

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2018. 10. 25 初版

有効成分	モンテルカストナトリウム		
品目名（製造販売業者） 【後発医薬品】	1	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「AA」	浜理薬品工業
	2	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「DSEP」	第一三共エスファ
	3	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「EE」	エルメッド エーザイ
	4	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「JG」	日本ジェネリック
	5	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「KN」	小林化工
	6	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「SN」	シオノケミカル
	7	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「TCK」	辰巳化学
	8	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「YD」	陽進堂
	9	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「アスペン」	田村薬品工業
	10	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「オーハラ」	大原薬品工業
	11	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「科研」	ダイト
	12	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「ケミファ」	日本ケミファ
	13	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「サワイ」	沢井製薬
	14	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「サンド」	サンド
	15	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「三和」	三和化学研究所
	16	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「ゼリア」	日本薬品工業
	17	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タカタ」	高田製薬
	18	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「武田テバ」	武田テバファーマ
	19	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「タナベ」	ニプロESファーマ
	20	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「トーワ」	東和薬品
	21	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「日医工」	日医工
	22	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「ニプロ」	ニプロ
	23	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「ファイザー」	ファイザー
	24	モンテルカストチュアブル錠 5mg 「明治」	日新製薬（山形）
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	キプレスチュアブル錠 5mg	杏林製薬
	②	シングレアチュアブル錠 5mg	MSD
効能・効果	http://www.bbdb.jp		
用法・用量	http://www.bbdb.jp		
添加物	http://www.bbdb.jp		
解離定数 ^{1) 2)}	pKa=6.5±0.8		
溶解度 ^{1) 2)} (測定温度：20℃)	水に溶けやすい（溶解度；200～250mg/mL）。		
原薬の安定性 ^{1) 2)}	水	なし	
	液性 (pH)	なし	

光	試験区分		保存条件	保存期間	保存形態	結果
	苛酷試験	光	白色蛍光灯	120 万 lux・hr	ハーフフィルムで覆ったガラス容器	照射された表面の黄色への着色並びに水分及び溶液の色の増加
試験項目：外観、類縁物質、水分、定量、溶液の色*、pH*、旋光度*、IR スペクトル*、濁度、光学純度（* 苛酷試験でのみ実施）						
その他	試験区分		保存条件	保存期間	保存形態	結果
	長期保存試験		25℃、 60%RH	36 ヶ月	密栓ステンレス容器（窒素封入）	変化なし
	加速試験		40℃、 75%RH	6 ヶ月	密栓ステンレス容器（窒素封入）	変化なし
	苛酷試験	温度	60℃	12 週間	密栓褐色ガラス瓶	外観及び溶液の色のわずかな変化
		湿度	25℃、 90%RH	48 時間	開栓透明ガラス容器	潮解による外観上の変化、水分含量が増加し（安定性には影響なし）、光学純度、施光度の変化及び IR スペクトルの不適合が認められた。
試験項目：外観、類縁物質、水分、定量、溶液の色*、pH*、旋光度*、IR スペクトル*、濁度、光学純度（* 苛酷試験でのみ実施）						
膜透過性		なし				
BCS・Biowaiver option		なし				
薬効分類		449 その他のアレルギー用薬				
規格単位		5 mg 1 錠				

【記載データ一覧】

	品目名	製造販売業者	BE	品質 再評価	溶出	検査
1	モンテルカストチュアブル錠5mg「AA」	浜理薬品工業	○			
2	モンテルカストチュアブル錠5mg「DSEP」	第一三共エスファ	○			
3	モンテルカストチュアブル錠5mg「EE」	エルメッド エーザイ	○			
4	モンテルカストチュアブル錠5mg「JG」	日本ジェネリック	○			
5	モンテルカストチュアブル錠5mg「KN」	小林化工	○			
6	モンテルカストチュアブル錠5mg「SN」	シオノケミカル	○			
7	モンテルカストチュアブル錠5mg「TCK」	辰巳化学	○			
8	モンテルカストチュアブル錠5mg「YD」	陽進堂	○			
9	モンテルカストチュアブル錠5mg「アスペン」	田村薬品工業	○			
10	モンテルカストチュアブル錠5mg「オーハラ」	大原薬品工業	○			
11	モンテルカストチュアブル錠5mg「科研」	ダイト	○			
12	モンテルカストチュアブル錠5mg「ケミファ」	日本ケミファ	○			
13	モンテルカストチュアブル錠5mg「サワイ」	沢井製薬	○			
14	モンテルカストチュアブル錠5mg「サンド」	サンド	○			
15	モンテルカストチュアブル錠5mg「三和」	三和化学研究所	○			
16	モンテルカストチュアブル錠5mg「ゼリア」	日本薬品工業	○			
17	モンテルカストチュアブル錠5mg「タカタ」	高田製薬	○			
18	モンテルカストチュアブル錠5mg「武田テバ」	武田テバファーマ	○			
19	モンテルカストチュアブル錠5mg「タナベ」	ニプロESファーマ	○			
20	モンテルカストチュアブル錠5mg「トーワ」	東和薬品	○			
21	モンテルカストチュアブル錠5mg「日医工」	日医工	○			
22	モンテルカストチュアブル錠5mg「ニプロ」	ニプロ	○			
23	モンテルカストチュアブル錠5mg「ファイザー」	ファイザー	○			
24	モンテルカストチュアブル錠5mg「明治」	日新製薬（山形）	○			

注)「BE」は、生物学的同等性 (BE) 試験結果を示し、○印がついているものは本情報集にデータを掲載している。【5～20 ページ】

注)「品質再評価」の項目に○印がついているものは、品質再評価結果通知が発出されている品目である。空欄となっているものは、品質再評価指定以降に承認された品目等である。【21 ページ】

注)「溶出」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である（上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験結果中の番号と対応している。）。全品目で空欄となっている場合は、溶出試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【22 ページ】

注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【23 ページ】

注) 浜理薬品工業、第一三共エスファ、エルメッド エーザイ、日本ジェネリック、小林化工、シオノケミカル、辰巳化学、陽進堂、田村薬品工業、大原薬品工業、ダイト、日本ケミファ、サンド、日本薬品工業、ニプロ ES

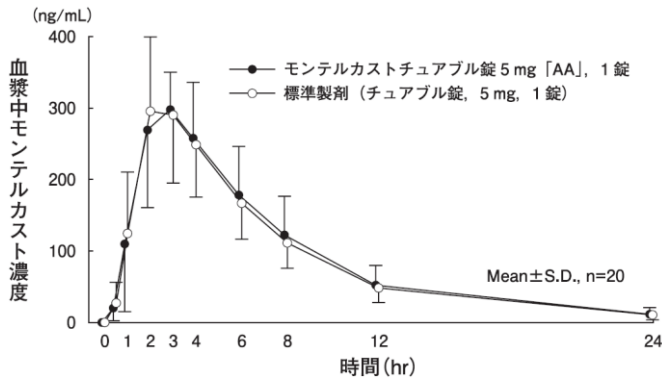
ファーマ、ニプロ及び日新製薬（山形）の製剤は、承認時において他社と共同開発されたものである（医薬品審査管理課調査による）。

