2024年3月改訂（第8版）

日本標準商品分類番号
87449

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[一部2018(2019年更新版に準拠)]

ロイコトリエン受容体拮抗薬

気管支喘息・アレルギー性鼻炎治療薬
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「オーハラ」
モンテルカスト錠10mg「オーハラ」

MONTELUKAST TABLETS 5mg, 10mg「OHARA」

気管支喘息治療薬
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「オーハラ」

MONTELUKAST CHEWABLE TABLETS 5mg「OHARA」

剤形	錠：錠剤(フィルムコーティング錠) チュアブル錠：錠剤(素錠)
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	5mg錠/チュアブル錠:1錠中モンテルカストとして5mgを含有する。 10mg錠:1錠中モンテルカストとして10mg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	5, 10mg錠 製造販売承認年月日:2016年 8 月15日 薬価基準収載年月日:2016年12月 9 日 発売年月日:2016年12月 9 日 5mgチュアブル錠 製造販売承認年月日:2017年 2 月15日 薬価基準収載年月日:2017年 6 月16日 発売年月日:2017年 6 月16日
開発・製造販売(輸入)・提携・販売会社名	製造販売元：大原薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	大原薬品工業株式会社　お客様相談室 フリーダイヤル 0120-419-363 URL　https://www.ohara-ch.co.jp

本IFは2022年8月改訂(錠)・2022年8月改訂(チュアブル錠)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。

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
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） ･･････････････････････････････････ 3
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 ･････････････････････ 3
7. CAS 登録番号･････････････････････････････････････ 3

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

Ⅳ　製剤に関する項目
1. 剤形 ･･ 5
2. 製剤の組成 ･･････････････････････････････････････ 6
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 ･････････････････ 6
4. 製剤の各種条件下における安定性 ･･････････････････ 6
5. 調製法及び溶解後の安定性 ･････････････････････････ 7
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） ･･････････････ 7
7. 溶出性 ･･ 8
8. 生物学的試験法 ･･････････････････････････････････ 14
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 ･････････････････････ 14
10. 製剤中の有効成分の定量法 ･････････････････････････ 14
11. 力価 ･･ 14
12. 混入する可能性のある夾雑物 ･･････････････････････ 15
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 15
14. その他 ･･･ 15

Ⅴ　治療に関する項目
1. 効能又は効果 ････････････････････････････････････ 16
2. 用法及び用量 ････････････････････････････････････ 16
3. 臨床成績 ･･ 16

Ⅵ　薬効薬理に関する項目
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ･････････････ 18
2. 薬理作用 ･･ 18

Ⅶ　薬物動態に関する項目
1. 血中濃度の推移・測定法 ･･････････････････････････ 19
2. 薬物速度論的パラメータ ･･････････････････････････ 24
3. 吸収 ･･ 25
4. 分布 ･･ 25
5. 代謝 ･･ 26
6. 排泄 ･･ 26
7. トランスポーターに関する情報･･････････････････････ 26
8. 透析等による除去率･･･････････････････････････････ 26

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･･･････････････････････････････ 27
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） ･･････････････ 27
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由･･ 27
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由･･ 27
5. 慎重投与内容とその理由･･･････････････････････････ 27
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法･････････ 27
7. 相互作用 ･･ 28
8. 副作用 ･･ 289
9. 高齢者への投与･･･････････････････････････････････ 29
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与･･･････････････････ 30
11. 小児等への投与･･････････････････････････････････ 30
12. 臨床検査結果に及ぼす影響･･･････････････････････ 30
13. 過量投与 ･･･････････････････････････････････････ 30
14. 適用上の注意 ･･･････････････････････････････････ 30
15. その他の注意 ･･･････････････････････････････････ 31
16. その他 ･･･ 31

Ⅸ　非臨床試験に関する項目
1. 薬理試験 ･･ 32
2. 毒性試験 ･･ 32

Ⅹ　管理的事項に関する項目
1. 規制区分 ･･ 33
2. 有効期間又は使用期限･････････････････････････････ 33
3. 貯法・保存条件･･･････････････････････････････････ 33
4. 薬剤取扱い上の注意点･････････････････････････････ 33
5. 承認条件等 ･･････････････････････････････････････ 33
6. 包装 ･･ 34
7. 容器の材質 ･･････････････････････････････････････ 34
8. 同一成分・同効薬･････････････････････････････････ 34
9. 国際誕生年月日･･･････････････････････････････････ 34
10. 製造販売承認年月日及び承認番号･･･････････････････ 34
11. 薬価基準収載年月日･･････････････････････････････ 34
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･･････････････････････････ 35
13. 再審査結果，再評価結果公表年月日
及びその内容･･･････････････････････････････ 35
14. 再審査期間 ･････････････････････････････････････ 35
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報･･････････････････ 35

16. 各種コード ····· 35
17. 保険給付上の注意 ····· 35

ＸＩ　文献
1. 引用文献 ····· 36
2. その他の参考文献 ····· 36

ＸⅡ　参考資料
1. 主な外国での発売状況 ····· 37
2. 海外における臨床支援情報 ····· 37

ＸⅢ　備考
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての
参考情報 ····· 38
2. その他の関連資料 ····· 39

付表 ····· 40

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(一般名)は、ロイコトリエン受容体拮抗薬でり、本邦では2001年に上市されている。

モンテルカスト錠5mg、10mg「オーハラ」は、大原薬品工業株式会社が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)(付表参照)に基づき規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2016年8月に承認を取得した。その後、「気管支喘息」の効能・効果追加の一部変更承認申請を行い、2016年11月に承認を取得し、2016年12月に上市された。

モンテルカストチュアブル錠5mg「オーハラ」は大原薬品工業株式会社が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)(付表参照)に基づき規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2017年2月に承認を取得、2017年6月に上市された。

なお、本剤は後発医薬品として、大原薬品工業株式会社、浜里薬品株式会社と他1社の3社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

２．製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 本剤は気管支喘息、アレルギー性鼻炎の治療薬である。(「Ⅴ．治療に関する項目」参照)

(2) 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。[1)](「Ⅵ．薬効薬理に関する項目」参照)

(3) 成分名、含量、屋号が印字された錠剤である。

(4) 成分名、含量、屋号、GS1コードが表示されたPTPシートである。

(5) 個装箱には QR コード(添付文書)、錠剤イメージ図、製品情報カード、新バーコードの4つの製品情報が盛り込まれている。

(6) 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**(いずれも頻度不明)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」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「オーハラ」

モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」

モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」

（2）洋名

MONTELUKAST TABLETS 5mg「OHARA」

MONTELUKAST TABLETS 10mg「OHARA」

MONTELUKAST CHEWABLE TABLETS 5mg「OHARA」

（3）名称の由来

通知「薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した。

２．一般名

（1）和名（命名法）

モンテルカストナトリウム（JAN）

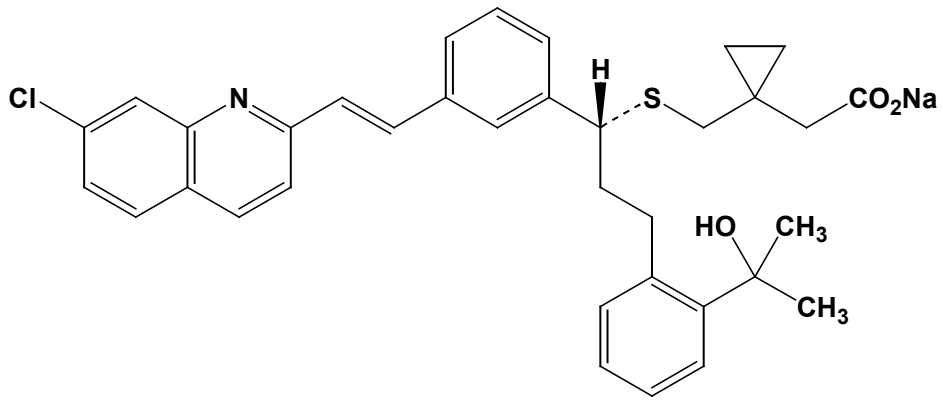
（2）洋名（命名法）

Montelukast Sodium（JAN）

（3）ステム

-lukast：leukotriene receptor antagonists

３．構造式又は示性式



４．分子式及び分子量

（1）分子式：$C_{35}H_{35}ClNNaO_3S$

（2）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-(2-hydroxypropan-2-yl)phenyl]propyl}sulfanyl]methyl]cyclopropyl}acetate

６．慣用名，別名，略号，記号番号

モンテルカスト錠 5mg「オーハラ」　：TM-24
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」　：TM-25
モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」：TM-23

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

本品は白色～微黄白色の粉末である。

（2）溶解性

モンテルカストナトリウム原薬の溶解性

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
メタノール	極めて溶けやすい
エタノール(99.5)	極めて溶けやすい
水	溶けやすい

（3）吸湿性

本品は吸湿性である。

（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

本品は光によって黄色に変化する。

本品は結晶多型が認められる。

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

日局「モンテルカストナトリウム」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

４．有効成分の定量法

日局「モンテルカストナトリウム」による。

液体クロマトグラフィー

Ⅳ. 製剤に関する項目

1．剤形

(1) 剤形の区別，外観及び性状

区別：錠　錠剤(フィルムコーティング錠)
　　チュアブル錠　錠剤(素錠)

販売名	剤形	色調	外形・サイズ・識別コード			
			表面	裏面	側面	識別コード※
モンテルカスト錠5mg「オーハラ」	フィルムコーティング錠	淡橙色				モンテルカスト 5 オーハラ
			直径：6.6mm　厚さ：3.5mm 重量：104 mg			
モンテルカスト錠10mg「オーハラ」	フィルムコーティング錠	淡橙色				モンテルカスト 10 オーハラ
			直径：8.1mm　厚さ：4.1mm 重量：206 mg			
モンテルカストチュアブル錠5mg「オーハラ」	素錠	淡赤色				モンテルカスト 5 オーハラ チュアブル
			直径：9.7mm　厚さ：4.5mm 重量：300 mg			

※錠剤両面に印刷表示

(2) 製剤の物性 [1,2]

品名	硬度※(N, n=3)
モンテルカスト錠 5mg「オーハラ」	60[1]
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」	87[1]
モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」	75[2]

(3) 識別コード

モンテルカスト錠 5mg「オーハラ」　：モンテルカスト 5 オーハラ
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」：モンテルカスト 10 オーハラ
モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」：
　　モンテルカスト 5 オーハラ チュアブル

(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「オーハラ」　：1 錠中モンテルカストとして 5mg 含有
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」：1 錠中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「オーハラ」：
1 錠中モンテルカストとして 5mg 含有

（2）添加物

モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」：
結晶セルロース、乳糖水和物、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、ステアリン酸マグネシウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、酸化チタン、マクロゴール 4000、タルク、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「オーハラ」：
D-マンニトール、結晶セルロース、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、ステアリン酸マグネシウム、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、三二酸化鉄、香料

（3）その他

該当資料なし

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) 長期保存条件下での安定性[3)]

- 保存形態：PTP 包装 ：PTP(ポリプロピレン、アルミニウム)包装したものをアルミピロー(ポリエチレンはり合わせアルミニウム)に入れ封を施し、紙箱に入れた。
- 保存条件：25℃(±2℃)、60%RH(±5%RH)
- 保存期間：36 ヵ月
- 試験項目：性状、確認試験、純度試験（類縁物質）、含量均一性試験、溶出試験、定量
- 試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

保存条件	期間	保存形態	結果
25℃(±2℃)、60%RH(±5%RH)	36 ヵ月	PTP 包装	類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。

(2) 加速条件下での安定性試験[4)]

・ 保存形態：PTP 包装 ：PTP(ポリプロピレン、アルミニウム)包装したものをアルミピロー(ポリエチレンはり合わせアルミニウム)に入れ封を施し、紙箱に入れた。
・ 保存条件：40℃(±1℃)、75%RH(±5%RH)
・ 保存期間：6 ヵ月
・ 試験項目：性状、確認試験、純度試験（類縁物質）、含量均一性試験、溶出試験、定量
・ 試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

保存条件	期間	保存形態	結果
40℃(±1℃)、75%RH(±5%RH)	6 ヵ月	PTP 包装	すべて変化なし

(3) 無包装安定性試験[1,2)]

無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験(性状、純度試験、溶出試験、定量)を行った。

1) モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」

	試験条件	結果
温度	40℃、3 ヵ月(遮光・気密容器)	類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。
湿度	25℃、75%RH、3 ヵ月(遮光・開放)	類縁物質増加(規格内)及び硬度低下(規格内)。その他は変化なし。
光	総照射量 60 万 lx・hr(開放)	類縁物質増加(規格外)及び含量低下(規格外)。その他は変化なし。

2) モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」

	試験条件	結果
温度	40℃、3 ヵ月(遮光・気密容器)	類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。
湿度	25℃、75%RH、3 ヵ月(遮光・開放)	類縁物質増加(規格内)及び硬度低下(規格内)。その他は変化なし。
光	総照射量 15 万 lx・hr(開放)	類縁物質増加(規格外)及び含量低下(規格内)。その他は変化なし。

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

(1) 日局溶出試験[4)]

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」により、試験を行う。

条件：回転数　50rpm

試験液　ラウリル硫酸ナトリウム溶液(1→200)

試験結果：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(20 分間の溶出率が 85%以上)又は「モンテルカストナトリウムチュアブル錠」の溶出規格(20 分間の溶出率が 85%以上)に適合した。

	時間	溶出率※ (最小値～最大値)
モンテルカスト錠 5mg「オーハラ」	20 分	94.6% (90.0～98.8%)
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」	20 分	94.4% (91.1～96.5%)
モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」	20 分	96.0% (93.1～100.1%)

※:3Lot 平均値

(2) 後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験[5)]

後発医薬品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)に準じ試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

試験液量：900mL

温度　　：37℃±0.5℃

試験結果：「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に適合した。これによりモンテルカスト錠 10mg「オーハラ」及びモンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」の溶出挙動は、全ての試験条件において標準製剤と類似していると判定された。

