22 日，薬食審査発 0229 第 10 号：平成 24 年 2 月 29 日一部改正)に準拠して，生物学的同等性試験を実施した。試験製剤 (Lot No. 6244004) と標準製剤 (先発医薬品；細粒，4mg) をそれぞれ 1 包 (モンテルカストとして 4mg 含有) を，2 剤 2 期クロスオーバー法 (休薬期間：7 日間) により健康成人男子 (10 名/群，計 20 名) に投与前 10 時間以上の絶食後，水 150mL とともに単回経口投与して，血漿中モンテルカスト (未変化体) 濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータを評価した結果，両剤の C_{max} 及び AUC₀₋₂₄ の対数変換データを用いて計算した両製剤の平均値の差の 90%信頼区間は，それぞれ log (0.9246) ~ log (1.0198) 及び log (0.8833) ~ log (0.9840) であり，いずれもガイドラインの基準である log (0.80) ~ log (1.25) の範囲内であった。以上の結果より，試験製剤と標準製剤は生物学的に同等であると判定した。

<薬物動態パラメータ>

	モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」	標準製剤 (細粒, 4mg)
C _{max} (ng/mL)	259.177±35.069	267.231±41.383
AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	1716±369	1841±403
AUC _{0-∞} (ng・hr/mL)	1796±435	1922±475
T _{max} (hr)	1.6±0.3	1.7±0.6
MRT (hr)	5.95±0.55	5.98±0.58
kel (hr ⁻¹)	0.1278±0.0172	0.1307±0.0169
t _{1/2} (hr)	5.53±0.83	5.40±0.83

(Mean±S.D., 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：

「VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目-7. 相互作用」の項を参照のこと。

VII. 薬物動態に関する項目

- (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：

該当資料なし

- (4) 消失速度定数：

モンテルカスト錠

健康成人男子にモンテルカスト錠 10mg 「タナベ」を絶食時単回経口投与したとき、消失速度定数は $0.1218 \pm 0.0205 \text{hr}^{-1}$ (Mean \pm S.D., n=24) であった¹⁵⁾。

モンテルカストチュアブル錠

健康成人男子にモンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」1錠を絶食時単回経口投与したとき、消失速度定数は $0.1772 \pm 0.0584 \text{hr}^{-1}$ (口中溶解後水なし投与, Mean \pm S.D., n=20), $0.1578 \pm 0.0469 \text{hr}^{-1}$ (口中溶解後水あり投与, Mean \pm S.D., n=20), $0.1967 \pm 0.0947 \text{hr}^{-1}$ (咀嚼後水なし投与, Mean \pm S.D., n=20), $0.1577 \pm 0.0564 \text{hr}^{-1}$ (咀嚼後水あり投与, Mean \pm S.D., n=20) であった¹⁶⁾。

モンテルカスト細粒

健康成人男子にモンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」1包を絶食時単回経口投与したとき、消失速度定数は $0.1278 \pm 0.0172 \text{hr}^{-1}$ (Mean \pm S.D., n=20) であった¹⁷⁾。

- (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：

該当資料なし

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>動物でのデータ

動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。（「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目-10」より）

(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：

該当資料なし

<参考>

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。（「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目-7」より）

(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：

該当資料なし

(2) 排泄率：

該当資料なし

(3) 排泄速度：

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

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

該当しない（現段階では定められていない）

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

該当しない（現段階では定められていない）

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

該当しない（現段階では定められていない）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

モンテルカスト錠

- (1) モンテルカスト製剤は、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) モンテルカスト製剤は気管支拡張剤、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。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

モンテルカストチュアブル錠

- (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) 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。

モンテルカスト細粒

- (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) 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。
- (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：

該当しない（現段階では定められていない）

(2) 併用注意とその理由：

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（頻度不明）

- 1) **アナフィラキシー**：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**：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**：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**：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**：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。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(3) その他の副作用：

次のような症状又は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。

種類	頻度	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
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：

該当しない

(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：

該当しない

(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（頻度不明）＜抜粋＞

1) **アナフィラキシー**：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＜抜粋＞

次のような症状又は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。

種類	頻度	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

該当しない（現段階では定められていない）

10. 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。〕

モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」

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

モンテルカスト錠

〈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。)

