

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「KO」
モンテルカスト錠 10mg「KO」

MONTELUKAST TAB. 5mg「KO」
MONTELUKAST TAB. 10mg「KO」

| | | | |
|---------------------------|---|------------|------------|
| 剤形 | 淡橙色のフィルムコーティング錠 | | |
| 製剤の規制区分 | 該当しない | | |
| 規格・含量 | 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) 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) | | |
| 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 | | 5mg | 10mg |
| | 製造販売承認年月日 | 2016年8月15日 | 2016年8月15日 |
| | 薬価基準収載年月日 | 2016年12月9日 | 2016年12月9日 |
| 発売年月日 | 2016年12月9日 | 2016年12月9日 | 2016年12月9日 |
| 開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名 | 製造販売元：寿製薬株式会社 | | |
| 医薬品情報担当者の連絡先 | | | |
| 問い合わせ窓口 | 寿製薬株式会社 くすり相談窓口 フリーコール：0120-996-156 FAX：0268-82-2215 受付時間：9時～12時、13時～17時 (土、日、祝日、その他当社休業日を除く) ホームページ URL： http://www.kotobuki-pharm.co.jp/ | | |

本IFは2019年4月改訂（第3版）の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、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性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品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年が経過した現在、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月に日病薬医薬品情報委員会において新たなIF記載要領が策定された。

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式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に審査・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、医薬品の適性使用のための情報、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、添付文書で赤字・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

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、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

| | |
|-------------------|---|
| 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 | |
| (1) 和名 | 2 |
| (2) 洋名 | 2 |
| (3) 名称の由来 | 2 |
| 2. 一般名 | |
| (1) 和名 (命名法) | 2 |
| (2) 洋名 (命名法) | 2 |
| (3) ステム | 2 |
| 3. 構造式又は示性式 | 2 |
| 4. 分子式及び分子量 | 2 |
| 5. 化学名 (命名法) | 2 |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号 | 2 |
| 7. CAS 登録番号 | 2 |

III. 有効成分に関する項目

| | |
|----------------------|---|
| 1. 物理化学的性質 | |
| (1) 外観・性状 | 3 |
| (2) 溶解性 | 3 |
| (3) 吸湿性 | 3 |
| (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点 | 3 |
| (5) 酸塩基解離定数 | 3 |
| (6) 分配係数 | 3 |
| (7) その他の主な示性値 | 3 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性 | 3 |
| 3. 有効成分の確認試験法 | 3 |
| 4. 有効成分の定量法 | 3 |

IV. 製剤に関する項目

| | |
|-----------------------------------|---|
| 1. 剤形 | |
| (1) 剤形の区別、外観及び性状 | 4 |
| (2) 製剤の物性 | 4 |
| (3) 識別コード | 4 |
| (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等 | 4 |
| 2. 製剤の組成 | |
| (1) 有効成分（活性成分）の含量 | 4 |
| (2) 添加物 | 4 |
| (3) その他 | 4 |
| 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 | 5 |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性 | 5 |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性 | 5 |
| 6. 他剤との配合変化（物理化学的变化） | 5 |
| 7. 溶出性 | 5 |
| 8. 生物学的試験法 | 5 |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法 | 5 |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法 | 5 |
| 11. 力価 | 5 |
| 12. 混入する可能性のある爽雑物 | 5 |
| 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 | 5 |
| 14. その他 | 5 |

V. 治療に関する項目

| | |
|---|---|
| 1. 効能又は効果 | 6 |
| 2. 用法及び容量 | 6 |
| 3. 臨床成績 | |
| (1) 臨床データパッケージ | 6 |
| (2) 臨床効果 | 6 |
| (3) 臨床薬理試験 | 6 |
| (4) 探索的試験 | 6 |
| (5) 検証的試験 | |
| 1) 無作為化並行用量反応試験 | 6 |
| 2) 比較試験 | 6 |
| 3) 安全性試験 | 6 |
| 4) 患者・病態別試験 | 6 |
| (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） | 6 |
| 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 | 6 |

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 | 7 |
| 2. 薬理作用 | |
| (1) 作用部位・作用機序 | 7 |
| (2) 薬効を裏付ける試験成績 | 7 |
| (3) 作用発現時間・持続時間 | 7 |

