

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

<p>ロイコトリエン受容体拮抗薬 ◎気管支喘息・アレルギー性鼻炎治療薬◎</p> <p>日本薬局方 モンテルカストナトリウム錠</p> <p>モンテルカスト錠 5mg「日医工」 モンテルカスト錠 10mg「日医工」 Montelukast</p>	<p>ロイコトリエン受容体拮抗薬 ◎気管支喘息治療薬◎</p> <p>日本薬局方 モンテルカストナトリウムチュアブル錠</p> <p>モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」 Montelukast Chewable</p> <p>日本薬局方 モンテルカストナトリウム顆粒</p> <p>モンテルカスト細粒 4mg「日医工」 Montelukast</p>
-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

剤形	錠 5mg 錠 10mg チュアブル錠 細粒	: フィルムコーティング錠 : フィルムコーティング錠 : 素錠 : 細粒剤	
製剤の規制区分	なし		
規格・含量	1錠又は0.5g中以下の量モンテルカストナトリウムを含有 錠 5mg : 5.2mg (モンテルカストとして5mg) 錠 10mg : 10.4mg (モンテルカストとして10mg) チュアブル錠 : 5.2mg (モンテルカストとして5mg) 細粒 : 4.16mg (モンテルカストとして4mg)		
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	錠 5mg/錠 10mg	チュアブル錠/細粒	
	承認年月日	2016年 8月 15日	2017年 2月 15日
	薬価基準収載	2016年 12月 9日	2017年 6月 16日
発売年月日	2016年 12月 9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：日医工株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>		

本IFは2019年4月改訂（錠 5mg/錠 10mg/細粒：第3版，チュアブル錠：第2版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ  
<http://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

## 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ホームページ（<http://www.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

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	1	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	18
1. 開発の経緯 .....	1	1. 薬理学的に関連のある化合物又は化合物群	18
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1	2. 薬理作用 .....	18
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	2	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	19
1. 販売名 .....	2	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	19
2. 一般名 .....	2	2. 薬物速度論的パラメータ .....	23
3. 構造式又は示性式 .....	2	3. 吸収 .....	24
4. 分子式及び分子量 .....	2	4. 分布 .....	24
5. 化学名（命名法） .....	2	5. 代謝 .....	24
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 .....	2	6. 排泄 .....	24
7. CAS 登録番号 .....	2	7. トランスポーターに関する情報 .....	24
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	3	8. 透析等による除去率 .....	24
1. 物理化学的性質 .....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	25
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	3	1. 警告内容とその理由 .....	25
3. 有効成分の確認試験法 .....	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） ..	25
4. 有効成分の定量法 .....	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	25
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	4	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	25
1. 剤形 .....	4	5. 慎重投与内容とその理由 .....	25
2. 製剤の組成 .....	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	25
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 .....	5	7. 相互作用 .....	26
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	5	8. 副作用 .....	26
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	7	9. 高齢者への投与 .....	27
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	7	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 .....	28
7. 溶出性 .....	7	11. 小児等への投与 .....	28
8. 生物学的試験法 .....	15	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	29
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	15	13. 過量投与 .....	29
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	15	14. 適用上の注意 .....	29
11. 力価 .....	15	15. その他の注意 .....	29
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	15	16. その他 .....	29
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....	15	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	30
14. その他 .....	15	1. 薬理試験 .....	30
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	16	2. 毒性試験 .....	30
1. 効能又は効果 .....	16	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	31
2. 用法及び用量 .....	16	1. 規制区分 .....	31
3. 臨床成績 .....	17		

2. 有効期間又は使用期限	31
3. 貯法・保存条件	31
4. 薬剤取扱い上の注意点	31
5. 承認条件等	31
6. 包装	31
7. 容器の材質	31
8. 同一成分・同効薬	31
9. 国際誕生年月日	31
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	32
11. 薬価基準収載年月日	32
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	32
13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	32
14. 再審査期間	32
15. 投与期間制限医薬品に関する情報	32
16. 各種コード	32
17. 保険給付上の注意	32
<b>X I. 文献</b>	<b>33</b>
1. 引用文献	33
2. その他の参考文献	33
<b>X II. 参考資料</b>	<b>33</b>
1. 主な外国での発売状況	33
2. 海外における臨床支援情報	33
<b>X III. 備考</b>	<b>33</b>
付表 1—1	34
付表 1—2	35
付表 1—3	36
付表 1—4	37

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤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「日医工」」及び「モンテルカスト錠 10mg「日医工」」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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15日に承認を取得、2016年12月9日に販売を開始した。

(薬食発 1121 第 2 号 (平成 26 年 11 月 21 日) に基づき承認申請)

2016年11月9日、「モンテルカスト錠 5mg「日医工」」及び「モンテルカスト錠 10mg「日医工」」は、「気管支喘息」の効能・効果及び用法・用量が承認された。

「モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」」及び「モンテルカスト細粒 4mg「日医工」」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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15日に承認を取得、2017年6月16日に販売を開始した。(薬食発 1121 第 2 号 (平成 26 年 11 月 21 日) に基づき承認申請)

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤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。
- (2) 錠 5mg 及び錠 10mg は、錠剤の両面に成分名、含量、社名をレーザー印字した。
- (3) 錠 5mg は楕円形、錠 10mg は円形のフィルムコーティング錠である。
- (4) 錠 5mg、錠 10mg 及びチュアブル錠の PTP シートはピッチコントロールを行い、1 錠ごとに成分名、含量を表示した。
- (5) 錠 5mg、錠 10mg 及びチュアブル錠は、開封せずにそのまま調剤できるパッケージ調剤「日医工」がある。
- (6) チュアブル錠は、香料としてストロベリーフレーバーを使用している。
- (7) チュアブル錠は、錠剤に成分名・含量・剤形・社名をインクジェット印字した。
- (8) 細粒は、甘味剤、香料を含まない白色細粒である。
- (9) 細粒の包装は、帯電しにくい素材のスティック包装である。
- (10) 細粒の包装は、開封しやすいよう、切り口にレーザー加工を施したスティック包装である。
- (11) 重大な副作用 (頻度不明) 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、血小板減少が報告されている。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

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

#### (2) 洋名

Montelukast / Montelukast Chewable

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

モンテルカストナトリウム (JAN)

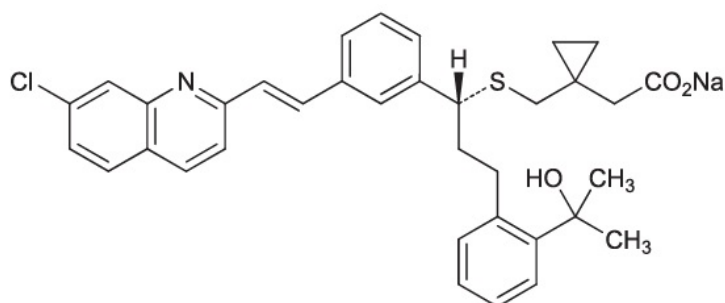
#### (2) 洋名 (命名法)

Montelukast Sodium (JAN)

#### (3) ステム

ロイコトリエン受容体拮抗薬：-lukast

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>35</sub>H<sub>35</sub>ClNaO<sub>3</sub>S