モンテルカストチュアブル錠

- (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。)

モンテルカスト細粒

- (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

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

モンテルカスト錠

モンテルカストチュアブル錠

(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。〕

(2) 食事の有無にかかわらず投与できる。

モンテルカスト細粒

(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

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。

16. その他

該当しない

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

<参考>

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。（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目-10」より）

(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

- (1) 製剤：該当しない
- (2) 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

モンテルカスト錠

遮光保存，室温保存，開封後は湿気を避けて保存のこと

モンテルカストチュアブル錠

遮光保存，室温保存（「取扱い上の注意」の項参照）

モンテルカスト細粒

室温保存

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：

モンテルカストチュアブル錠

開封後は，湿気を避けて保存すること。

(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）：

1) 留意事項

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目-10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与及び14. 適用上の注意」の項を参照のこと。

2) 患者用の使用説明書

患者向医薬品ガイド：あり

くすりのしおり：あり

(3) 調剤時の留意点について：

モンテルカスト細粒

本剤は光に不安定であるため，再分包しないこと。（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目-14」より）

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

- モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」 : 100 錠 (10 錠×10)
28 錠 (14 錠×2)
- モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」 : 100 錠 (10 錠×10)
28 錠 (14 錠×2)
140 錠 (14 錠×10)
- モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」 : 100 錠 (10 錠×10)
28 錠 (14 錠×2)
- モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」 : 100 包 (10 包×10)
14 包 (7 包×2)
140 包 (7 包×20)

7. 容器の材質

モンテルカスト錠

PTP 包装 : 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) + アルミニウム袋 (アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム) + 紙箱

モンテルカストチュアブル錠

PTP 包装 : 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) + アルミニウム袋 (アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム) + 紙箱

モンテルカスト細粒

アルミニウム袋分包品 (アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム) + ポリ袋 (ポリプロ
ピレン) + 紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬 :

シングレア錠 5mg, シングレア錠 10mg, シングレア OD 錠 10mg (MSD)

キプレス錠 5mg, キプレス錠 10mg, キプレス OD 錠 10mg (杏林)

同効薬 (ロイコトリエン受容体拮抗薬) :

ザフィルルカスト, プランルカスト水和物

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

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 「タナベ」	2016 年 8 月 15 日	22800AMX00594
モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」	2016 年 8 月 15 日	22800AMX00595
モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」	2017 年 2 月 15 日	22900AMX00279
モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」	2017 年 2 月 15 日	22900AMX00345

X. 管理的事項に関する項目

11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」	2016年12月9日
モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」	2016年12月9日
モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」	2017年6月16日
モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」	2017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

- 一部変更承認年月日：2016年11月9日
内容：「気管支喘息」を効能又は効果，用法及び用量に追加

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（あるいは投与）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	レセプト電算コード
モンテルカスト錠 5mg 「タナベ」	125275001	4490026F3241	622527501
モンテルカスト錠 10mg 「タナベ」	125276701	4490026F2261	622527601
モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」	125579901	4490026F1249	622557901
モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」	125580501	4490026C1145	622558001

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) モンテルカスト錠の安定性に関わる資料 (社内資料)
- 2) モンテルカストチュアブル錠の安定性に関わる資料 (社内資料)
- 3) モンテルカスト細粒の安定性に関わる資料 (社内資料)
- 4) モンテルカスト錠の無包装状態での安定性に関わる資料 (社内資料)
- 5) モンテルカストチュアブル錠の無包装状態での安定性に関わる資料 (社内資料)
- 6) モンテルカスト細粒の無包装状態での安定性に関わる資料 (社内資料)
- 7) モンテルカスト錠の一次包装品 (PTP) の安定性に関わる資料 (社内資料)
- 8) モンテルカストチュアブル錠の一次包装品 (PTP) の安定性に関わる資料 (社内資料)
- 9) モンテルカスト錠の溶出性に関わる資料 (社内資料)
- 10) モンテルカスト錠の溶出挙動の類似性に関わる資料 (社内資料)
- 11) モンテルカストチュアブル錠の溶出性に関わる資料 (社内資料)
- 12) モンテルカストチュアブル錠の溶出挙動に関わる資料 (社内資料)
- 13) モンテルカスト細粒の溶出挙動に関わる資料 (社内資料)
- 14) 第十七改正日本薬局方解説書, 廣川書店 2016 ; C-5593-C-5603
- 15) モンテルカスト錠の生物学的同等性に関わる資料 (社内資料)
- 16) モンテルカストチュアブル錠の生物学的同等性に関わる資料 (社内資料)
- 17) モンテルカスト細粒の生物学的同等性に関わる資料 (社内資料)
- 18) モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」 の配合変化試験に関わる資料 (社内資料)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない（本剤は外国では発売していない）