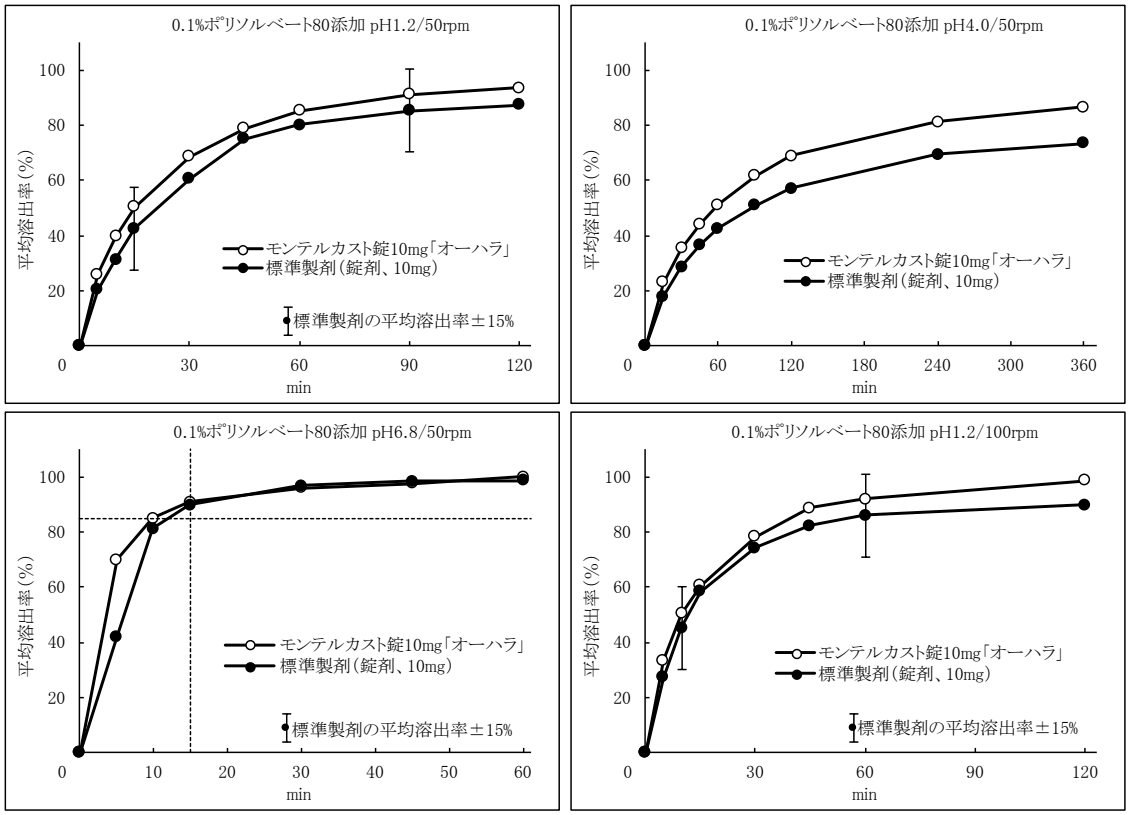
1）モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」：0.1%ポリソルベート 80 添加

表 溶出挙動における類似性

試験条件		判定時点（分）	平均溶出率(%) 試験製剤	平均溶出率(%) 標準製剤（錠剤、10mg）	類似性の判定基準	判定
50rpm	pH1.2	15	50.5	42.5	15 及び 90 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似
		90	91.0	85.2		
	pH4.0	f2=51			f2 関数の値が 46 以上	類似
	pH6.8	15	90.8	89.8	試験製剤が 15 分間に平均 85%以上溶出	類似
100rpm	pH1.2	10	50.5	45.2	10 及び 60 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似
		60	92.0	86.0		

(n=12)

（溶出曲線）



試験液： pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液　pH4.0=薄めたMcllvaineの緩衝液
pH6.8=日本薬局方溶出試験液の第2液

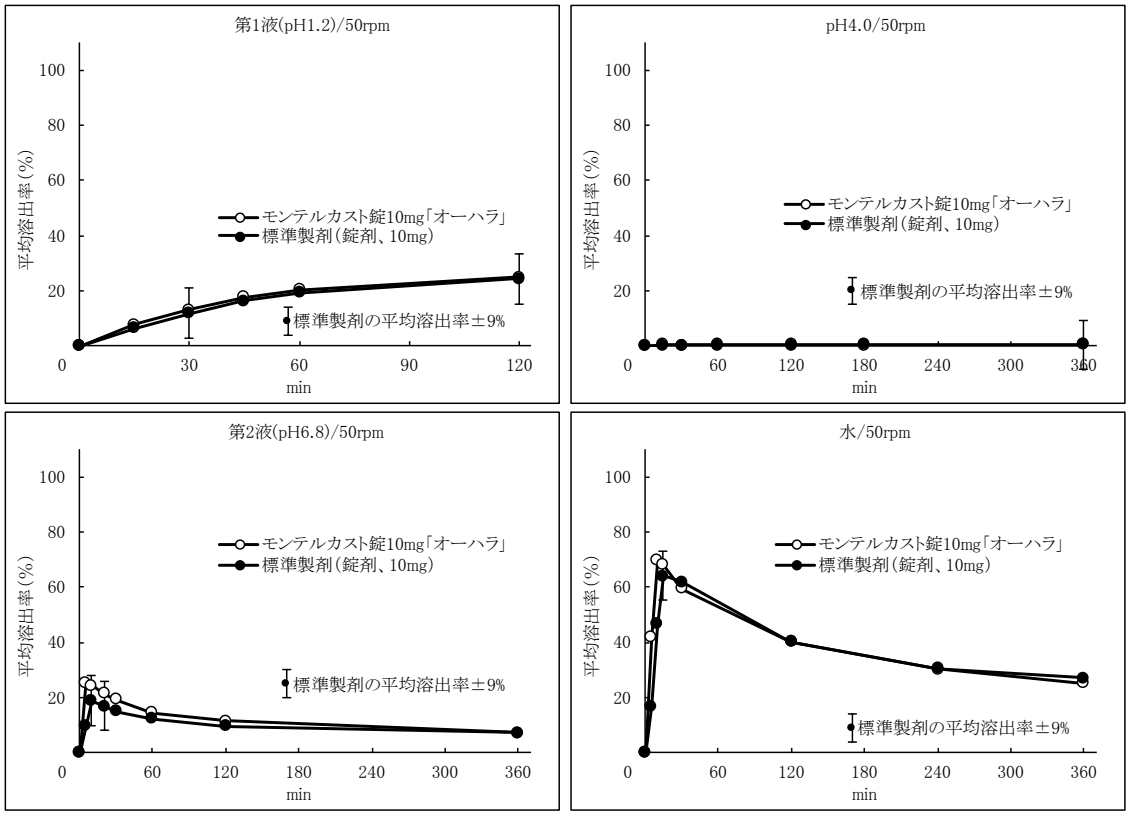
2）モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」：ポリソルベート 80 無添加

表 溶出挙動における類似性

試験条件		判定時点（分）	平均溶出率(%) 試験製剤	平均溶出率(%) 標準製剤（錠剤、10mg）	類似性の判定基準	判定
50rpm	pH1.2	30	13.1	11.8	30 及び 120 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似
		120	25.0	24.3		
	pH4.0	360	0.6	0.5	360 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似
	pH6.8	10	24.4	18.9	10 及び 20 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似
		20	21.5	17.0		
	水	15	68.0	64.1	15 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似

（n=12）

（溶出曲線）



試験液：　pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液　　pH4.0=薄めたMcllvaineの緩衝液
　　pH6.8=日本薬局方溶出試験液の第2液　　水=日本薬局方精製水