分子量：608.17

### 5. 化学名 (命名法)

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

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

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

##### (1) 沈殿反応

本品を加熱し，水を加えろ過する。ろ液に炭酸カリウム溶液を加え，加熱する。この液にヘキサヒドロキノアンチモン（V）酸カリウム試液を加え，沸騰するまで加熱し，直ちに冷却するとき，白色の沈殿を生じる。

##### (2) 紫外可視吸光度測定法

メタノール，水混液溶液につき吸収スペクトルを測定し，本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又はモンテルカストナトリウム標準品のスペクトルを比較するとき，両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

##### (3) 赤外吸収スペクトル測定法

ペースト法により試験を行い，本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又はモンテルカストナトリウム標準品の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。

#### 4. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相 A：水，トリフルオロ酢酸混液










移動相 B：アセトニトリル，トリフルオロ酢酸混液



## 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	色調 剤形	形 状			本体表示 包装コード
		質量(mg)	直径(mm)	厚さ(mm)	
モンテルカスト錠 5mg「日医工」	明るい灰黄色 楕円形のフィルム コーティング錠	 102.8	 7.6×5.6	 2.8	本体：モンテルカスト 5 日医工 包装：㊄ 086
モンテルカスト錠 10mg「日医工」	明るい灰黄色 円形のフィルム コーティング錠	 203.5	 8.0	 4.1	本体：モンテルカスト 10 日医工 包装：㊄ 087
モンテルカスト チュアブル錠 5mg「日医工」	うすい赤色 円形の素錠	 300	 9.5	 4.7	本体：モンテルカスト 5 チュアブル 日医工 包装：㊄ 085
モンテルカスト 細粒 4mg 「日医工」	白色 細粒剤	—			—

#### (2) 製剤の物性

(「IV - 4.製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

#### (3) 識別コード

(「IV - 1.(1)剤形の区別, 外観及び性状」の項参照)

#### (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

1 錠又は 0.5g 中以下の量モンテルカストナトリウムを含有

錠 5mg : 5.2mg (モンテルカストとして 5mg)

錠 10mg : 10.4mg (モンテルカストとして 10mg)

チュアブル錠 : 5.2mg (モンテルカストとして 5mg)

細粒 : 4.16mg (モンテルカストとして 4mg)

#### (2) 添加物

錠 5mg/錠 10mg : 乳糖水和物, 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, ヒプロメロース, 酸化チタン, 三二酸化鉄, 黄色三二酸化鉄, カルナウバロウ

チュアブル錠 : 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, 三二酸化鉄, 黄色三二酸化鉄, 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), 香料

細粒 : D-マンニトール, ヒドロキシプロピルセルロース, ステアリン酸カルシウム

#### (3) その他

該当記載事項なし

### 3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

### 4. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

本品につき加速試験 (40°C, 75%RH, 6 ヶ月) を行った結果, モンテルカスト錠 5mg 「日医工」, モンテルカスト錠 10mg 「日医工」, モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」及びモンテルカスト細粒 4mg 「日医工」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。

#### ◇モンテルカスト錠 5mg 「日医工」加速試験 [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <明るい灰黄色の楕円形の フィルムコーティング錠>	MON5T-1 MON5T-2 MON5T-3	適合	同左	同左	同左
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	MON5T-1 MON5T-2 MON5T-3	適合	同左	同左	同左
純度試験 (HPLC) <※1>	MON5T-1 MON5T-2 MON5T-3	適合	同左	同左	同左
製剤均一性 (含量均一性試験) (%) <15.0%以下>	MON5T-1 MON5T-2 MON5T-3	1.4~2.2 1.2~2.4 1.7~4.1	—	—	1.2~2.9 2.9~4.3 2.9~3.8
溶出性 (%) <20 分, 85%以上>	MON5T-1 MON5T-2 MON5T-3	100.2~103.0 97.0~101.4 99.6~103.0	—	—	99.3~101.8 96.3~100.9 98.2~101.9
含量 (%) ※2 <95.0~105.0%>	MON5T-1 MON5T-2 MON5T-3	99.5~99.7 98.1~98.5 98.7~99.5	—	—	99.8~99.9 97.8~98.0 98.3~99.3

※1: RRT 約 0.45 の二つのピーク合計面積; 1.0%以下, RRT 約 0.92 のピーク面積; 0.15%以下, モンテルカスト及び上記以外のピーク面積; 0.1%以下, モンテルカスト以外のピーク合計面積; 1.2%以下 ※2: 表示量に対する含有率 (%)

#### ◇モンテルカスト錠 10mg 「日医工」加速試験 [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <明るい灰黄色の円形の フィルムコーティング錠>	MON10T-1 MON10T-2 MON10T-3	適合	同左	同左	同左
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	MON10T-1 MON10T-2 MON10T-3	適合	同左	同左	同左
純度試験 (HPLC) <※1>	MON10T-1 MON10T-2 MON10T-3	適合	同左	同左	同左
製剤均一性 (含量均一性試験) (%) <15.0%以下>	MON10T-1 MON10T-2 MON10T-3	1.0~1.2 1.2~1.4 1.7~2.4	—	—	1.0~2.2 1.2~1.4 1.4~1.7
溶出性 (%) <20 分, 85%以上>	MON10T-1 MON10T-2 MON10T-3	98.0~101.1 98.7~102.0 99.0~102.1	—	—	97.5~103.4 97.7~101.4 99.2~102.3
含量 (%) ※2 <95.0~105.0%>	MON10T-1 MON10T-2 MON10T-3	99.7~101.1 100.1~101.3 100.5~101.7	—	—	100.1~101.3 101.0~101.8 101.1~101.4

※1: RRT 約 0.45 の二つのピーク合計面積; 1.0%以下, RRT 約 0.92 のピーク面積; 0.15%以下, モンテルカスト及び上記以外のピーク面積; 0.1%以下, モンテルカスト以外のピーク合計面積; 1.2%以下 ※2: 表示量に対する含有率 (%)

◇モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (PTP 包装) ]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <うすい赤色の素錠>	MON5CT-1 MON5CT-2 MON5CT-3	適合	同左	同左	同左
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	MON5CT-1 MON5CT-2 MON5CT-3	適合	同左	同左	同左
純度試験 (HPLC) <※1>	MON5CT-1 MON5CT-2 MON5CT-3	適合	同左	同左	同左
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) <15.0%以下>	MON5CT-1 MON5CT-2 MON5CT-3	1.4~3.1 2.2~2.7 1.9~3.2	—	—	1.4~2.7 1.2~3.1 1.2~2.2
溶出性 (%) <20 分, 85%以上>	MON5CT-1 MON5CT-2 MON5CT-3	95.8~100.3 96.4~100.0 97.2~100.4	—	—	92.7~99.3 94.4~99.6 96.0~98.0
含量 (%) ※2 <95.0~105.0%>	MON5CT-1 MON5CT-2 MON5CT-3	99.1 99.8 99.7	—	—	98.7 99.1 98.8

※1 : RRT 約 0.45 の二つのピーク合計面積 ; 1.5%以下, RRT 約 0.92 のピーク面積 ; 0.15%以下, モンテルカスト及び上記以外のピーク面積 ; 0.1%以下, モンテルカスト以外のピーク合計面積 ; 1.8%以下, ※2 : 表示量に対する含有率 (%)