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

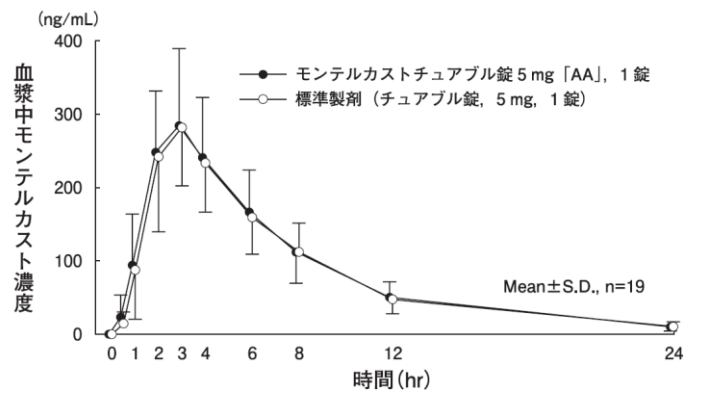
1

水なしで服用

<口中溶解>

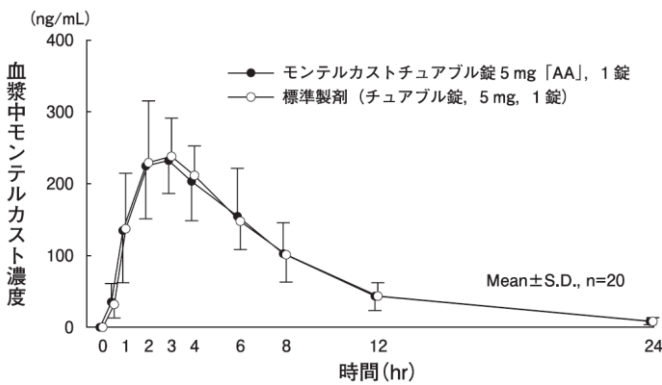


<咀嚼>

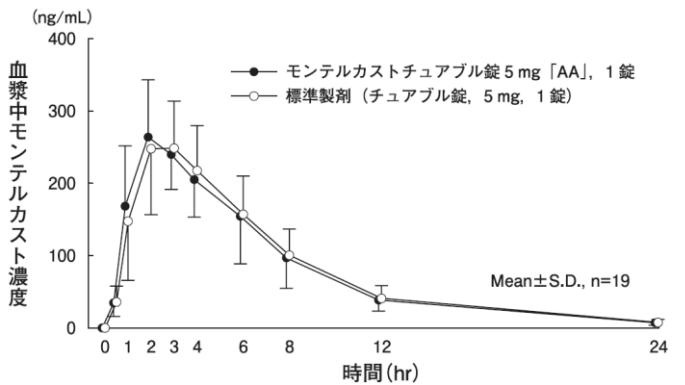


水で服用

<口中溶解>

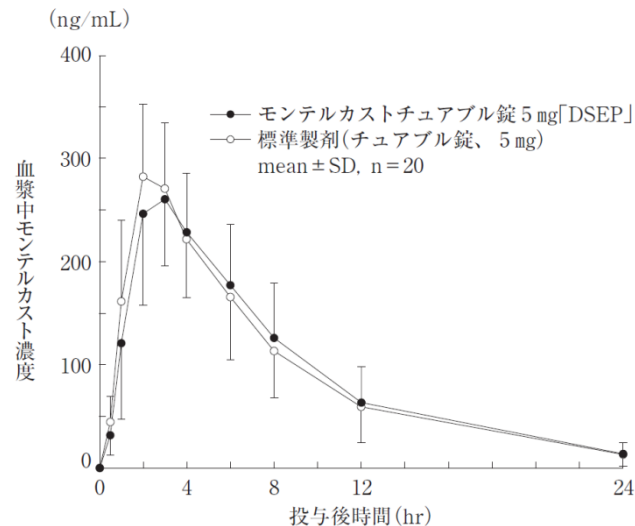


<咀嚼>

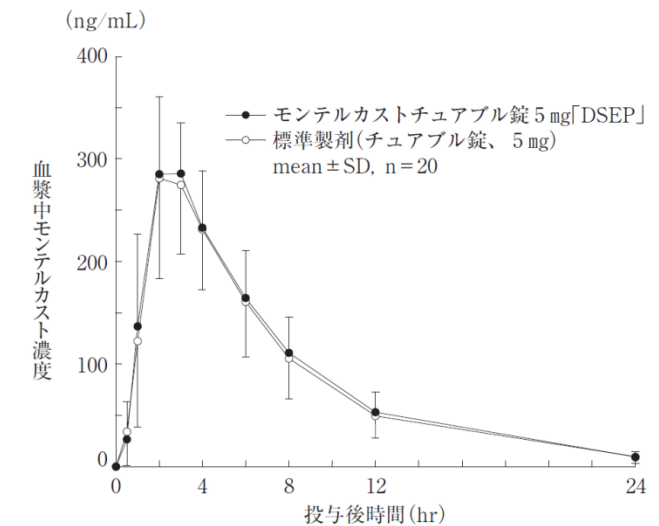


2

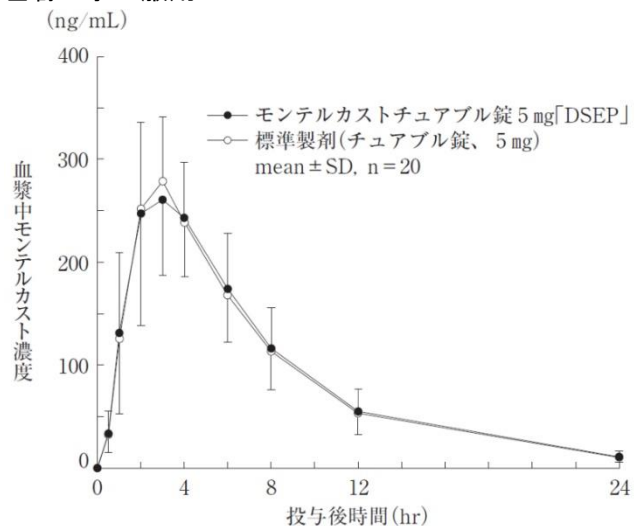
口中溶解・水で服用



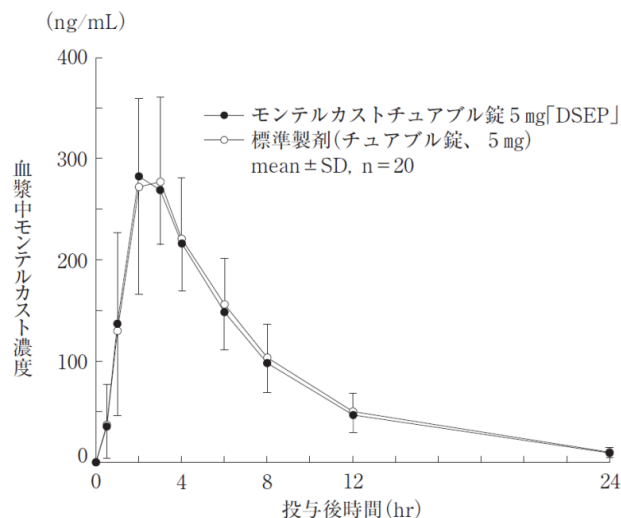