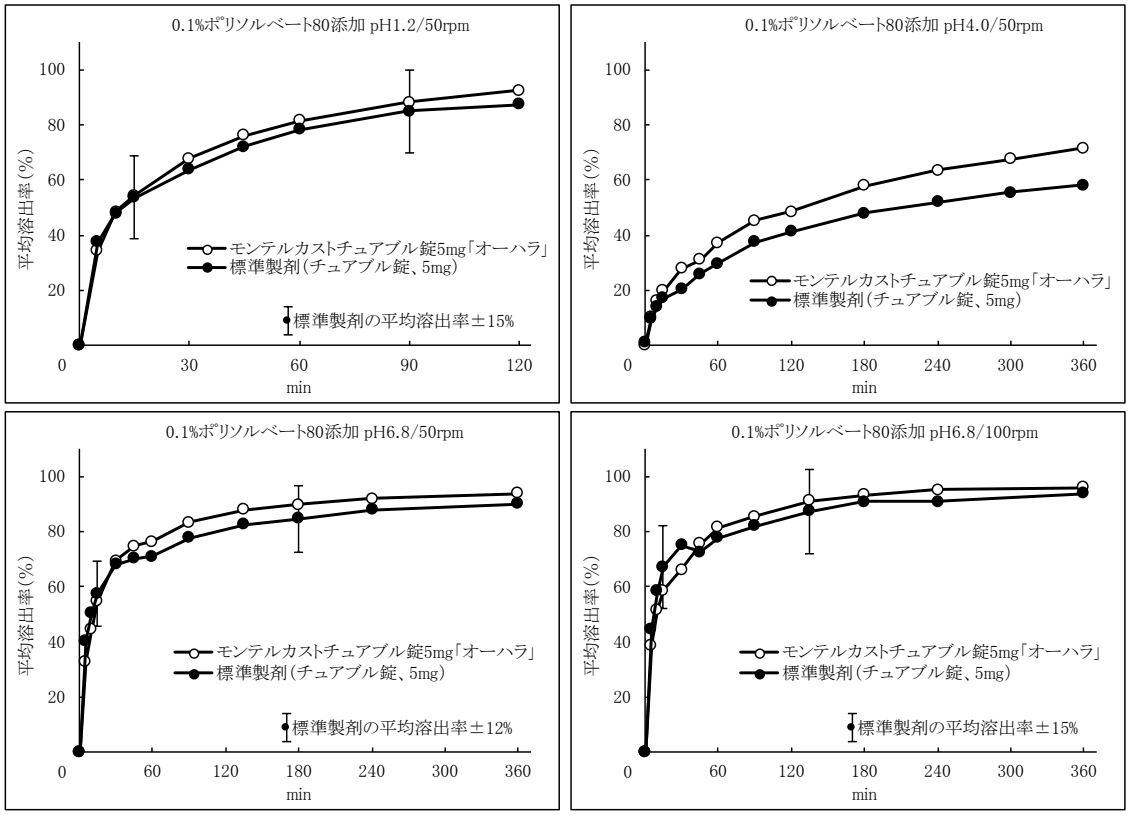
3）モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」：0.1%ポリソルベート 80 添加

表 溶出挙動における類似性

試験条件		判定時点（分）	平均溶出率(%) 試験製剤	平均溶出率(%) 標準製剤（ﾁｭｱﾌﾞﾙ錠、5mg）	類似性の判定基準	判定
50rpm	pH1.2	15	54.4	53.5	15 及び 90 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似
		90	88.1	84.8		
	pH4.0	f2=56			f2 関数の値が 46 以上	類似
	pH6.8	15	55.0	57.5	15 及び 180 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±12%の範囲	類似
		180	89.8	84.7		
100rpm	pH6.8	15	58.8	97.3	15 及び 135 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似
		135	91.0	87.2		

(n=12)

（溶出曲線）



試験液：　pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液　　pH4.0=薄めたMcllvaineの緩衝液
pH6.8=日本薬局方溶出試験液の第2液

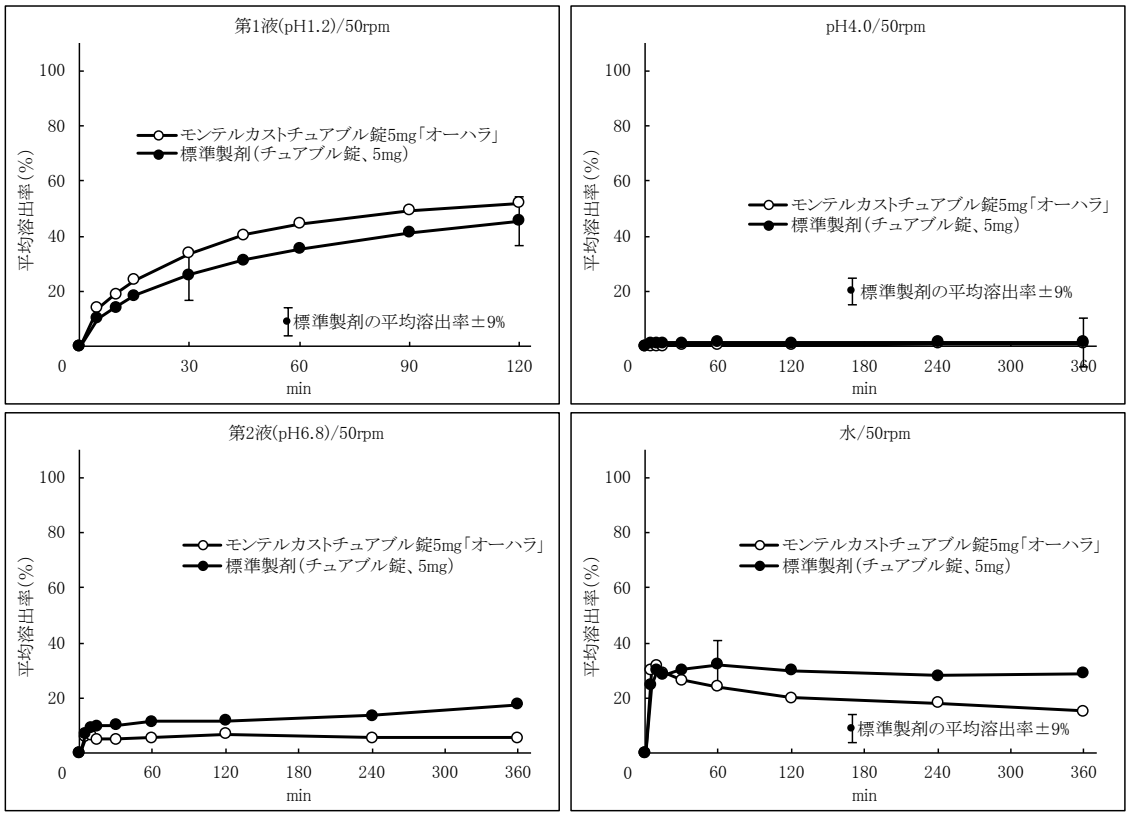
4) モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」：ポリソルベート 80 無添加

表 溶出挙動における類似性

試験条件		判定時点(分)	平均溶出率(%)		類似性の判定基準	判定
			試験製剤	標準製剤(ﾁｭｱﾌﾞﾙ錠、5mg)		
50rpm	pH1.2	30	33.7	25.9	30 及び 120 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似
		120	52.0	45.5		
	pH4.0	360	1.2	1.6	360 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似
	pH6.8	f2=59			f2 関数の値が 53 以上	類似
	水	60	24.1	32.1	60 分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似

(n=12)

(溶出曲線)



試験液: pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液　pH4.0=薄めたMcllvaineの緩衝液
pH6.8=日本薬局方溶出試験液の第2液　水=日本薬局方精製水

(3) 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基づく溶出試験[6)]

「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、試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」