◇モンテルカスト細粒 4mg 「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (分包包装) ]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <白色の細粒剤>	MON4F-9 MON4F-10 MON4F-11	適合	同左	同左	同左
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	MON4F-9 MON4F-10 MON4F-11	適合	同左	同左	同左
純度試験 (HPLC) <※1>	MON4F-9 MON4F-10 MON4F-11	適合	同左	同左	同左
製剤均一性 (%) (含量均一性試験) <15.0%以下>	MON4F-9 MON4F-10 MON4F-11	0.7~2.9 1.6~2.6 1.0~1.4	—	—	2.4~4.1 1.6~2.8 1.7~3.6
溶出性 (%) <15 分, 85%以上>	MON4F-9 MON4F-10 MON4F-11	98.0~99.4 96.8~98.5 97.2~99.7	97.9~100.0 98.2~100.8 98.5~100.3	99.1~101.7 98.5~101.2 99.4~102.6	98.1~100.6 98.4~100.5 98.9~100.3
含量 (%) ※2 <95.0~105.0%>	MON4F-9 MON4F-10 MON4F-11	100.0 99.6 99.4	100.1 100.2 100.0	100.0 100.2 100.6	100.1 99.8 99.8

※1 : RRT 約 0.45 の二つのピーク合計面積 ; 1.0%以下, モンテルカスト及び上記以外のピーク面積 ; 0.1%以下  
モンテルカスト以外のピーク合計面積 ; 1.2%以下 ※2 : 表示量に対する含有率 (%)

## 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）

食品との配合変化試験<sup>2)</sup>

### ①試験製剤及び配合食品

[試験製剤] : モンテルカスト細粒 4mg 「日医工」 (Lot : MON4F-9)

[配合食品] :

調製ミルク	明治ステップ らくらくキューブ (株式会社 明治) (キューブ 1 個を熱湯 40mL に溶解し、室温まで冷却して用いた。)
米がゆ	手作り応援 コシヒカリの米がゆ (和光堂株式会社) (1 包を熱湯 60mL に溶解し、室温まで冷却して用いた。)
にんじんとポテト	にんじんとポテト (うらごし) (キューピー株式会社)

### ②試験方法

試験製剤 1 包 (0.5g) と、配合食品 5mL を乳鉢で混合し、室温・室内散光下 (500~600Lx) で 15 分放置した後、性状、純度及び含量を評価した。

### ◇モンテルカスト細粒 4mg 「日医工」 食品との配合

室温 [室内散光下 (500~600Lx) , 開放]

測定項目 <規格>	配合直前	15 分放置後		
		調製ミルク	米がゆ	にんじんとポテト
性状	—	食品の色調, においに 変化を認めなかった	食品の色調, においに 変化を認めなかった	食品の色調, においに 変化を認めなかった
純度試験 (HPLC) <※1>	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ※2 <95.0~105.0%>	98.7	98.0	97.5	98.9

※1 : RRT 約 0.45 の二つのピーク合計面積 : 1.0%以下, モンテルカスト及び左記以外のピーク面積 : 0.1%以下,  
モンテルカスト以外のピーク合計面積 : 1.2%以下 ※2 : 表示量に対する含有率 (%)

## 7. 溶出性

### (1) 溶出規格

モンテルカスト錠 5mg 「日医工」, モンテルカスト錠 10mg 「日医工」, モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」及びモンテルカスト細粒 4mg 「日医工」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, モンテルカストチュアブル錠及びモンテルカスト顆粒の溶出規格に適合していることが確認されている。(試験液にラウリル硫酸ナトリウム溶液 900mL を用い、パドル法により、50rpm で試験を行う)

#### 溶出規格

日本薬局方収載名	規定時間	溶出率
モンテルカストナトリウム錠	20 分	85%以上
モンテルカストナトリウムチュアブル錠	20 分	85%以上
モンテルカストナトリウム顆粒	15 分	85%以上

## (2) 溶出試験<sup>3)</sup>

<モンテルカスト錠 10mg 「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 24 年 2 月 29 日  
薬食審査発 0229 第 10 号）

試験条件

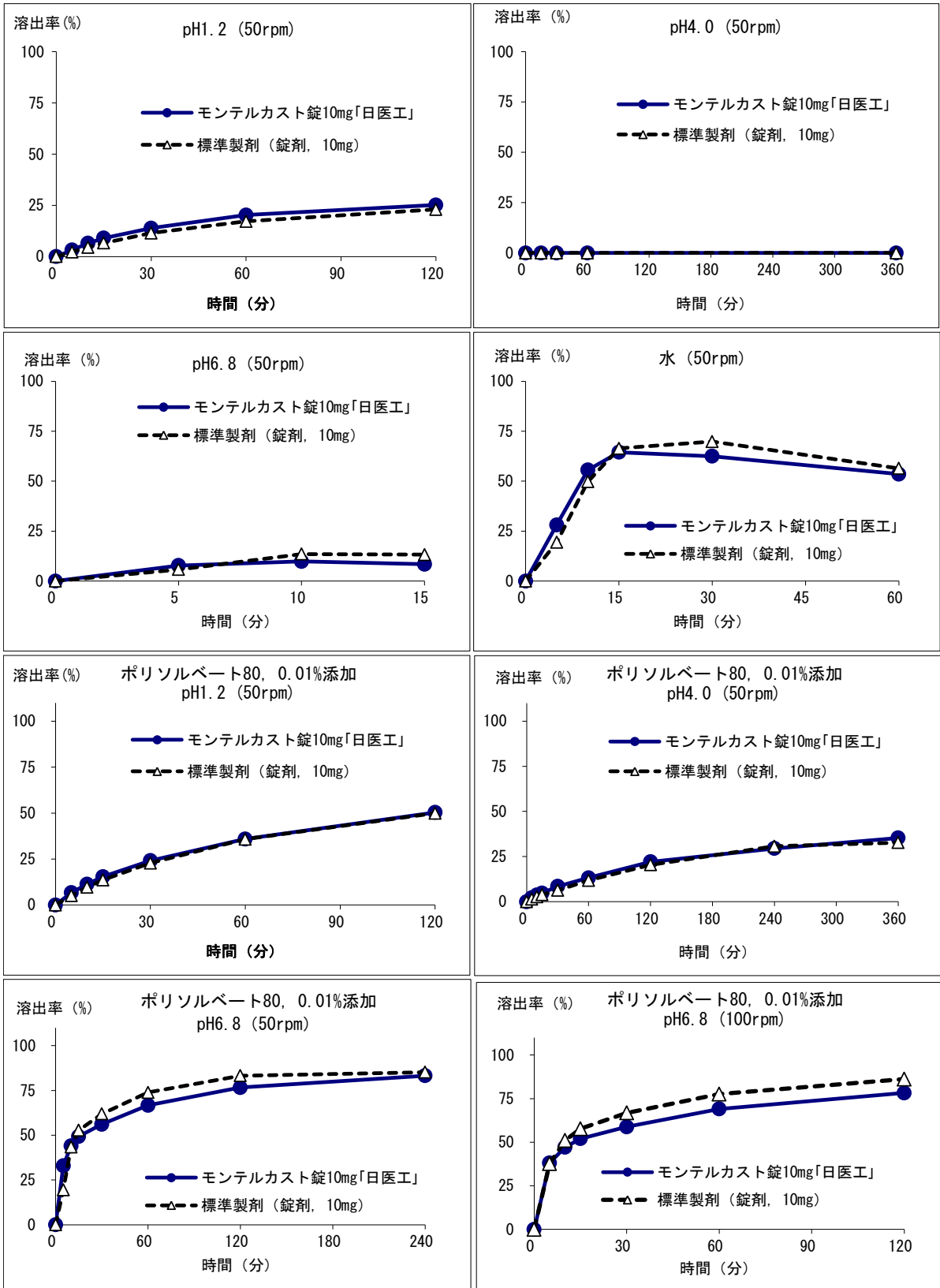
装置	日本薬局方 溶出試験法 パドル法
回転数及び試験液	50rpm (pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水)
	50rpm (ポリソルベート 80 0.01%添加 pH1.2, pH4.0, pH6.8)
	100rpm (ポリソルベート 80 0.01%添加 pH6.8)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤が 120 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、360 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤が 10 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 10 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤が 30 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 30 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。
- ・ pH1.2 (ポリソルベート 80 0.01%添加 50rpm) では、標準製剤が 120 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ pH4.0 (ポリソルベート 80 0.01%添加 50rpm) では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (ポリソルベート 80 0.01%添加 50rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (ポリソルベート 80 0.01%添加 100rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

<モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 24 年 2 月 29 日  
薬食審査発 0229 第 10 号）

試験条件

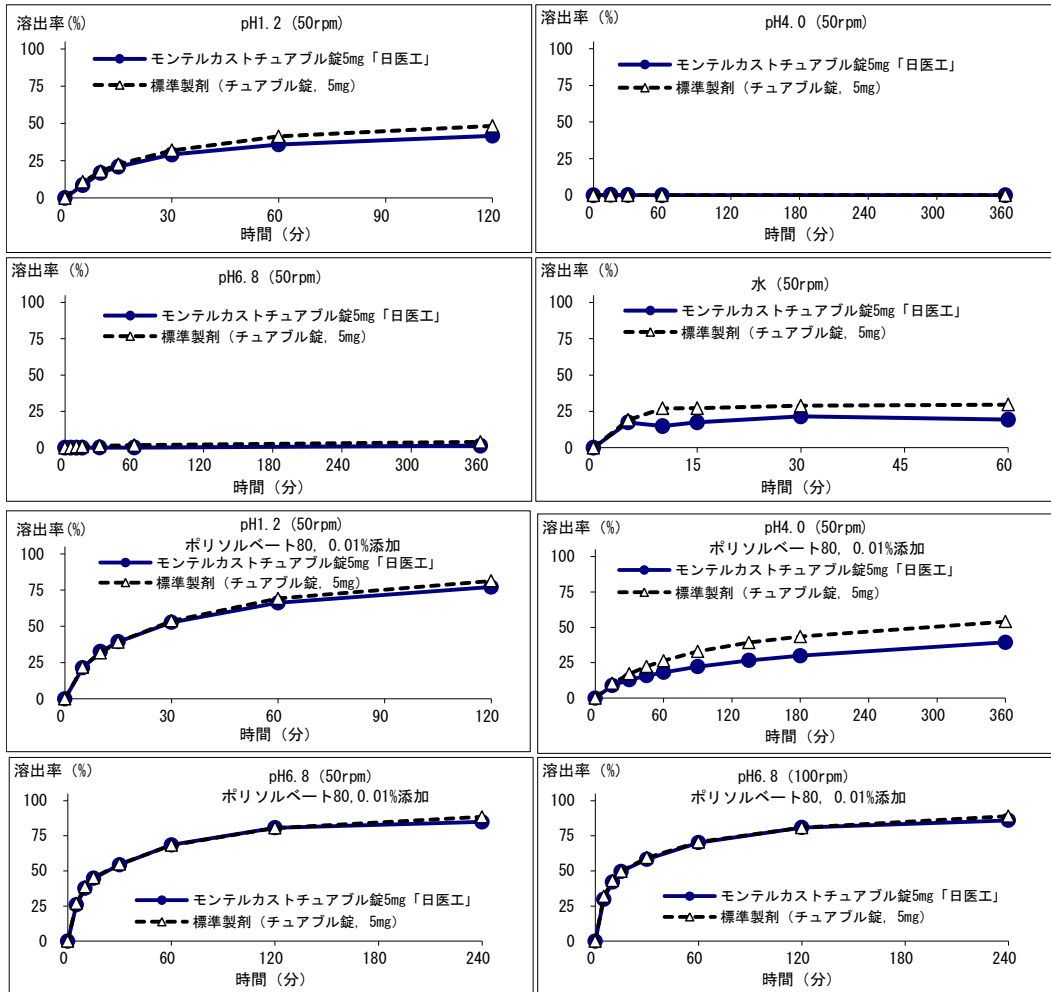
装置	日本薬局方 溶出試験法 パドル法
回転数及び試験液	50rpm (pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水) 50rpm (ポリソルベート 80 0.01%添加 pH1.2, pH4.0, pH6.8) 100rpm (ポリソルベート 80 0.01%添加 pH6.8)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤が 120 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、360 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、360 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤の平均溶出率が極大となる試験時間 (60 分) における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 60 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲になかった。また、標準製剤と本品との間に溶出性の著しい差は認められなかった。
- ・ pH1.2 (50rpm ポリソルベート 80 0.01%添加) では、標準製剤が 120 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。
- ・ pH4.0 (50rpm ポリソルベート 80 0.01%添加) では、f2 関数の値は 46 以上であった。
- ・ pH6.8 (50rpm ポリソルベート 80 0.01%添加) では、標準製剤の平均溶出率が 40% 及び 85%付近となる 2 時点において、本品の平均溶出率は、標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (100rpm ポリソルベート 80 0.01%添加) では、標準製剤の平均溶出率が 40% 及び 85%付近となる 2 時点において、本品の平均溶出率は、標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲にあった。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤と比較した結果、pH1.2, pH4.0, pH6.8 (50rpm) 及び pH1.2, pH4.0, pH6.8 (ポリソルベート 80, 0.01%添加, 50rpm) , pH6.8 (ポリソルベート 80, 0.01%添加, 100rpm) の試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合し、水 (50rpm) の試験液においては判定基準には適合しなかったが、著しい差ではなかった。

(溶出曲線)



(n=12)