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 | 8 |
| (2) 最高血中濃度到達時間 | 8 |
| (3) 臨床試験で確認された血中濃度 | 8 |
| (4) 中毒域 | 9 |
| (5) 食事・併用薬の影響 | 9 |
| (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 | 9 |
| 2. 薬物速度論的パラメータ | |
| (1) 解析方法 | 9 |
| (2) 吸収速度定数 | 9 |
| (3) バイオアベイラビリティ | 9 |
| (4) 消失速度定数 | 9 |
| (5) クリアランス | 9 |
| (6) 分布容積 | 9 |
| (7) 血漿蛋白結合率 | 9 |
| 3. 吸収 | 9 |
| 4. 分布 | |
| (1) 血液－脳関門通過性 | 9 |
| (2) 血液－胎盤関門通過性 | 9 |
| (3) 乳汁への移行性 | 9 |
| (4) 髄液への移行性 | 9 |
| (5) その他の組織への移行性 | 9 |
| 5. 代謝 | |
| (1) 代謝部位及び代謝経路 | 9 |
| (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種 | 9 |
| (3) 初回通過効果の有無及びその割合 | 9 |
| (4) 代謝物の活性の有無及び比率 | 10 |
| (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ | 10 |
| 6. 排泄 | |
| (1) 排泄部位及び経路 | 10 |
| (2) 排泄率 | 10 |

| | |
|-------------------------|----|
| (3) 排泄速度 | 10 |
| 7. トランスポーターに関する情報 | 10 |
| 8. 透析等による除去率 | 10 |

V I I I . 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 | 11 |
| 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） | 11 |
| 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 | 11 |
| 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 | 11 |
| 5. 慎重投与内容とその理由 | 11 |
| 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 | 11 |
| 7. 相互作用 | |
| (1) 併用禁忌とその理由 | 12 |
| (2) 併用注意とその理由 | 12 |
| 8. 副作用 | |
| (1) 副作用の概要 | 12 |
| (2) 重大な副作用と初期症状 | 12 |
| (3) その他の副作用 | 12 |
| (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧 | 13 |
| (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 | 13 |
| (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法 | 13 |
| 9. 高齢者への投与 | 13 |
| 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 | 13 |
| 11. 小児等への投与 | 13 |
| 12. 臨床検査結果に及ぼす影響 | 13 |
| 13. 過量投与 | 13 |
| 14. 適用上の注意 | 14 |
| 15. その他の注意 | 14 |
| 16. その他 | 14 |

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 | 15 |
| (2) 副次的薬理試験 | 15 |
| (3) 安定性薬理試験 | 15 |
| (4) その他の薬理試験 | 15 |
| 2. 毒性試験 | |
| (1) 単回投与毒性試験 | 15 |
| (2) 反復投与毒性試験 | 15 |

| | |
|--------------|----|
| (3) 生殖発生毒性試験 | 15 |
| (4) その他の特殊毒性 | 15 |

X. 管理的事項に関する項目

| | |
|-------------------------------------|----|
| 1. 規制区分 | 16 |
| 2. 有効期間又は使用期限 | 16 |
| 3. 貯法・保存条件 | 16 |
| 4. 薬剤取扱い上の注意点 | |
| (1) 薬局での取り扱いについて | 16 |
| (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等） | 16 |
| (3) 調剤時の留意点について | 16 |
| 5. 承認条件等 | 16 |
| 6. 包装 | 16 |
| 7. 容器の材質 | 16 |
| 8. 同一成分・同効薬 | 16 |
| 9. 国際誕生年月日 | 16 |
| 10. 製造販売承認年月日及び承認番号 | 16 |
| 11. 薬価基準収載年月日 | 17 |
| 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 | 17 |
| 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 | 17 |
| 14. 再審査期間 | 17 |
| 15. 投与期間制限医薬品に関する情報 | 17 |
| 16. 各種コード | 17 |
| 17. 保険給付上の注意 | 17 |

X I. 文献

| | |
|-------------|----|
| 1. 引用文献 | 18 |
| 2. その他の参考文献 | 18 |

X I I. 参考資料

| | |
|-----------------|----|
| 1. 主な外国での発売状況 | 19 |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 19 |