試験液量：900mL

温度　　：37℃±0.5℃

試験結果：モンテルカスト錠5mg「オーハラ」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」A 水準の判定基準に適合した。これによりモンテルカスト錠10mg「オーハラ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等と判断され、生物学的に同等とみなされた。

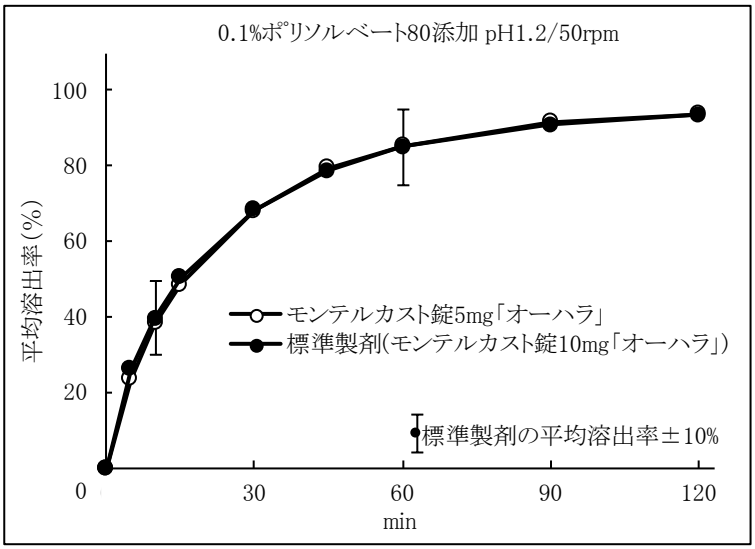
① 平均溶出率での判定

表 溶出挙動における同等性

試験条件		判定時点(分)	平均溶出率(%)		同等性の判定基準	判定
			試験製剤	標準製剤(錠剤、10mg)		
50rpm	pH1.2	10	38.3	39.7	10及び60分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±10%の範囲	同等
		60	85.2	85.1		

標準製剤：モンテルカスト錠10mg「オーハラ」　LotNo.0T02　(n=12)

(溶出曲線)



試験液:　pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液

② 個々の溶出率での判定

試験条件		判定時点(分)	モンテルカスト錠5mg「オーハラ」の溶出率			同等性の判定基準(最終比較時点での個々検体(n=12)の溶出条件)	判定
			最小値(%)	最大値(%)	平均溶出率(%)		
50rpm	0.1%PS80添加 pH1.2	120	92.0	95.5	93.8	最終比較時点での個々の溶出率について、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。	同等

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 5mg、10mg「オーハラ」

日局「モンテルカストナトリウム錠」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 5mg「オーハラ」

日局「モンテルカストナトリウムチュアブル錠」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

モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」

日局「モンテルカストナトリウム錠」による。

液体クロマトグラフィー

モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」

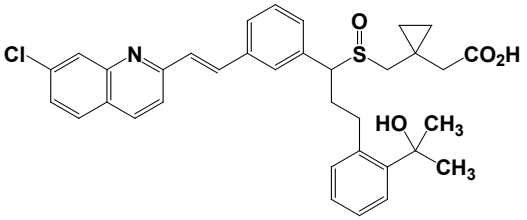
日局「モンテルカストナトリウムチュアブル錠」による。

液体クロマトグラフィー

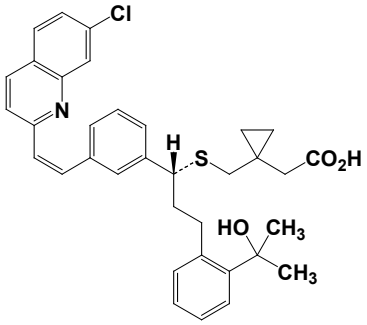
11. 力価

該当しない

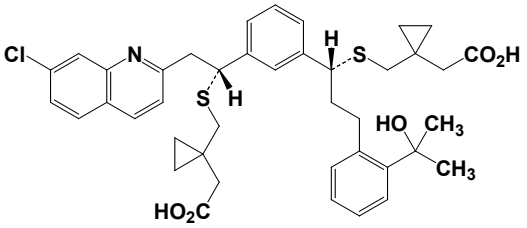
12. 混入する可能性のある夾雑物[7)]



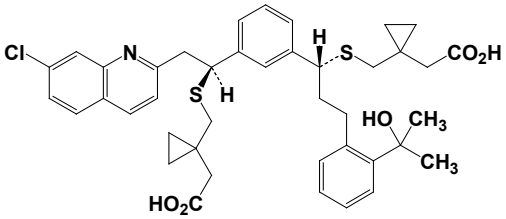
類縁物質 A



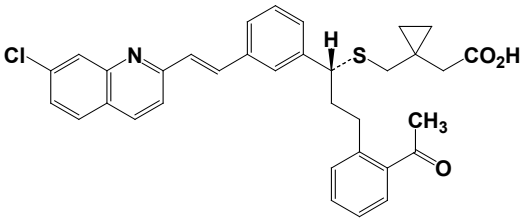
類縁物質 B



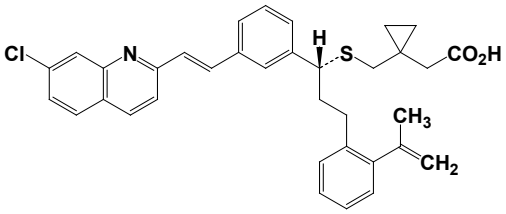
類縁物質 C



類縁物質 D



類縁物質 E



類縁物質 F

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

特になし

14. その他

特になし

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、10mg「オーハラ」

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 5mg「オーハラ」

気管支喘息

２．用法及び用量

モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」

〈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 5mg「オーハラ」

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、かみくだいて服用すること。

(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。

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

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

該当資料なし

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

１．薬理学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(プランルカスト水和物)

２．薬理作用

(1) 作用部位・作用機序 [7)]

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

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[8,9)]

モンテルカスト錠10mg「オーハラ」を1錠：3.2時間

モンテルカストチュアブル錠5mg「オーハラ」を1錠：

口中溶解（水なし）：2.6時間

咀　　嚼（水なし）：2.8時間

口中溶解（水あり）：2.7時間

咀　　嚼（水あり）：2.8時間

（3）臨床試験で確認された血中濃度[8,9)]