<モンテルカスト細粒 4mg「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

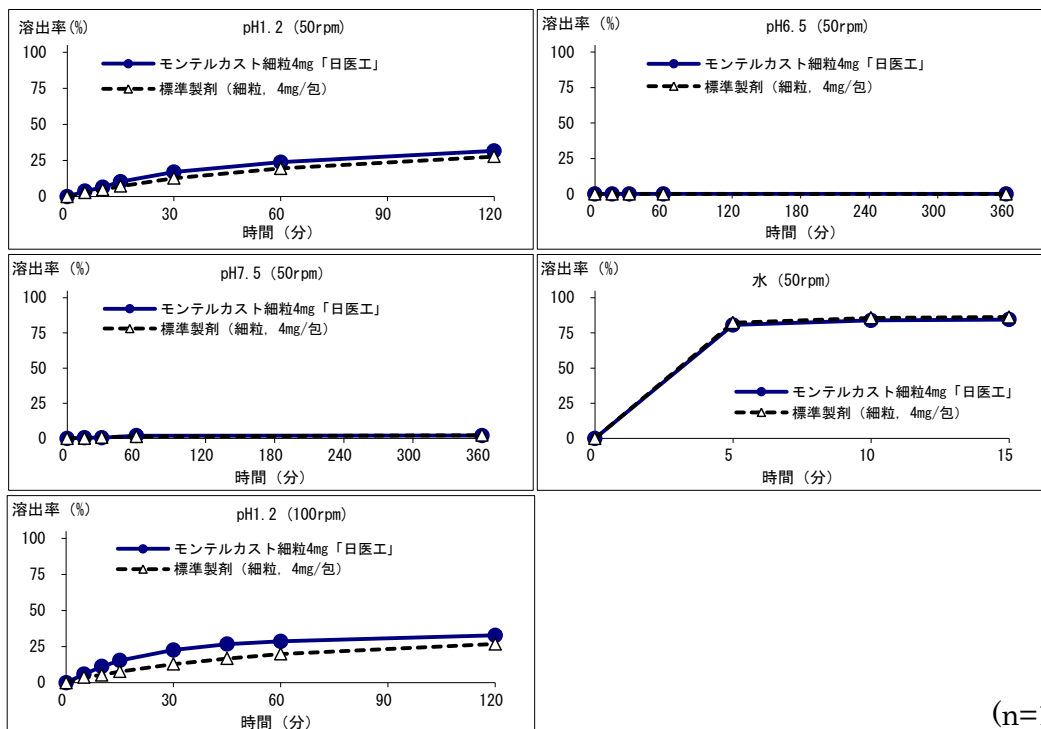
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2, pH6.5, pH7.5, 水), 100rpm (pH1.2)

[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤が 120 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ pH6.5 (50rpm) では、360 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ pH7.5 (50rpm) では、360 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。
- ・ 水 (50rpm) では、15 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。
- ・ pH1.2 (100rpm) では、f2 関数の値は 53 以上ではなかった。また、標準製剤と本品との間に溶出性の著しい差は認められなかった。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤と比較した結果、pH1.2, pH6.5, pH7.5, 水 (50rpm) の試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合し、pH1.2 (100rpm) の試験液においては判定基準には適合しなかったが、著しい差ではなかった。

(溶出曲線)



(n=12)

### (3) 含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験<sup>4)</sup>

<モンテルカスト錠 5mg「日医工」>

モンテルカスト錠 5mg「日医工」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、モンテルカスト錠 10mg「日医工」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

試験条件

装置	日本薬局方 溶出試験法	パドル法
回転数及び試験液	50rpm (pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水)	
	50rpm (ポリソルベート 80 0.01%添加	pH1.2, pH4.0, pH6.8)
	100rpm (ポリソルベート 80 0.01%添加	pH6.8)

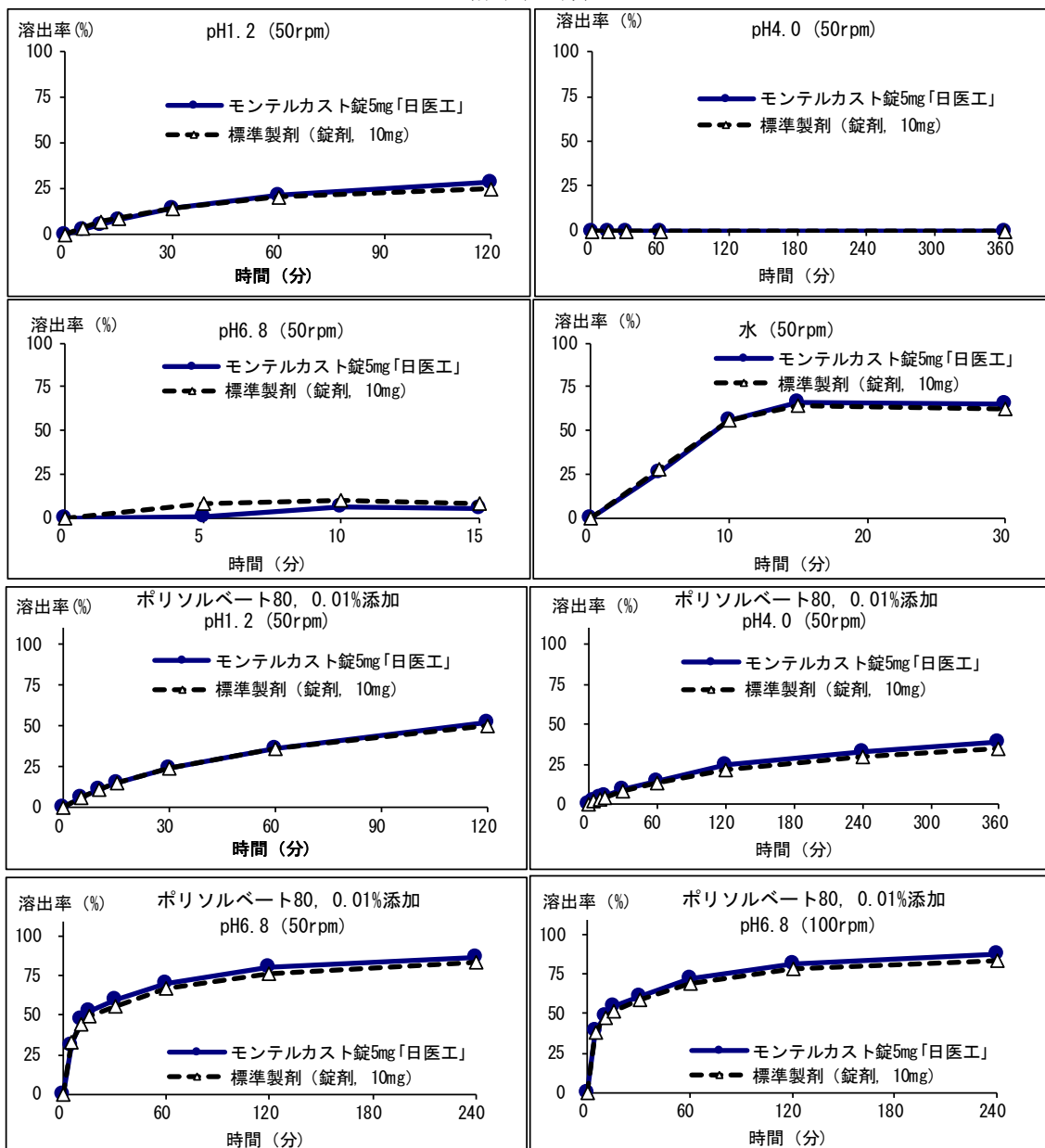
[判定]

- ・ pH1.2 (50rpm) では、標準製剤が 120 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあった。また、最終比較時点 (120 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。
- ・ pH4.0 (50rpm) では、360 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあった。また、最終比較時点 (360 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、10 分における本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあった。また、最終比較時点 (10 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤が 15 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 15 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。また、最終比較時点 (15 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±20%の範囲を超えるものがなかった。
- ・ pH1.2 (ポリソルベート 80 0.01%添加 50rpm) では、標準製剤が 120 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。また、最終比較時点 (120 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±20%の範囲を超えるものがなかった。
- ・ pH4.0 (ポリソルベート 80 0.01%添加 50rpm) では、標準製剤が 360 分における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあった。また、最終比較時点 (360 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±15%の範囲を超えるものがなかった。