口中溶解・水なしで服用



咀嚼・水で服用

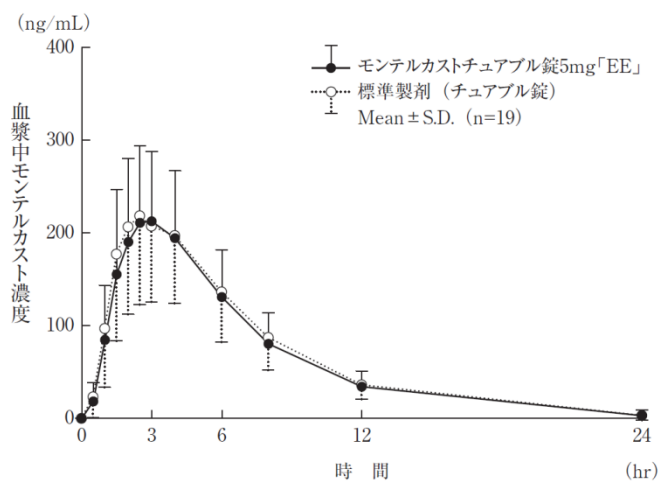


咀嚼・水なしで服用

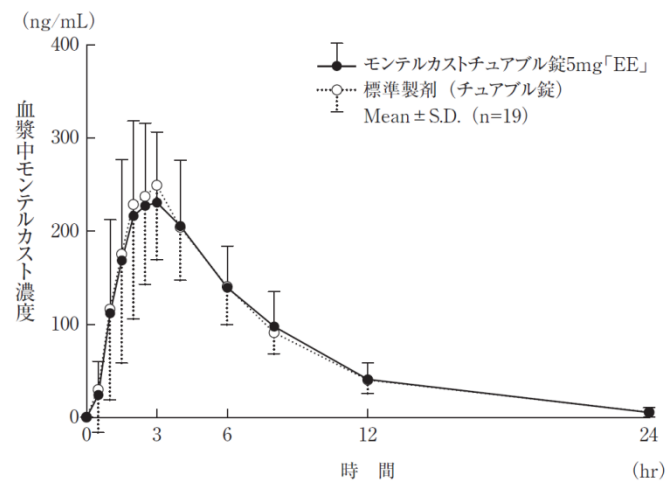


3

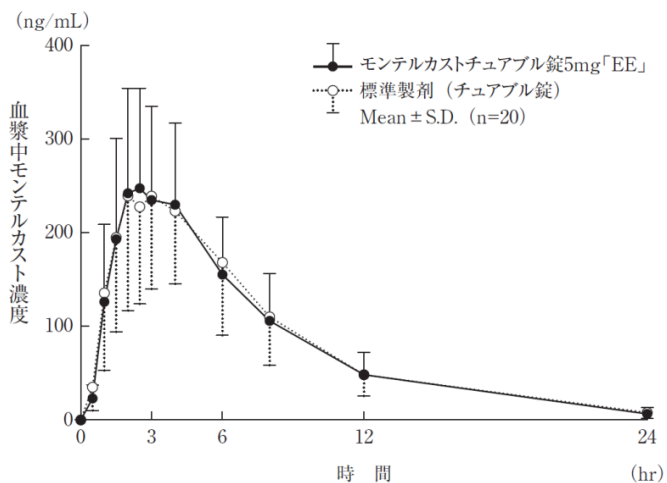
口中で溶かし、水あり投与



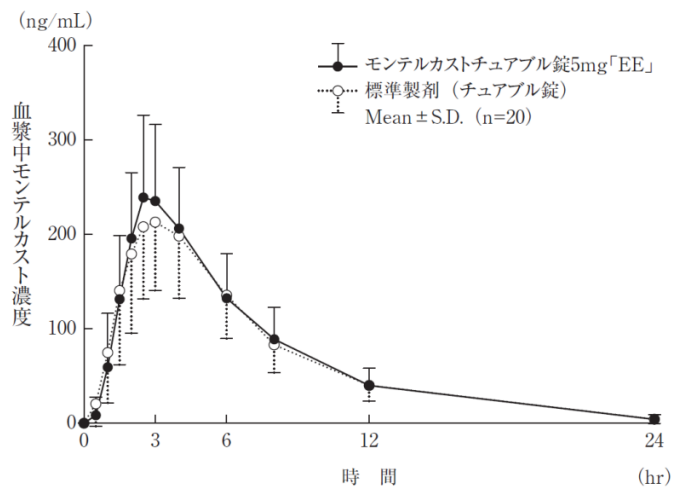
口中で溶かし、水なし投与



かみくだき、水あり投与



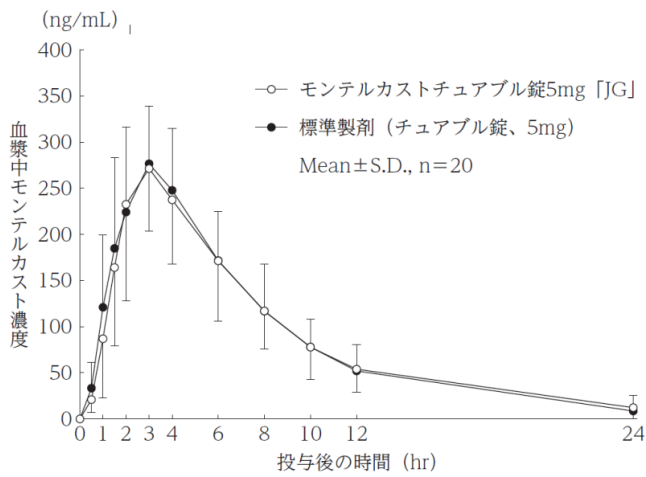
かみくだき、水なし投与



4

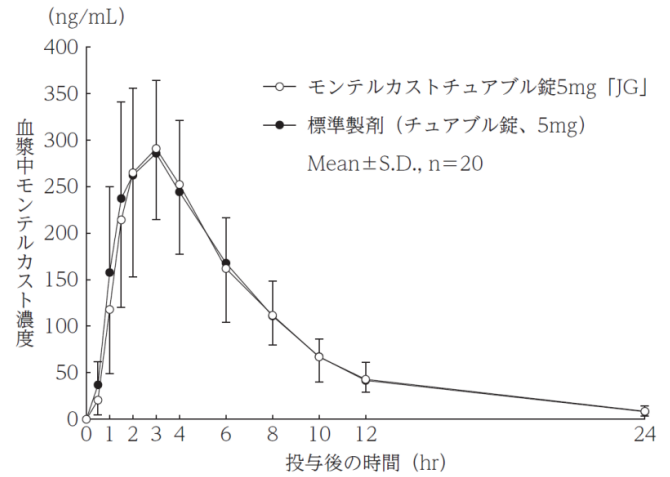
水で服用

咀嚼して服用



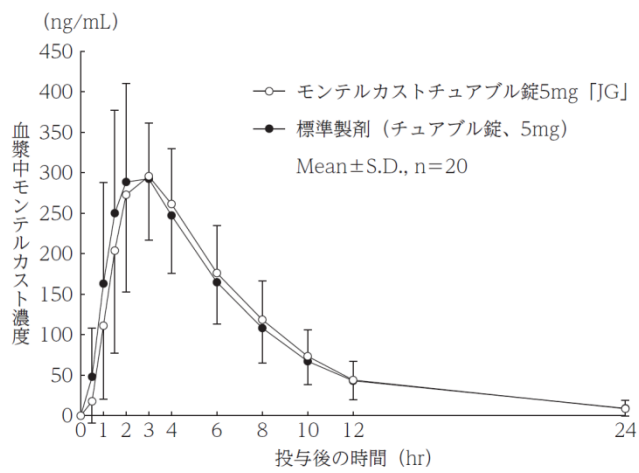
水で服用