X I I I. 備考

| | |
|----------|----|
| その他の関連資料 | 20 |
|----------|----|

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

モンテルカスト錠 5mg「KO」及びモンテルカスト錠 10mg「KO」は、2016年8月15日に寿製薬株式会社で製造販売承認を取得し、2016年12月9日に薬価基準収載された製品である。

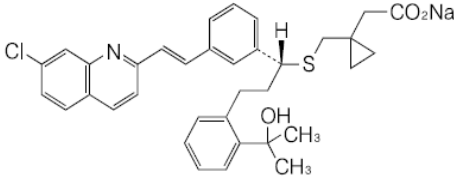
なお、本剤は、後発医薬品として、寿製薬と他の1社の合計2社で共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 5mg 製剤及び 10mg 製剤の 2 規格を揃えた。

(2) モンテルカスト錠 5mg「KO」及びモンテルカスト錠 10mg「KO」は、ロイコトリエン受容体拮抗剤・アレルギー性鼻炎治療剤である。

I I. 名称に関する項目

| | |
|-------------------|---|
| 1. 販売名 | |
| (1) 和名 | モンテルカスト錠 5mg 「KO」 モンテルカスト錠 10mg 「KO」 |
| (2) 洋名 | MONTELUKAST TAB. 5mg 「KO」 MONTELUKAST TAB. 10mg 「KO」 |
| (3) 名称の由来 | 通知「平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号」に基づき命名した。 |
| 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 | ロイコトリエン拮抗薬：-lukast |
| 3. 構造式又は示性式 |  |
| 4. 分子式及び分子量 | 分子式：C ₃₅ H ₃₅ ClNNaO ₃ S 分子量：608.17 |
| 5. 化学名 (命名法) | Monosodium(1-(((1 <i>R</i>)-1-{3-[(1 <i>E</i>)-2-(7-chloroquinolin-2-yl)ethenyl]phenyl}-3-[2-(1-hydroxy-1-methylethyl)phenyl]propyl)sulfanyl)methyl)cyclopropyl)acetate |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号 | 該当しない |
| 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。 |
| (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 | 融点：約 115℃ (熱分解) |
| (5) 酸塩基解離定数 | pKa=6.5±0.8 |
| (6) 分配係数 | log KD=2.3±0.2 (1-オクタノール/リン酸緩衝液 (pH7)) |
| (7) その他の主な示性値 | 光によって黄色に変化する。 結晶多形が認められる。 |
| 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 | (1) 赤外吸収スペクトル 本品につき、赤外吸収スペクトル測定法のペースト法により試験を行い、本品のスペクトルと本品標準品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。ただし、流動パラフィン由来のピークは除く。 (2) 塩色反応 本品につき、日局一般試験法、炎色反応試験 (1) を行うとき、黄色を呈する。 |
| 4. 有効成分の定量法 | 液体クロマトグラフィーによる。 |

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

5mg :

| 色・剤形 | 淡橙色のフィルムコーティング錠 | | |
|------|---|---|---|
| 外形 | 表面 | 裏面 | 側面 |
| |  |  |  |
| 大きさ | 直径 (mm) | 厚さ (mm) | 重量 (mg) |
| | 6.6 | 3.1 | 103.15 |

10mg :

| 色・剤形 | 淡橙色のフィルムコーティング錠 | | |
|------|---|---|---|
| 外形 | 表面 | 裏面 | 側面 |
| |  |  |  |
| 大きさ | 直径 (mm) | 厚さ (mm) | 重量 (mg) |
| | 8.1 | 4.1 | 205 |

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

5mg : KO39
10mg : KO40

(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

5mg : 1錠中 日局 モンテルカステナトリウム5.2mg
(モンテルカステとして5mg)
10mg : 1錠中 日局 モンテルカステナトリウム10.4mg
(モンテルカステとして10mg)

(2) 添加物

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

(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 ⁴⁾ | 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「KO」及びモンテルカスト錠10mg「KO」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。 |
| 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 ²⁾ | モンテルカスト錠5mg「KO」及びモンテルカスト錠10mg「KO」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。 |
| 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による。 |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法 | 液体クロマトグラフィーによる。 |
| 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・外觀が特殊な容器に関する情報 | 該当しない |
| 14. その他 | 特になし |