- ・pH6.8 (ポリソルベート 80 0.01%添加 50rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。また、最終比較時点 (240 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。
- ・pH6.8 (ポリソルベート 80 0.01%添加 100rpm) では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。また、最終比較時点 (240 分) における本品の個々の溶出率は、本品の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤 (錠剤, 10mg) と比較した結果、全ての試験液において「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」の判定基準に適合したことから、生物学的に同等とみなされた。

(溶出曲線)



(n=12)

## 8. 生物学的試験法

該当資料なし

## 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

錠剤及びチュアブル錠は粉末とし、顆粒はそのままメタノール、水混液を加え遠心分離する。上澄液につき吸収スペクトルを測定するとき、波長 281～285nm, 325～329nm, 343～347nm 及び 357～361nm に吸収の極大を示す。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相 A：トリフルオロ酢酸溶液

移動相 B：メタノール、アセトニトリル混液

## 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

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

販売名	効能・効果
モンテルカスト錠 5mg 「日医工」 モンテルカスト錠 10mg 「日医工」	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 「日医工」 モンテルカスト細粒 4mg 「日医工」	気管支喘息

### 2. 用法及び用量

販売名	用法・用量
モンテルカスト錠 5mg 「日医工」 モンテルカスト錠 10mg 「日医工」	<p><b>&lt;気管支喘息&gt;</b> 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><b>&lt;アレルギー性鼻炎&gt;</b> 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>
モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」	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。
モンテルカスト細粒 4mg 「日医工」	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。

<モンテルカスト錠 5mg 「日医工」, モンテルカスト錠 10mg 「日医工」>

#### <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 「日医工」>

#### <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。

<モンテルカスト細粒 4mg 「日医工」>

#### <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. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

プラナルカスト水和物

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>5)</sup>

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

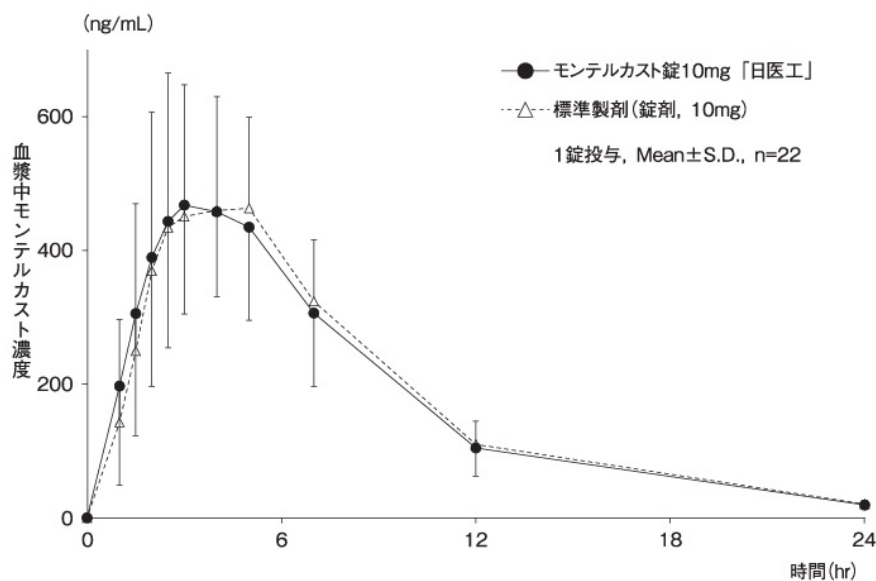
(「臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

<モンテルカスト錠 10mg 「日医工」 ><sup>6)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成24年2月29日薬食審査発0229第10号)

モンテルカスト錠 10mg 「日医工」及び標準製剤を、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)健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中モンテルカスト濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC, Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80)\sim\log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



[薬物速度論的パラメータ]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
モンテルカスト錠 10mg「日医工」	4250±1043	575±139	3.20±1.36	4.34±0.66
標準製剤 (錠剤, 10mg)	4314±980	594±154	3.36±1.28	4.49±1.48

(1錠投与, Mean±S.D., n=22)

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

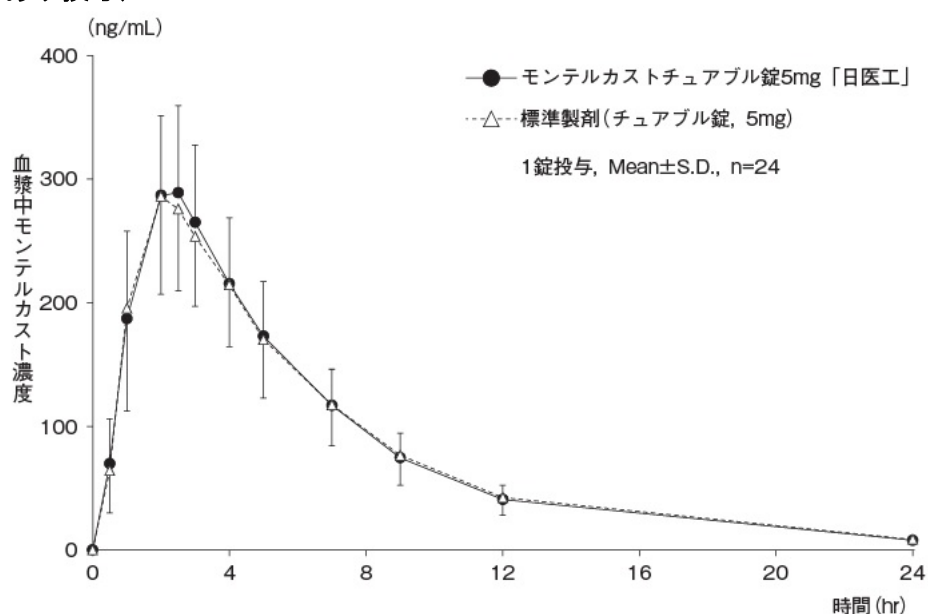


<モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」 ><sup>7)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）

モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」及び標準製剤を、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）健康成人男性に絶食単回経口投与（咀嚼・水あり投与又は咀嚼・水なし投与及び口腔内溶解・水あり投与又は口腔内溶解・水なし投与）して血漿中モンテルカスト濃度を測定し，得られた薬物動態パラメータ（AUC, Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果， $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり，両剤の生物学的同等性が確認された。

**（咀嚼・水あり投与）**

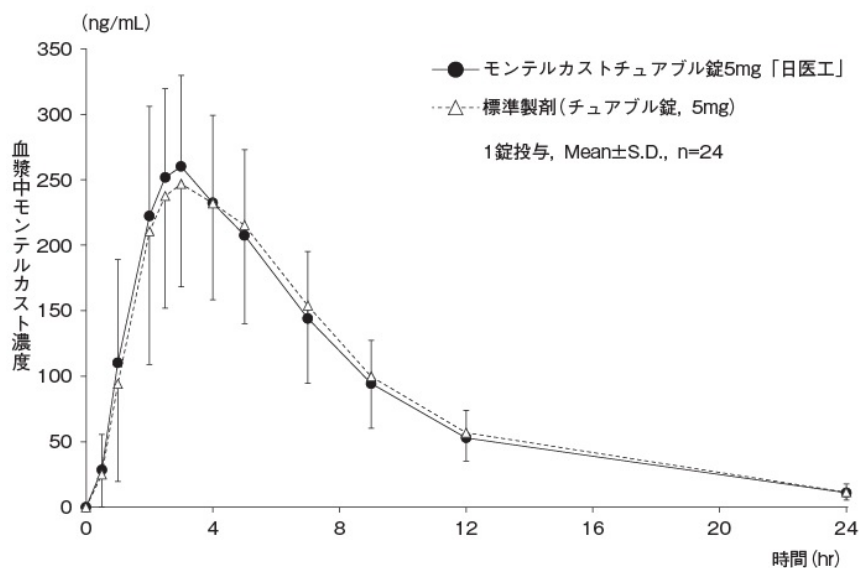


[薬物速度論的パラメータ：咀嚼・水あり投与]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」	1981±401	309±62	2.25±0.59	4.68±0.40
標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)	1986±429	314±46	2.35±0.60	4.76±0.48