口中溶解して服用



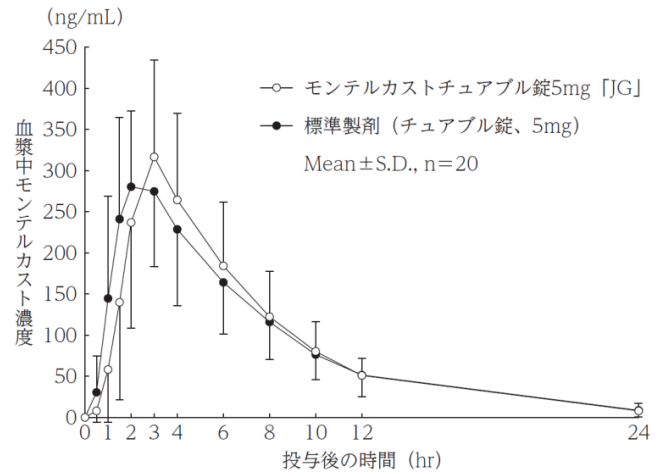
水なしで服用

咀嚼して服用



水なしで服用

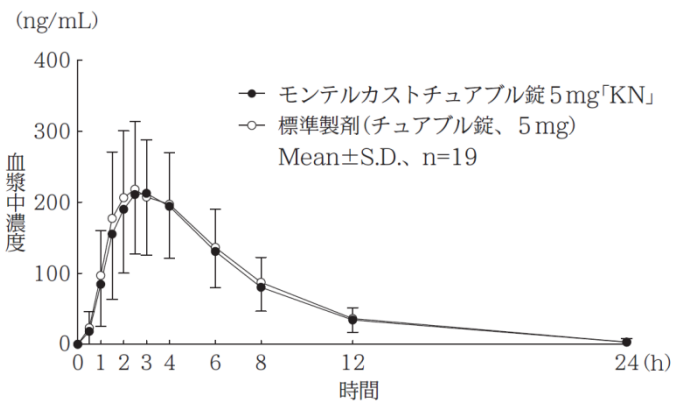
口中溶解して服用



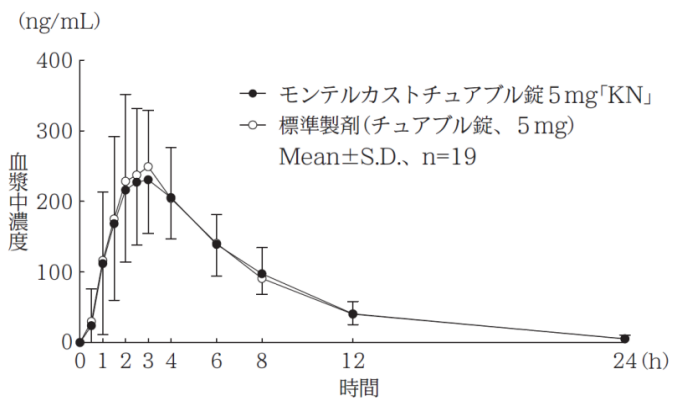
5

口中で溶かして服用した場合

水あり

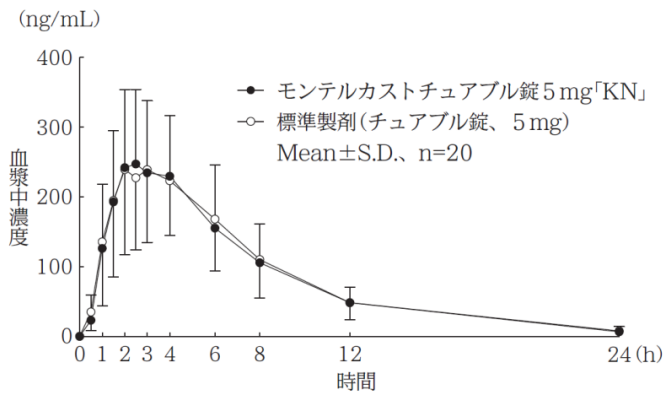


水なし

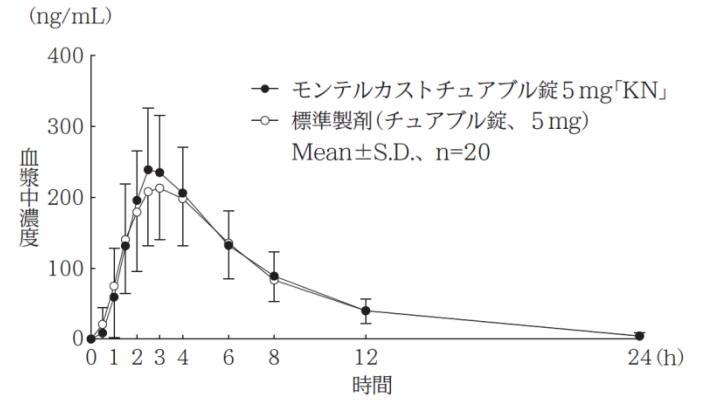


口中でかみくだいて服用した場合

水あり

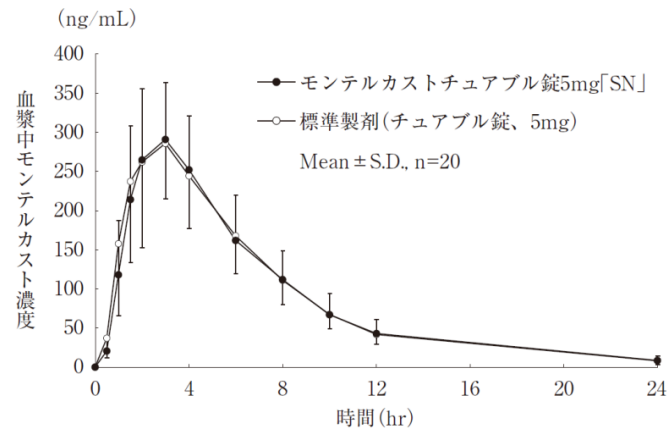


水なし

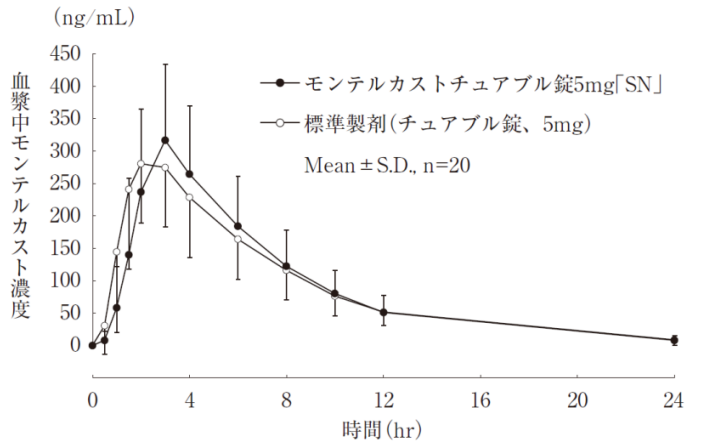


6