<参考>

モンテルカストナトリウム（Montelukast Sodium）として、米国*1、英国*2等で発売されている（2017年5月現在）。

*1. DailyMed < <http://dailymed.nlm.nih.gov/dailymed/about.cfm> >

*2. eMC < <http://www.medicines.org.uk/emc/> >

2. 海外における臨床支援情報

妊婦への投与に関する情報

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米FDA、オーストラリア分類とは異なる。

【使用上の注意】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。〕

モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」

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。

	分類
FDA : Pregnancy Category	B (2016年6月) *1
オーストラリアの分類	B1 (2018年3月) *2

*1. DailyMed [SINGULAIR- montelukast sodium tablet, film coated (Merck Sharp & Dohme Corp.), 2016年6月改訂 <<https://dailymed.nlm.nih.gov/dailymed/drugInfo.cfm?setid=8c166755-7711-4df9-d689-8836a1a70885>>]

*2. Prescribing medicines in pregnancy database(Australian Government)<<https://www.tga.gov.au/hp/medicines-pregnancy.htm>>

参考：分類の概要

FDA : B

Animal studies have revealed no evidence of harm to the fetus, however, there are no adequate and well-controlled studies in pregnant women. OR Animal studies have shown an adverse effect, but adequate and well-controlled studies in pregnant women have failed to demonstrate a risk to the fetus in any trimester.

オーストラリアの分類：B1

Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals have not shown evidence of an increased occurrence of fetal damage.

XIII. 備考

その他の関連資料

配合変化試験に関する資料¹⁸⁾

(1) 試験条件

モンテルカスト細粒 4mg 「タナベ」 2包（モンテルカストとして 8mg）と下記の食品 13 種（各 5g）を混合し、室内散光下又は遮光・室温で保存した。配合直後、6 分後、15 分後及び 30 分後に純度試験（類縁物質）を実施し、配合変化を観察した。

(2) 試験結果

1. 保管条件：室内散光下（蛍光灯下 500～600lx）・室温・湿度成り行き

配合物	配合直後	6 分後	15 分後	30 分後
服薬ゼリー	適合	適合	適合	不適合
麦茶	適合	適合	適合	不適合
ゼリー	適合	適合	適合	不適合
100%フルーツジュース (リンゴ)	適合	適合	不適合	不適合
100%フルーツジュース (オレンジ)	適合	適合	適合	適合
スポーツ飲料	適合	適合	不適合	不適合
野菜ジュース	適合	適合	適合	適合
乳酸菌飲料	適合	適合	適合	不適合
アイスクリーム	適合	適合	適合	不適合
おかゆ	適合	適合	適合	適合
りんご	適合	適合	適合	適合
にんじんフレーク	適合	適合	適合	適合
粉ミルク	適合	適合	適合	適合

2. 保管条件：遮光・室温・湿度成り行き

配合物	配合直後	6 分後	15 分後	30 分後
服薬ゼリー	適合	適合	適合	適合
麦茶	適合	適合	適合	適合
ゼリー	適合	適合	適合	適合
100%フルーツジュース (リンゴ)	適合	適合	適合	適合
100%フルーツジュース (オレンジ)	適合	適合	適合	適合
スポーツ飲料	適合	適合	適合	適合
野菜ジュース	適合	適合	適合	適合
乳酸菌飲料	適合	適合	適合	適合
アイスクリーム	適合	適合	適合	適合
おかゆ	適合	適合	適合	適合
りんご	適合	適合	適合	適合
にんじんフレーク	適合	適合	適合	適合
粉ミルク	適合	適合	適合	適合