生物学的同等性試験

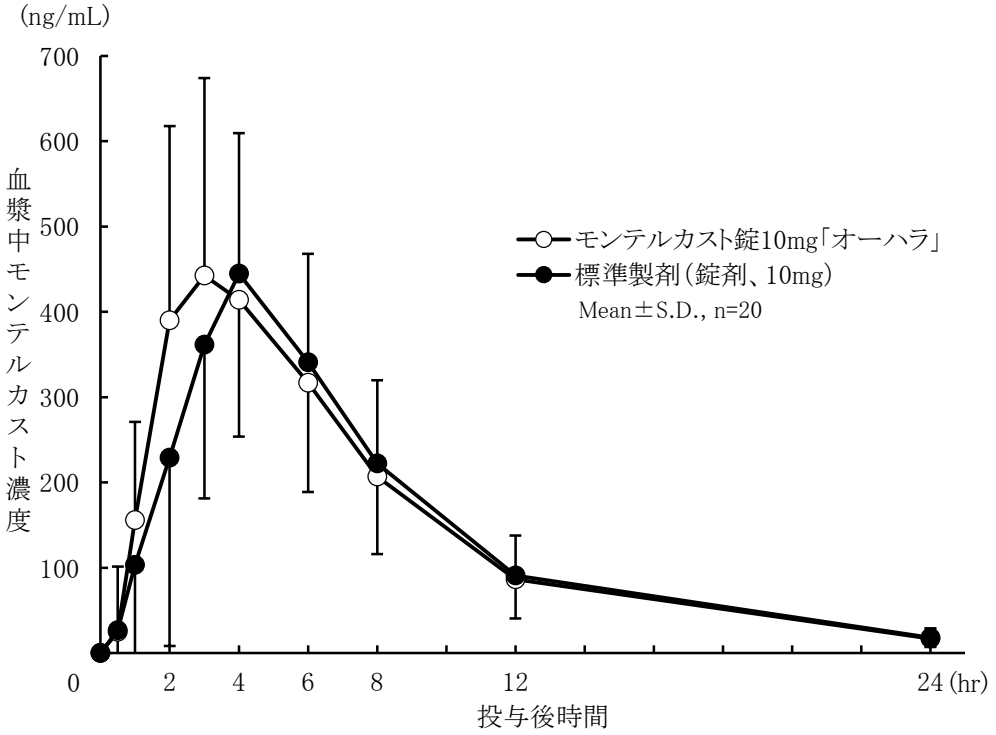
1）モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」

モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」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})について統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

薬物動態パラメータ

	n	$AUC_{0\to24}$ (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	t_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」	20	3631.15±1284.45	529.69±168.95	3.2±1.3	4.5±0.5
標準製剤（錠剤、10mg）	20	3541.82±1314.56	498.10±180.25	2.6±1.2	4.5±0.7

(Mean±S.D.)



血漿中モンテルカスト濃度の推移

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、血液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2) モンテルカストチュアブル錠 5mg「「オーハラ」

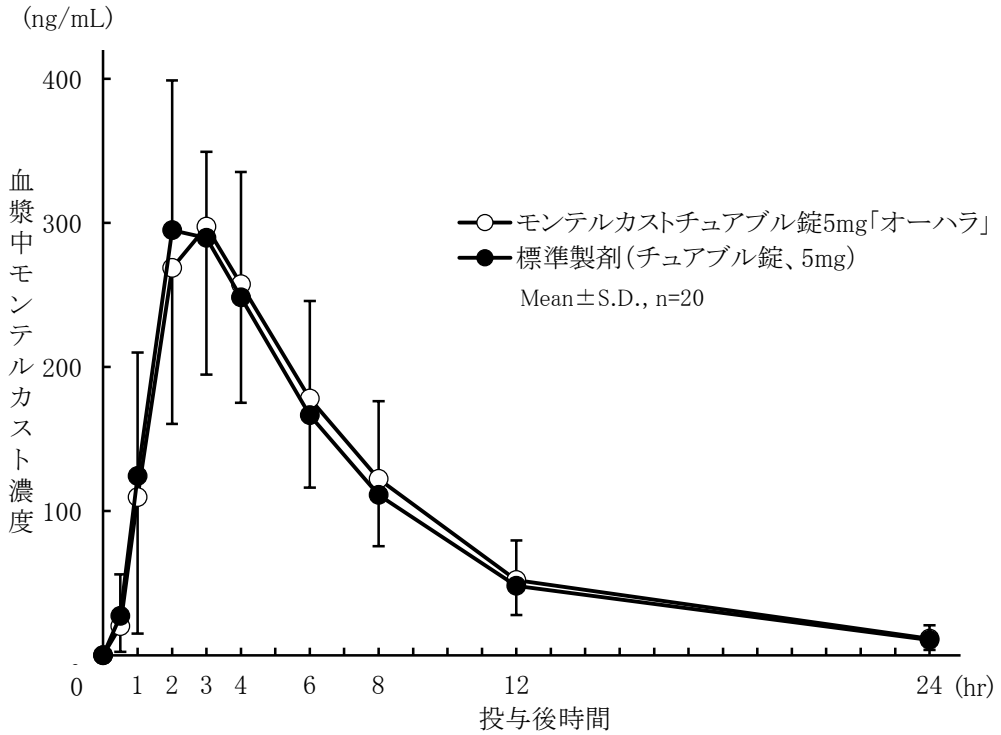
モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(モンテルカストとして5mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

①口中溶解(水なし)

薬物動態パラメータ

	n	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 「オーハラ」	20	2253.52±753.03	336.18±68.55	2.6±0.8	4.5±0.7
標準製剤 (チュアブル錠、5mg)	20	2180.01±591.95	344.64±66.39	2.5±0.8	4.5±0.7

(Mean±S.D.)



血漿中モンテルカスト濃度の推移

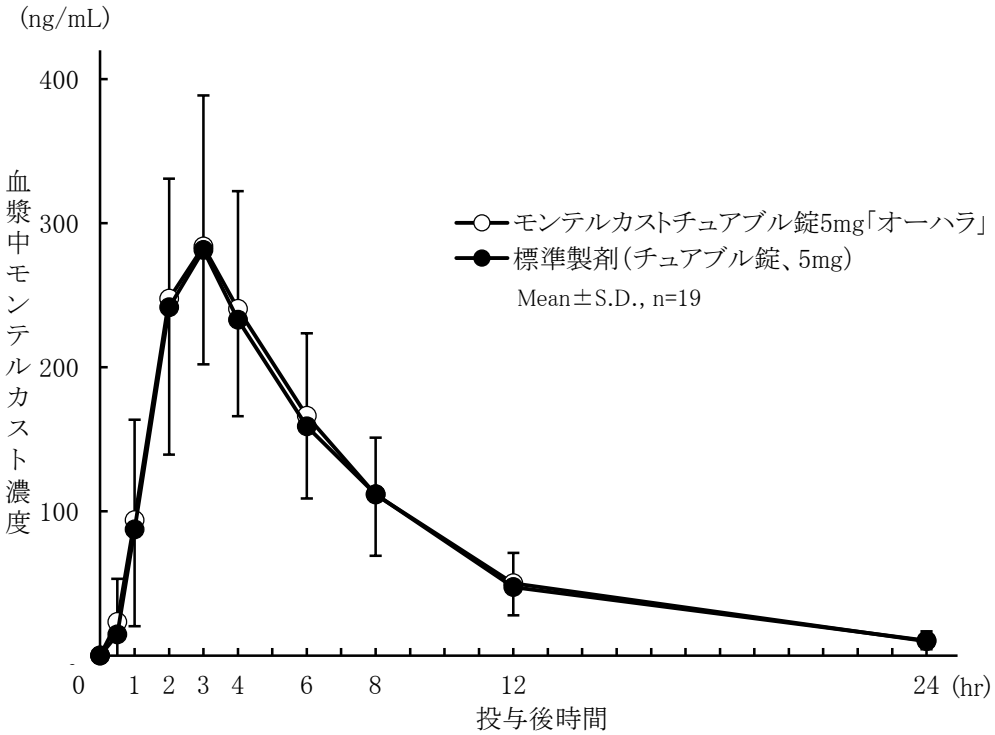
血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、血液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

②咀嚼(水なし)

薬物動態パラメータ

	n	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 「オーハラ」	19	2102.29±596.71	312.66±85.91	2.8±1.0	4.5±0.5
標準製剤 (チュアブル錠、5mg)	19	2040.84±544.53	304.27±66.02	2.6±0.7	4.5±0.6

(Mean±S.D.)