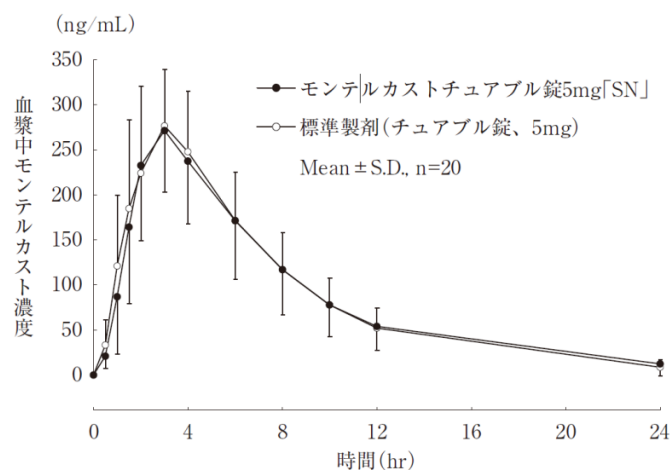
口中溶解後、水あり投与



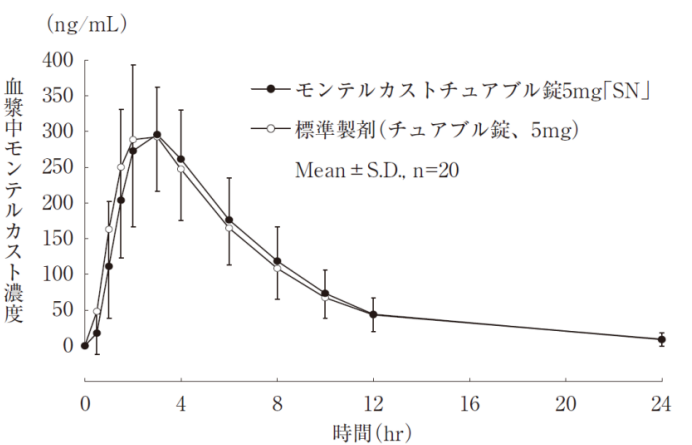
口中溶解後、水なし投与



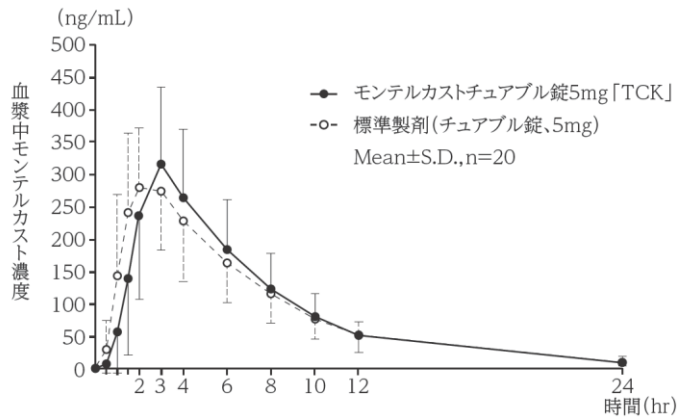
咀嚼後、水あり投与



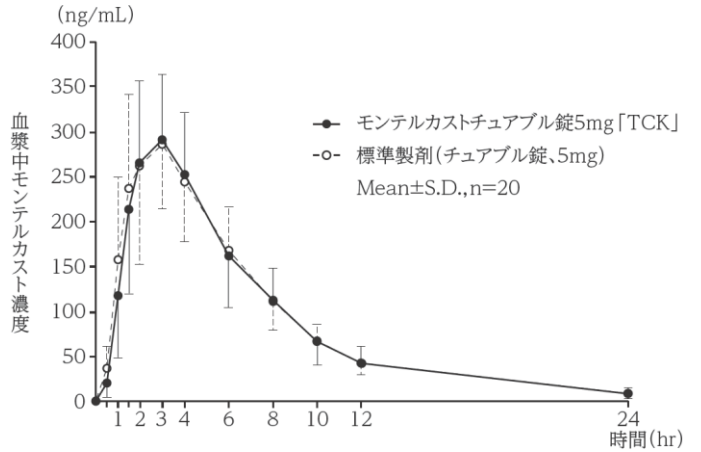
咀嚼後、水なし投与



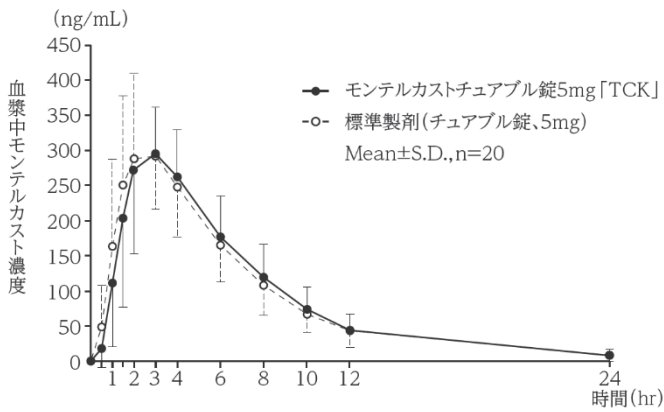
口中溶解後、水なし投与



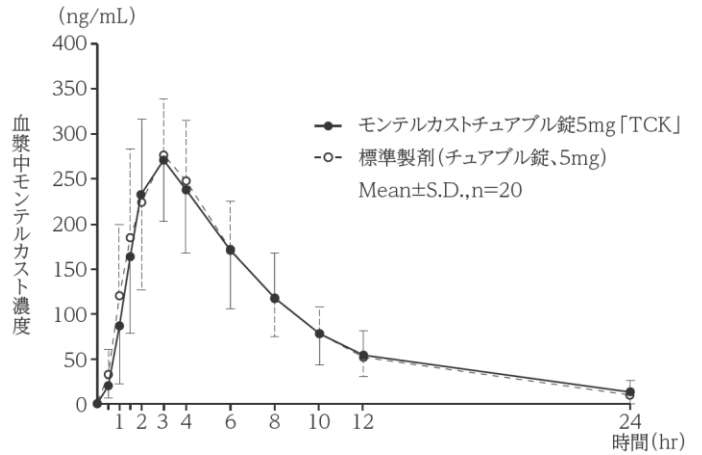
口中溶解後、水あり投与



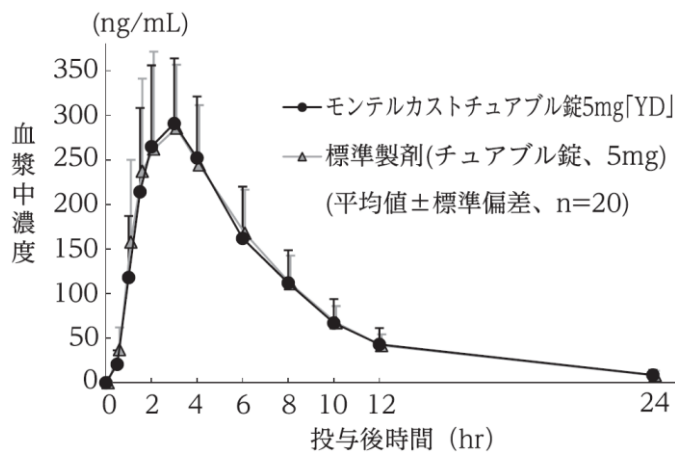
咀嚼後、水なし投与



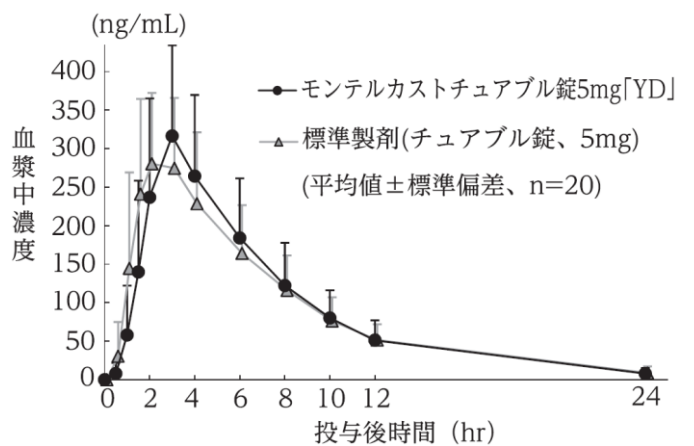
咀嚼後、水あり投与