V. 治療に関する項目

| | |
|---|--|
| 1. 効能又は効果 | 気管支喘息、アレルギー性鼻炎 |
| 2. 用法及び用量 | <p><気管支喘息> 通常、成人にはモンテルカストとして10mgを1日1回就寝前に経口投与する。</p> <p><アレルギー性鼻炎> 通常、成人にはモンテルカストとして5~10mgを1日1回就寝前に経口投与する。</p> |
| 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 | 該当資料なし |

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、ザフィルルカスト) |
| 2. 薬理作用 ³⁾ | |
| (1) 作用部位・作用機序 | 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 I I . 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法
 (1) 治療上有効な血中濃度
 (2) 最高血中濃度到達時間
 (3) 臨床試験で確認された血中濃度¹⁾

該当資料なし

投与後約 1.5 時間

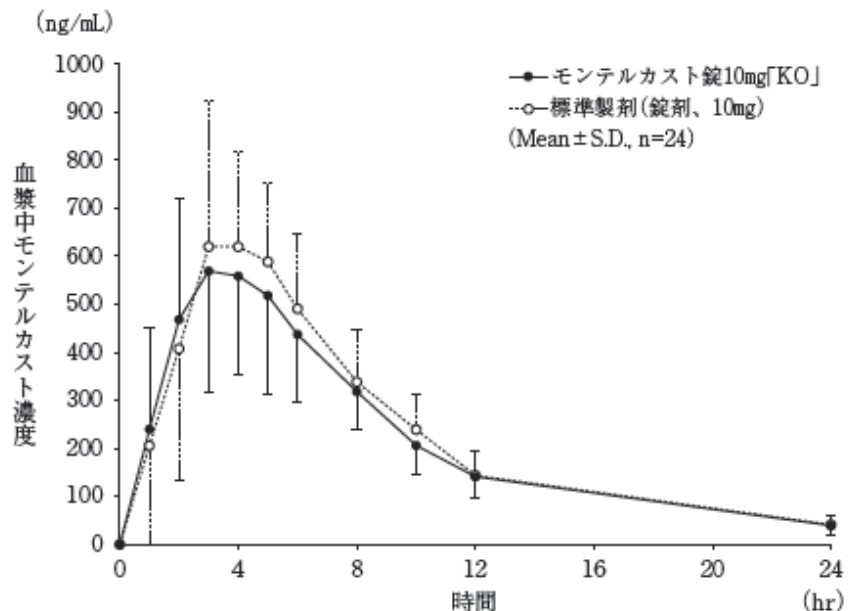
<生物学的同等性試験>

モンテルカスト錠10mg「KO」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、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）～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。

また、モンテルカスト錠5mg「KO」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「KO」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。

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|----------------------|-------------------------------------|-------------------|--------------|--------------------------|
| | AUC _{0→24hr} (ng・hr/mL) | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | T _{1/2} (hr) |
| モンテルカスト錠 10mg「KO」 | 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 |

(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。

| | |
|--------------------------------------|---|
| (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 | 該当資料なし |
| (4) 消失速度定数 | 該当資料なし |
| (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 | 〔「V I I I . 安全性（使用上の注意等）に関する項目 1 0 . 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照〕 |
| (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 |

V I I I . 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 | <ol style="list-style-type: none"> 1. モンテルカストフィルムコーティング錠はモンテルカストチュアブル錠と生物学的に同等ではないため、モンテルカストフィルムコーティング錠5mgとモンテルカストチュアブル錠5mgをそれぞれ相互に代用しないこと。 2. 気管支喘息及びアレルギー性鼻炎を合併し本剤を気管支喘息の治療のために用いる成人患者には、モンテルカストとして10mgを1日1回就寝前に経口投与すること。 |
| 5. 慎重投与内容とその理由 | 該当しない |
| 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 | <ol style="list-style-type: none"> (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。 |