血漿中モンテルカスト濃度の推移

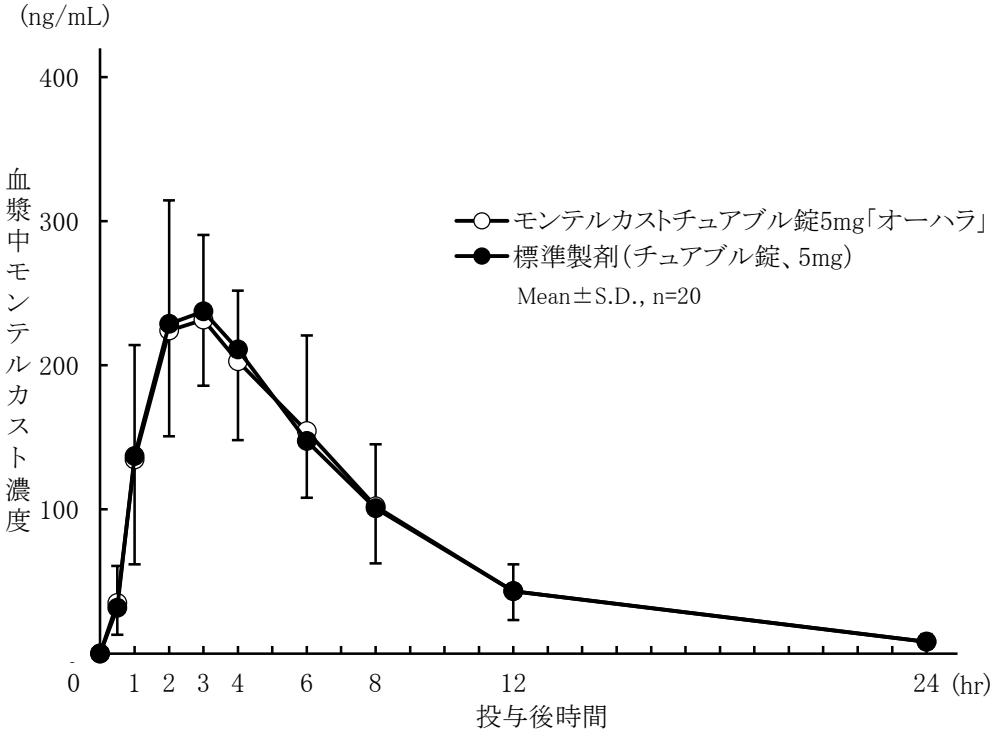
血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、血液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

③口中溶解(水あり)

薬物動態パラメータ

	n	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 「オーハラ」	20	1887.69±462.79	269.27±43.91	2.7±1.1	4.3±0.5
標準製剤 (チュアブル錠、5mg)	20	1893.38±402.09	275.43±49.88	2.8±1.1	4.3±0.6

(Mean±S.D.)



血漿中モンテルカスト濃度の推移

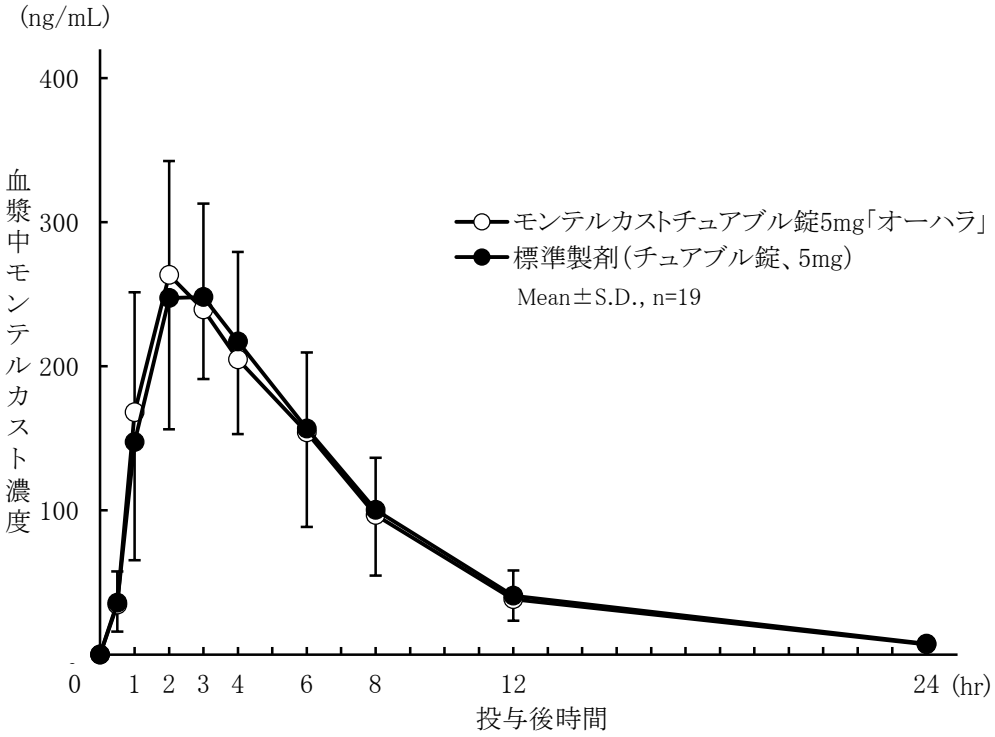
血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、血液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

④咀嚼(水あり)

薬物動態パラメータ

	n	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 「オーハラ」	19	1901.68±405.21	302.74±45.33	2.8±1.4	4.2±0.6
標準製剤 (チュアブル錠、5mg)	19	1935.60±477.62	297.25±58.37	2.7±1.1	4.2±0.5

(Mean±S.D.)



血漿中モンテルカスト濃度の推移

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、血液の採取回数・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。

(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

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目　1. 血中濃度の推移・測定法　(3)臨床試験で確認された血中濃度」の項を参照のこと。

(4) 消失速度定数[8,9]

モンテルカスト錠 10mg

健康成人男子単回投与

	10mg (n=20)
Kel(/hr)	0.1557±0.0166

(Mean±S.D.)

モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」

健康成人男子単回投与

	口中溶解(水なし) (n=20)	咀嚼(水なし) (n=19)	口中溶解(水あり) (n=20)	咀嚼(水あり) (n=19)
Kel(/hr)	0.1589±0.0222	0.1574±0.0173	0.1646±0.0211	0.1669±0.0228

(Mean±S.D.)