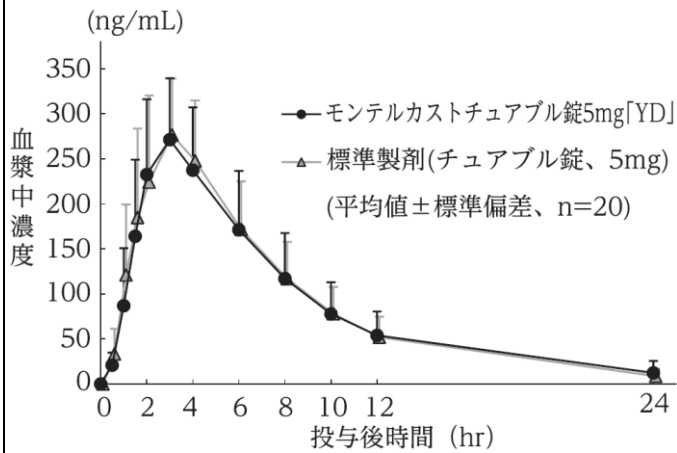
口中溶解後、水で服用した場合



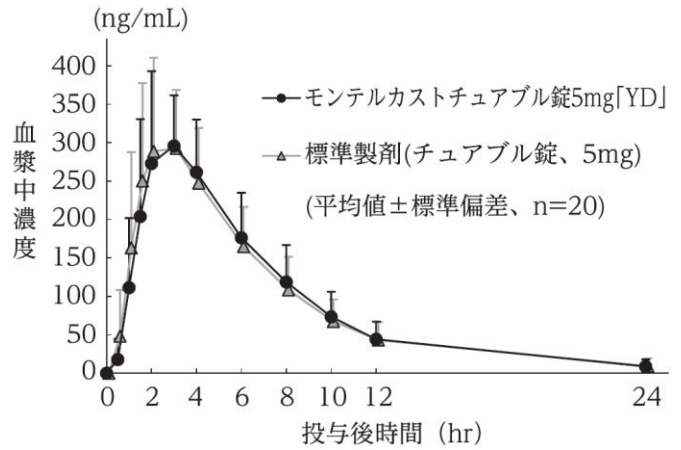
口中溶解後、水なしで服用した場合



咀嚼後、水で服用した場合



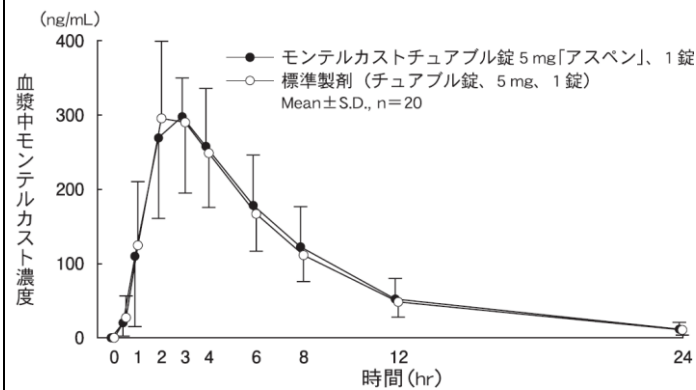
咀嚼後、水なしで服用した場合



9

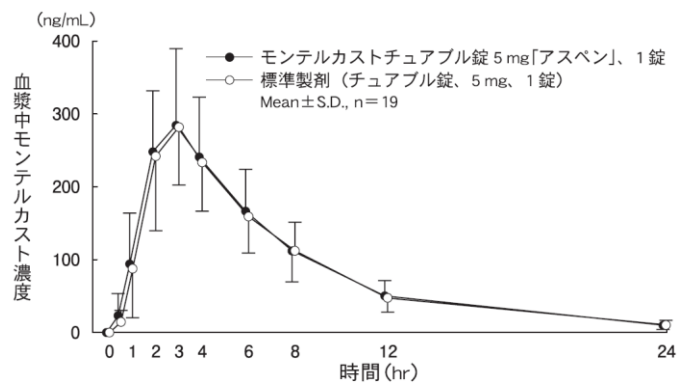
水なしで服用

<口中溶解>



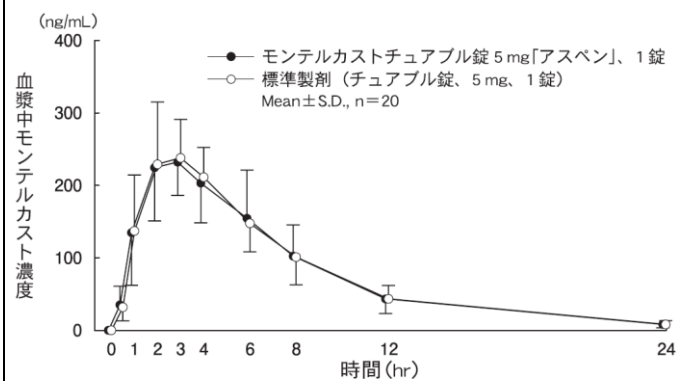
水なしで服用

<咀嚼>



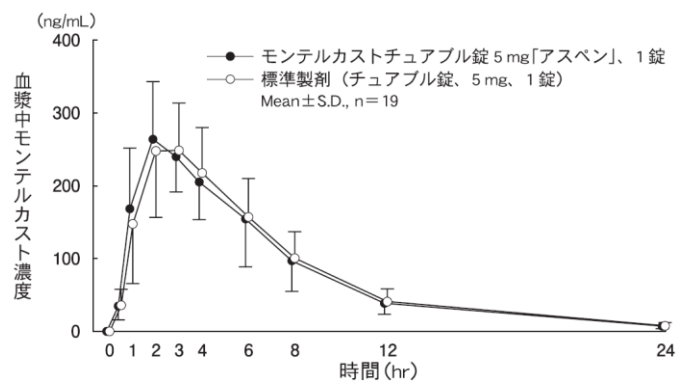
水で服用

<口中溶解>

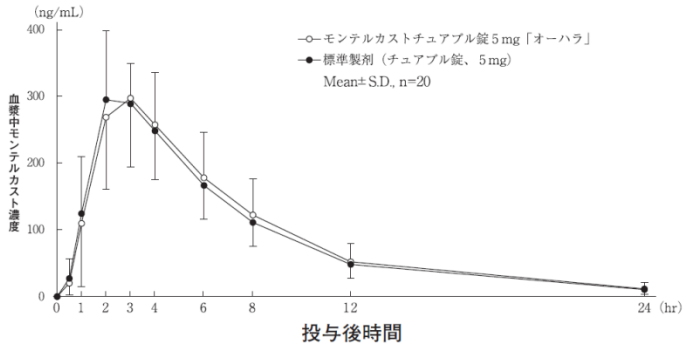