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

| 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

(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。

| | 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 |

| | | | | | | | |
|-------------------------------------|--|--|------|------|--------------|-----|--|
| | <table border="1"> <tr> <td></td> <td>頻度不明</td> </tr> <tr> <td>筋骨格系</td> <td>筋痙攣を含む筋痛、関節痛</td> </tr> <tr> <td>その他</td> <td>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</td> </tr> </table> | | 頻度不明 | 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 |
| | 頻度不明 | | | | | | |
| 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 | | | | | | |
| 9. 高齢者への投与 | 該当資料なし | | | | | | |
| 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 | <p>(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。海外の市販後において、妊娠中に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。〕</p> <p>(2) 授乳中の婦人に投与する場合は慎重に投与すること。 〔動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。〕</p> | | | | | | |
| 11. 小児等への投与 | <p><気管支喘息></p> <p>1) 6歳以上の小児に対しては、モンテルカストチュアブル錠5mgを1日1回就寝前に投与すること。</p> <p>2) 1歳以上6歳未満の小児に対しては、モンテルカスト細粒4mgを1日1回就寝前に投与すること。</p> <p>3) 1歳未満の乳児、新生児、低出生体重児に対するモンテルカスト製剤の安全性は確立していない。〔国内でのモンテルカスト製剤の使用経験がない。〕</p> <p><アレルギー性鼻炎></p> <p>小児等に対するモンテルカスト製剤の安全性は確立していない。〔国内でのモンテルカスト製剤の使用経験がない。〕</p> | | | | | | |
| 12. 臨床検査結果に及ぼす影響 | 該当しない | | | | | | |
| 13. 過量投与 | 該当資料なし | | | | | | |

| | |
|------------|--|
| 14. 適用上の注意 | <p>(1) 薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。（PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。）</p> <p>(2) 食事の有無にかかわらず投与できる。</p> |
| 15. その他の注意 | <p>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。</p> <p>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。</p> |
| 16. その他 | 該当しない |

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」の項参照〕 |
| (2) 副次的薬理試験 | 該当資料なし |
| (3) 安定性薬理試験 | 該当資料なし |
| (4) その他の薬理試験 | 該当資料なし |
| 2. 毒性 | |
| (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 | 3年（外箱に表示の使用期限内に使用すること。） |
| 3. 貯法・保存条件 | 遮光、室温保存（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）薬局での取り扱いについて | 該当資料なし |
| （2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等） | 〔「V I I I. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14. 適用上の注意」の項参照〕 |
| （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 | 5mg : (PTP) 100錠 (10錠×10) 10mg : (PTP) 100錠 (10錠×10) |
| 7. 容器の材質 | [PTP包装] PTP包装：ポリプロピレン／アルミニウム箔 内 装：アルミニウム 外 箱：紙 |
| 8. 同一成分・同効薬 | 同一成分薬：キプレス錠5mg、キプレス錠10mg（杏林製薬） シングレア錠5mg、シングレア錠10mg（MSD） 同効薬：ロイコトリエン受容体拮抗薬（ブランルカスト水和物、ザフィルルカスト） |
| 9. 国際誕生年月日 | 1997年7月31日（メキシコ） |
| 10. 製造販売承認年月日及び承認番号 | 5mg : 製造販売承認年月日：2016年8月15日 製造販売承認番号：22800AMX00635000 10mg : 製造販売承認年月日：2016年8月15日 製造販売承認番号：22800AMX00636000 |

| | |
|--------------------------------------|--|
| 1 1. 薬価基準収載年月日 | 5mg : 2016年12月9日 10mg : 2016年12月9日 |
| 1 2. 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 | 5mg・10mg : 2016年11月9日 効能又は効果、用法及び用量 : 気管支喘息の場合を追加 |
| 1 3. 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 |
| 1 4. 再審査期間 | 該当しない |
| 1 5. 投与期間制限医薬品に関する情報 | 本剤は厚生労働省告示第97号（平成20年3月19日付け）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。 |
| 1 6. 各種コード | 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード 5mg : 4490026F3110 10mg : 4490026F2130 |
| 1 7. 保険給付上の注意 | 本剤は、保険診療上の後発品である。 |

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 寿製薬株式会社社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 寿製薬株式会社社内資料：溶出試験
- 3) 第十七改正日本薬局方解説書. 東京：廣川書店；2016. C-5593-5603.
- 4) 寿製薬株式会社社内資料：安定性試験

2. その他の参考文献

なし

X I I . 参考資料

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

X I I I . 備考

その他の関連資料

なし

製造販売元  寿製薬株式会社