(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[7]

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α_1-酸性糖蛋白質の両方に 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

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. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与(2)」の項を参照)

(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

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。

（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

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

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

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

慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

(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[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おと。
(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。

[]内はモンテルカストチュアブル錠5mg「オーハラ」

６．重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

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

（2）併用注意とその理由

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（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。

(3)その他の副作用

次のような症状又は異常があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	副作用の頻度
	頻度不明
過敏症	皮疹、瘙痒、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(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。
(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。

9. 高齢者への投与

該当しない

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女性には、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) 授乳中の女性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。〕

11. 小児等への投与

モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」
〈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 5mg「オーハラ」
(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。〕

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

(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) 本剤は食事の有無にかかわらず投与できる。

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

特になし

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

（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

製剤：モンテルカスト錠 5mg「オーハラ」　該当しない
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」　該当しない
モンテルカストナトリウム錠 5mg「オーハラ」　該当しない
有効成分：モンテルカストナトリウム　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）※

※ **安定性試験**：最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヵ月）の結果、モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」及びモンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」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[4)]。

３．貯法・保存条件

室温保存、気密容器、遮光（開封後は湿気を避けて保存すること。）

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

該当資料なし

（2）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

・その他「**Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目　14. 適用上の注意**」の項を参照すること。
・くすりのしおり：有り
・患者向医薬品ガイド：有り

（3）調剤時の留意点について

該当資料なし

５．承認条件等

該当しない

６．包装

モンテルカスト錠 5mg「オーハラ」　：　（PTP）100 錠（10 錠×10×1 袋）
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」：　（PTP）100 錠（10 錠×10×1 袋）
140 錠（14 錠×10×1 袋）
420 錠（14 錠×10×3 袋）
モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」：
（PTP）100 錠（10 錠×10×1 袋）

７．容器の材質

PTP 包装

PTP: ポリプロピレン、アルミニウム箔

アルミピロー:アルミニウム箔、ポリエチレン

８．同一成分・同効薬

同一成分薬：シングレア®錠 5mg、10mg、シングレア®OD 錠 10mg、シングレア®チュアブル錠 5mg、シングレア®細粒 4mg、キプレス®錠 5mg、10mg、キプレス®OD 錠 10mg、キプレス®チュアブル錠 5mg、キプレス®細粒 4mg

同　効　薬：ロイコトリエン受容体拮抗薬(プランルカスト水和物)

９．国際誕生年月日

1997 年 7 月 31 日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」：

製造販売承認年月日：2016 年 8 月 15 日

承認番号

モンテルカスト錠 5mg「オーハラ」　：22800AMX00607000

モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」　：22800AMX00608000

モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」：

製造販売承認年月日：2017 年 2 月 15 日

承認番号

モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」：22900AMX00244000

11. 薬価基準収載年月日

モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」　：2016 年 12 月 9 日

モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」：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

モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」：

追加年月日

2016 年 11 月 9 日

追加内容

効能・効果	用法・用量
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。

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

本剤は厚生労働大臣の定める「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

16. 各種コード

	HOT9	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算処理システムコード
モンテルカスト錠 5mg「オーハラ」	125284201	4490026F3160	622528401
モンテルカスト錠 10mg「オーハラ」	125285901	4490026F2180	622528501
モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」	125504101	4490026F1010	622550401

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

ＸＩ．文献

１．引用文献

1) 大原薬品工業株式会社　社内資料：苛酷試験(2016 年)

2) 大原薬品工業株式会社　社内資料：苛酷試験(2017 年)

3) 大原薬品工業株式会社　社内資料：長期保存試験(2021 年)

4) 大原薬品工業株式会社　社内資料：加速試験(2016 年)

5) 大原薬品工業株式会社　社内資料：溶出試験(2016 年)

6) 大原薬品工業株式会社　社内資料：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基づく溶出試験(2016 年)

7) 第十八改正日本薬局方解説書(廣川書店)C-5867(2021)

8) 大原薬品工業株式会社　社内資料：生物学的同等性試験(2015 年)

9) 大原薬品工業株式会社　社内資料：生物学的同等性試験(2016 年)

10) 大原薬品工業株式会社　社内資料：粉砕後の安定性試験(2016 年)

11) 大原薬品工業株式会社　社内資料：粉砕後の安定性試験(2017 年)

12) 大原薬品工業株式会社　社内資料：経管通過性試験(2016 年)

13) 大原薬品工業株式会社　社内資料：経管通過性試験(2017 年)

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

本剤は海外では発売されていない。

尚、モンテルカストナトリウム製剤としては海外で販売されている。

（2024 年 3 月時点）

２．海外における臨床支援情報

該当しない

ⅩⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関する Q&A について(その 3)」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課　事務連絡)

(1) 粉砕[10,11]

粉砕品について、各種条件下で保存し、安定性試験(性状、純度試験、定量)を行った。

1) モンテルカスト錠 5mg、10mg「オーハラ」

試験条件	結果
25℃、60%RH、3 ヵ月(遮光・開放)	類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。
総照射量 30 万 lx・hr(開放)	類縁物質増加(規格外)及び含量低下（規格外）。その他は変化なし。

2) モンテルカストチュアブル錠 5mg「オーハラ」

試験条件	結果
40℃、1 ヵ月(遮光・気密容器)	類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。
25℃、60%RH、3 ヵ月(遮光・開放)	類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。
総照射量 7.5 万 lx・hr(開放)	着色(微黄色→淡黄色)及び類縁物質増加(規格内)。その他は変化なし。

（2）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性[12,13)]

試験方法

〔崩壊懸濁試験〕

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に試料１錠を入れてピストンを戻し、ディスペンサーに約55℃の温湯20mL を吸い取り、筒先の蓋をして5分間自然放置する。5分後にディスペンサーを手で90度15往復横転し、崩壊･懸濁の状態を観察する。5分後に崩壊しない場合、さらに5分間放置後、同様の操作を行う。10分間放置しても崩壊･懸濁しない場合、錠剤をコーティング破壊してから、ディスペンサー内に入れて同様の操作を行い、崩壊･懸濁の状態を観察する。

〔通過性試験〕

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を、ディスペンサーに吸い取り、経管チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平にし、他端(注入端)を30cmの高さにセットし、チューブ(サイズ；8フレンチ)の通過性を観察する。

なお、8フレンチのチューブを通過しない場合は、18フレンチのチューブを用いて同様に通過性を観察する。

試験方法	崩壊懸濁試験	通過性試験	判定
試験結果	5分以内に崩壊・懸濁した。	チューブ(8フレンチ)を通過した。	適1

2.その他の関連資料

特になし

④、③

付表

薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づく承認申請時に添付する資料
別表 1 及び別表 2-(1)医療用医薬品より改変

添付資料の内容		新有効成分含有製剤（先発医薬品）	その他の医薬品（後発医薬品）	剤形追加に係る医薬品（後発医薬品）
イ　起原又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1　起原又は発見の経緯	○	×	○
	2　外国における使用状況	○	×	○
	3　特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ　製造方法並びに規格及び試験方法等に関する資料	1　構造決定及び物理化学的性質等	○	×	×
	2　製造方法	○	△	○
	3　規格及び試験方法	○	○	○
ハ　安定性に関する資料	1　長期保存試験	○	×	△
	2　苛酷試験	○	×	△
	3　加速試験	○	○	○
ニ　薬理作用に関する資料	1　効力を裏付ける試験	○	×	×
	2　副次的薬理・安全性薬理	○	×	×
	3　その他の薬理	△	×	×
ホ　吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1　吸収	○	×	×
	2　分布	○	×	×
	3　代謝	○	×	×
	4　排泄	○	×	×
	5　生物学的同等性	×	○	○
	6　その他の薬物動態	△	×	×
ヘ　急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1　単回投与毒性	○	×	×
	2　反復投与毒性	○	×	×
	3　遺伝毒性	○	×	×
	4　がん原性	△	×	×
	5　生殖発生毒性	○	×	×
	6　局所刺激性	△	×	×
	7　その他の毒性	△	×	×
ト　臨床試験の成績に関する資料	臨床試験成績	○	×	×
チ　法第五十二条第一項に規定する添付文書等記載事項に関する資料	添付文書等記載事項	○	○[1)]	○

○：添付　×：添付不要　△：個々の医薬品により判断される

1)製造方法の変更又は試験方法の変更等、添付文書の記載に変更を生じない内容に関する申請に限り、原則として、チの資料の添付は要しない。

平成 26 年 11 月 25 日以後、承認申請時に適用される。