水で服用

<咀嚼>

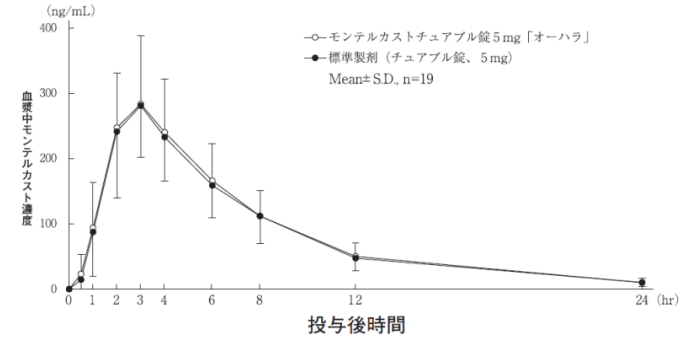


口中溶解（水なし）



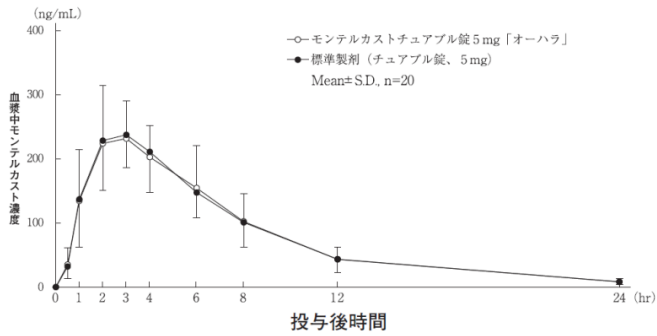
血漿中モンテルカスト濃度の推移

咀嚼（水なし）



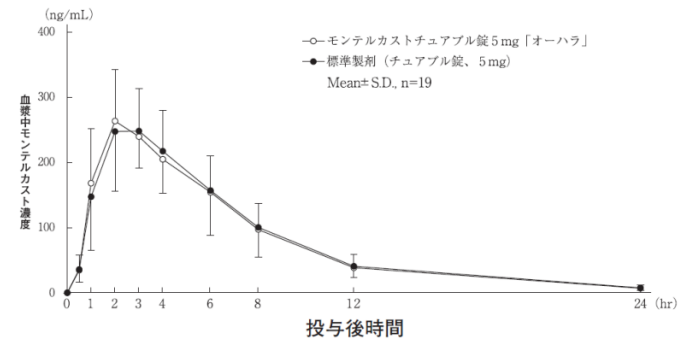
血漿中モンテルカスト濃度の推移

口中溶解（水あり）



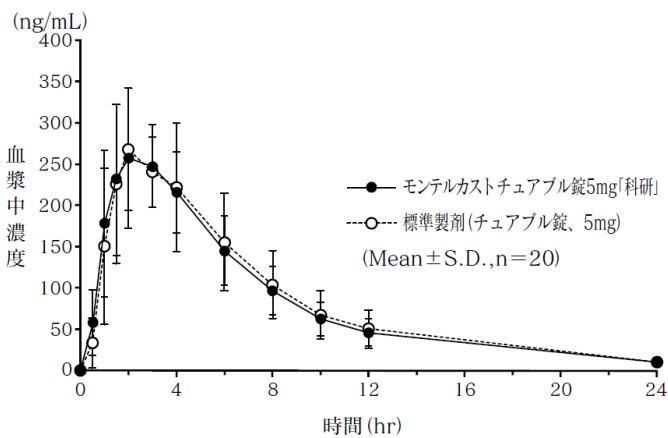
血漿中モンテルカスト濃度の推移

咀嚼（水あり）

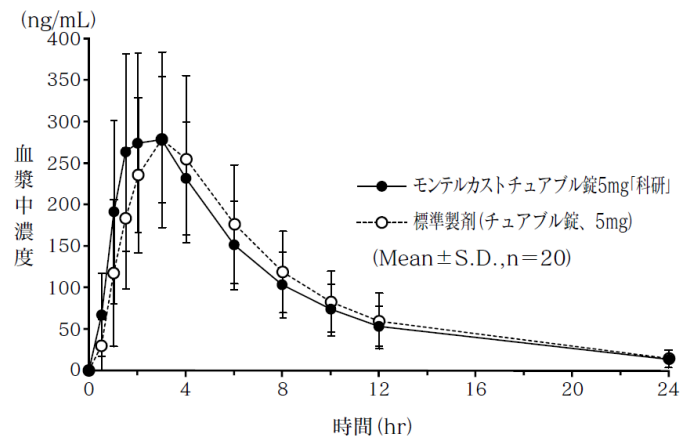


血漿中モンテルカスト濃度の推移

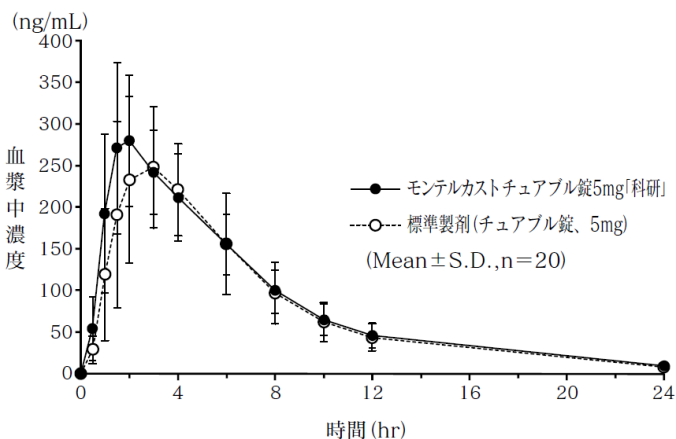
水あり、口中で溶かす



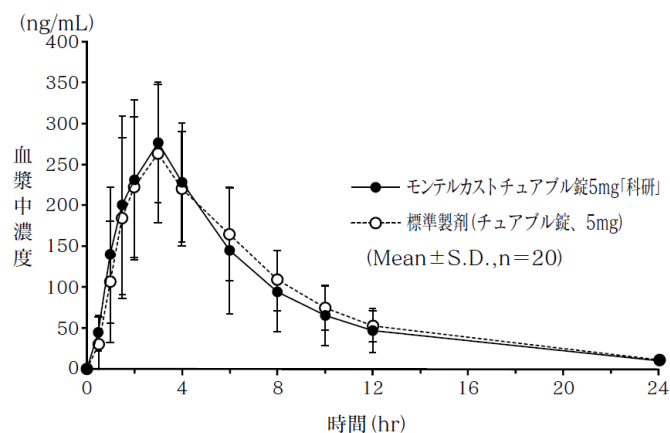