(1 錠投与, Mean±S.D., n=24)

(咀嚼・水なし投与)

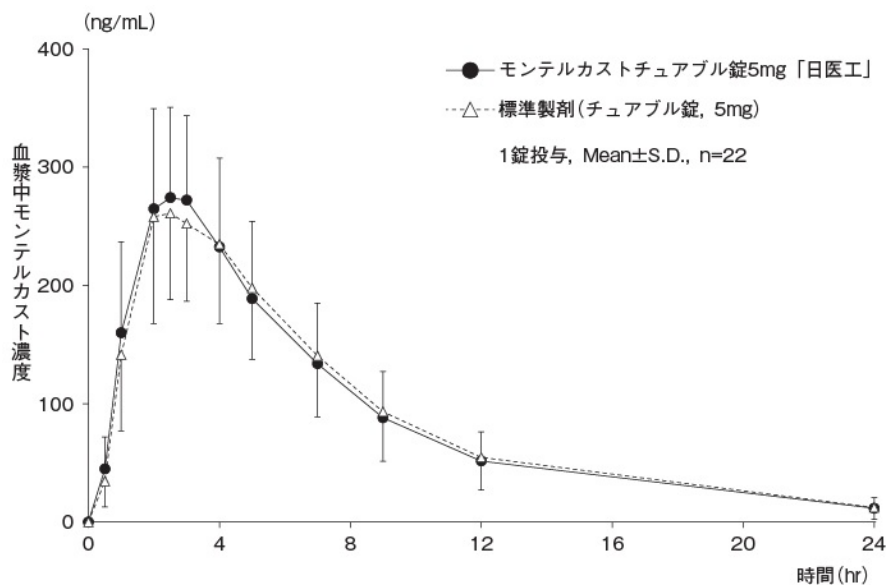


[薬物速度論的パラメータ：咀嚼・水なし投与]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」	2114±499	299±53	2.94±1.30	4.79±0.54
標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)	2152±543	301±57	3.00±1.01	4.82±0.56

(1錠投与, Mean±S.D., n=24)

(口腔内溶解・水あり投与)

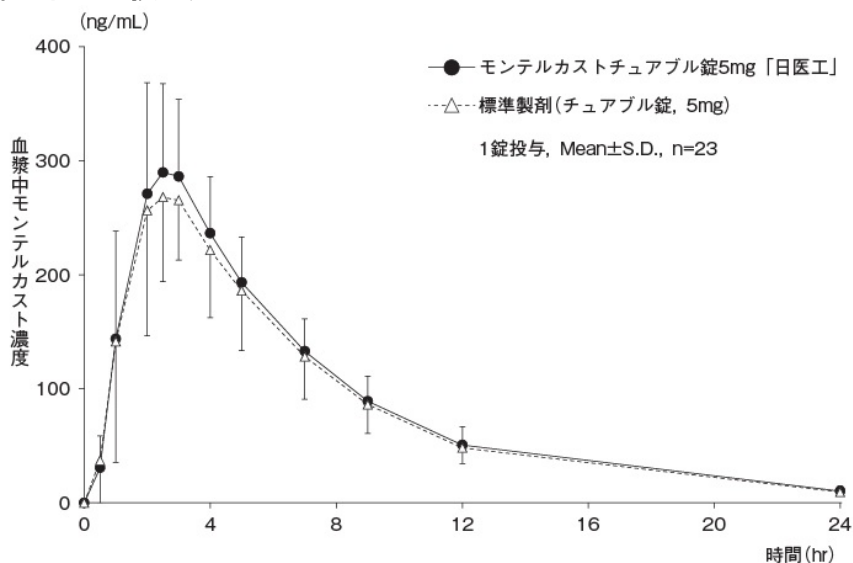


[薬物速度論的パラメータ：口腔内溶解・水あり投与]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」	2141±697	312±60	2.66±0.75	5.00±0.82
標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)	2165±677	305±56	2.66±0.89	4.94±0.71

(1錠投与, Mean±S.D., n=22)

(口腔内溶解・水なし投与)



[薬物速度論的パラメータ：口腔内溶解・水なし投与]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>t</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」	2144±428	323±60	2.61±0.69	4.83±0.50
標準製剤 (チュアブル錠, 5mg)	2042±426	318±58	2.50±0.83	4.77±0.45

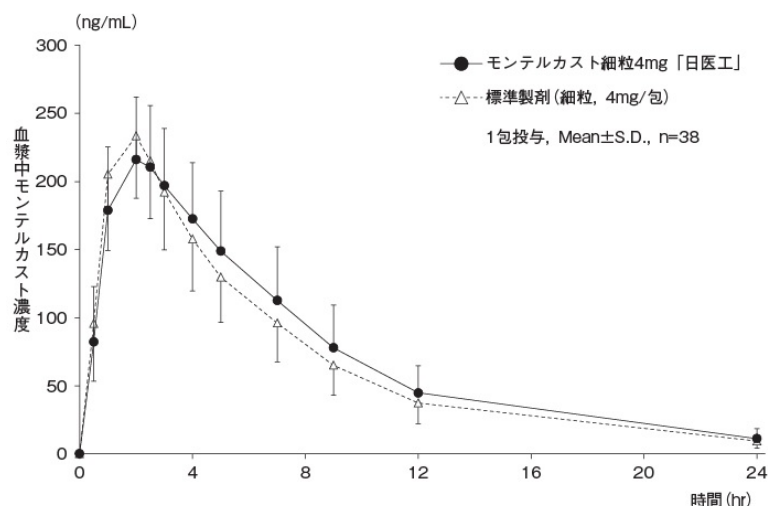
(1錠投与, Mean±S.D., n=23)

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

<モンテルカスト細粒 4mg「日医工」><sup>7)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について (平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)

モンテルカスト細粒 4mg「日医工」及び標準製剤を, クロスオーバー法によりそれぞれ 1 包 (モンテルカストとして 4mg) 健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中モンテルカスト濃度を測定し, 得られた薬物動態パラメータ (AUC, C<sub>max</sub>) 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。



[薬物速度論的パラメータ]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
モンテルカスト細粒 4mg 「日医工」	1809±499	226±41	2.32±0.84	5.29±0.77
標準製剤 (細粒, 4mg/包)	1672±431	238±44	1.82±0.50	5.33±0.79

(1包投与, Mean±S.D., n=38)

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

(「VIII - 7. 相互作用」, 「VIII - 14. 適用上の注意」の項参照)

(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**

(「VIII - 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」の項参照)

### **(3) 乳汁への移行性**

(「VIII - 10. 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

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当記載事項なし

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

#### 【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」の項参照）

### 5. 慎重投与内容とその理由

該当記載事項なし

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

#### （1）＜錠 5mg, 錠 10mg＞

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。

＜チュアブル錠，細粒＞

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）＜錠 5mg, 錠 10mg＞

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。

＜チュアブル錠 ，細粒＞

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）

続き

- (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好酸球性多発血管炎性肉芽腫症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) <細粒>  
小児では一般に自覚症状を訴える能力が劣るので、本剤の投与に際しては、保護者等に対し、患者の状態を十分に観察し、異常が認められた場合には速やかに主治医に連絡する等の適切な処置をするように注意を与えること。

## 7. 相互作用

本剤は、主として薬物代謝酵素チトクローム P450 (CYP) 2C8/2C9 及び 3A4 で代謝される。

### (1) 併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

### (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（以下、全て頻度不明）

- 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。

続き

### (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， $\gamma$ - 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，けん怠感，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

- 1) **禁忌**：本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) **重大な副作用**：①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。
- 3) **その他の副作用**：過敏症（皮疹，そう痒，蕁麻疹，肝臓の好酸球浸潤）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。

## 9. 高齢者への投与

該当記載事項なし



## 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) <錠 5mg，錠 10mg，チュアブル錠>  
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。〕  
<細粒>  
授乳中の婦人に投与する場合は慎重に投与すること。〔動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。〕  
(注) 本剤の承認用法・用量は，1歳以上6歳未満小児に対してモンテルカストとして1日1回4mgである。

## 11. 小児等への投与

<錠 5mg，錠 10mg>

### <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。〕

<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。〕

<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

該当記載事項なし

## 13. 過量投与

該当記載事項なし

## 14. 適用上の注意

＜錠 5mg, 錠 10mg, 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。

＜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

## 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「日医工」 モンテルカスト錠 10mg「日医工」 モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」 モンテルカスト細粒 4mg「日医工」	なし
有効成分	モンテルカストナトリウム	なし

### 2. 有効期間又は使用期限

外箱等に表示の使用期限内に使用すること。（3年：安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

錠 5mg, 錠 10mg：室温保存, 遮光保存（開封後は, 湿気を避けて保存すること。）

チュアブル錠：気密容器で室温保存, 遮光保存

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

（「貯法・保存条件」の項参照）

#### (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）

患者向医薬品ガイド：有, くすりのしおり：有

（「VIII. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目」を参照）

#### (3) 調剤時の留意点について

該当記載事項なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

販売名	PTP 包装・分包
モンテルカスト錠 5mg「日医工」	28錠 [14錠×2; <パッケージ調剤用>] 100錠 (10錠×10)
モンテルカスト錠 10mg「日医工」	28錠 [14錠×2; <パッケージ調剤用>] 100錠 (10錠×10), 140錠 (14錠×10)
モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」	28錠 [14錠×2; <パッケージ調剤用>] 100錠 (10錠×10), 140錠 (14錠×10)
モンテルカスト細粒 4mg「日医工」	28包 (7包/袋×4), 140包 (7包/袋×20)

### 7. 容器の材質

PTP：環状ポリオレフィン・ポリプロピレン複合フィルム, アルミニウム箔

分包：アルミニウム・ポリエチレン複合フィルム, ポリプロピレンフィルム袋

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：キプレス錠 5mg/10mg, シングレア錠 5mg/10mg

キプレスチュアブル錠 5mg, シングレアチュアブル錠 5mg

キプレス細粒 4mg, シングレア細粒 4mg

### 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	製造承認年月日	承認番号
モンテルカスト錠 5mg「日医工」	2016年 8月 15日	22800AMX00583000
モンテルカスト錠 10mg「日医工」	2016年 8月 15日	22800AMX00584000
モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」	2017年 2月 15日	22900AMX00149000
モンテルカスト細粒 4mg「日医工」	2017年 2月 15日	22900AMX00343000

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「日医工」	2016年 12月 9日
モンテルカスト錠 10mg「日医工」	2016年 12月 9日
モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」	2017年 6月 16日
モンテルカスト細粒 4mg「日医工」	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

効能・効果追加年月日：2016年 11月 9日

販売名：モンテルカスト錠 5mg「日医工」，モンテルカスト錠 10mg「日医工」

	後	前
効能・効果	気管支喘息，アレルギー性鼻炎	アレルギー性鼻炎
用法・用量	<u>＜気管支喘息＞</u> 通常，成人にはモンテルカストとして <u>10mgを1日1回就寝前に経口投与する。</u> <u>＜アレルギー性鼻炎＞</u> （現行どおり）	←記載なし  アレルギー性鼻炎 （略）

（  ：効能・効果追加に伴う追加箇所）

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. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は，投薬期間制限の対象となる医薬品ではない。

16. 各種コード

販売名	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード	HOT(9桁) コード
モンテルカスト錠 5mg「日医工」	4490026F3012 (統一収載コード)	622528601	125286601
モンテルカスト錠 10mg「日医工」	4490026F2016 (統一収載コード)	622528701	125287301
モンテルカストチュアブル錠 5mg「日医工」	4490026F1010 (統一収載コード)	622567701	125677201
モンテルカスト細粒 4mg「日医工」	4490026C1013 (統一収載コード)	622567601	125676501

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。

## **X I. 文献**

### **1. 引用文献**

- 1) 日医工株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 日医工株式会社 社内資料 (食品との配合変化試験)
- 3) 日医工株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 4) 日医工株式会社 社内資料 (錠 5mg : 生物学的同等性資料)
- 5) 第十七改正日本薬局方解説書 C - 5593, 廣川書店, 東京 (2016)
- 6) 生島一平 他 : 診療と新薬, 53 (9) , 25 (2016)
- 7) 沖 守 他 : 医学と薬学, 74 (5) , 571 (2017)

### **2. その他の参考文献**

なし

## **X II. 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 III. 備考**

### **その他の関連資料**

なし

付表 1 — 1

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 起源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 起源又は発見の経緯	○	×	○
	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	○	○	○

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される

付表 1 — 2

薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 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 起源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 起源又は発見の経緯	○	×	○
	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	○	×	×

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される



付表 1 — 3

医薬発第 481 号（平成 11 年 4 月 8 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 起源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 起源又は発見の経緯	○	×	○
	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 物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定	○	×	×
	2 物理的・科学的性質等	○	×	×
	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 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 生殖発生毒性	○	×	×
	4 変異原性	○	×	×
	5 がん原性	△	×	×
	6 局所刺激性	△	×	×
	7 その他の毒性	△	×	×
ホ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 一般薬理	○	×	×
ヘ 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	×	○	○
ト 臨床試験の成績に関する資料	臨床試験成績	○	×	×

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される

付表 1 — 4

薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 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 起源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 起源又は発見の経緯	○	×	○
	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 物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定	○	×	×
	2 物理的・化学的性質等	○	×	×
	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 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 急性毒性	○	×	×
	2 亜急性毒性	○	×	×
	3 慢性毒性	○	×	×
	4 生殖に及ぼす影響	○	×	×
	5 依存性	△	×	×
	6 抗原性	△	×	×
	7 変異原性	△	×	×
	8 がん原性	△	×	×
	9 局所刺激	△	×	×
ホ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 一般薬理	○	×	×
ヘ 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	×	○	○
ト 臨床試験の試験成績に関する資料	臨床試験の試験成績	○	×	○

○：添付，×：添付不要，△：個々の医薬品により判断される