水なし、口中で溶かす



水あり、噛み砕き

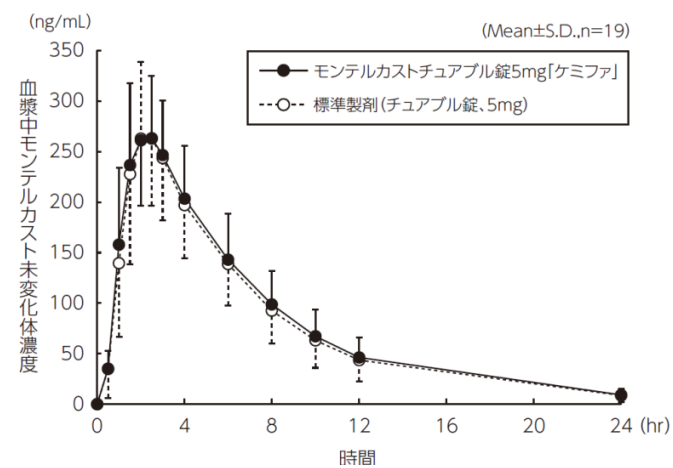


水なし、噛み砕き

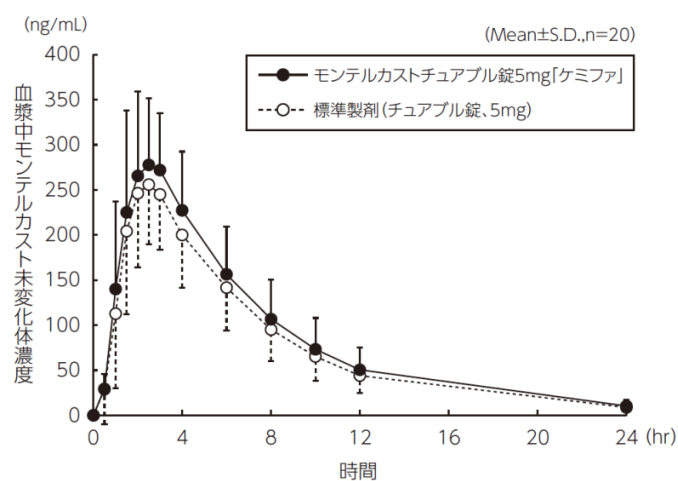


12

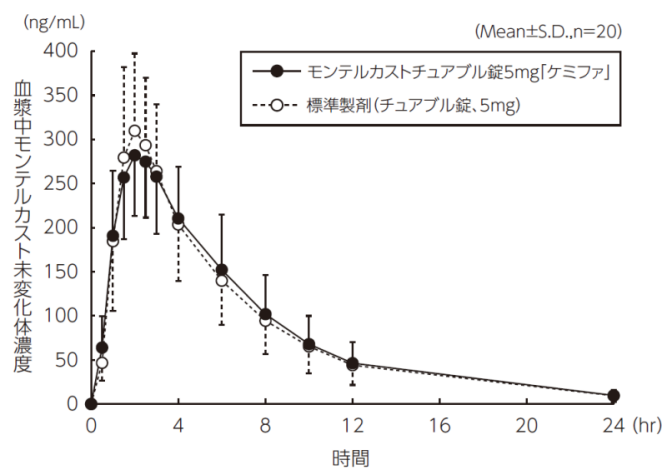
口中で溶かして水で服用



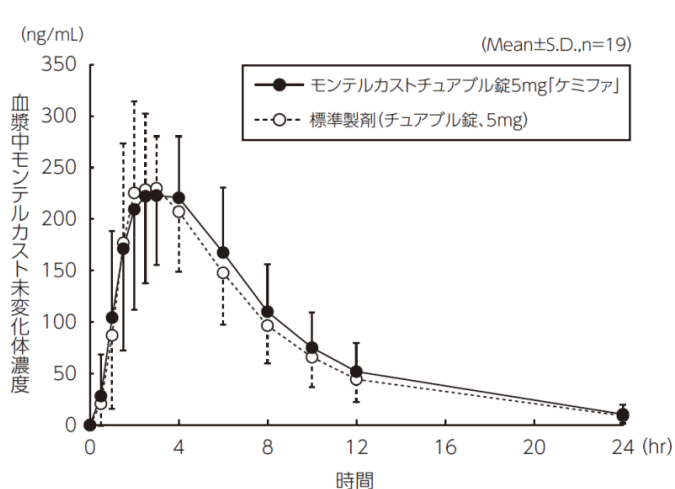
口中で溶かして唾液で服用（水なし）



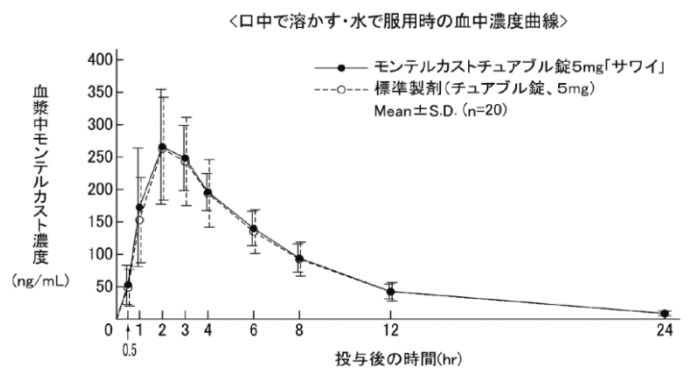
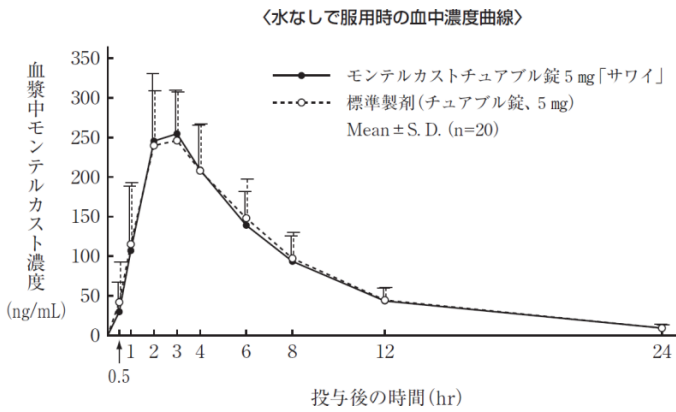
口中で噛み砕いて水で服用



口中で噛み砕いて唾液で服用（水なし）

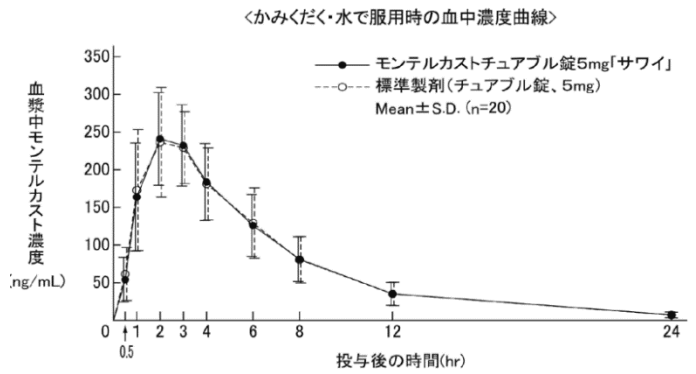
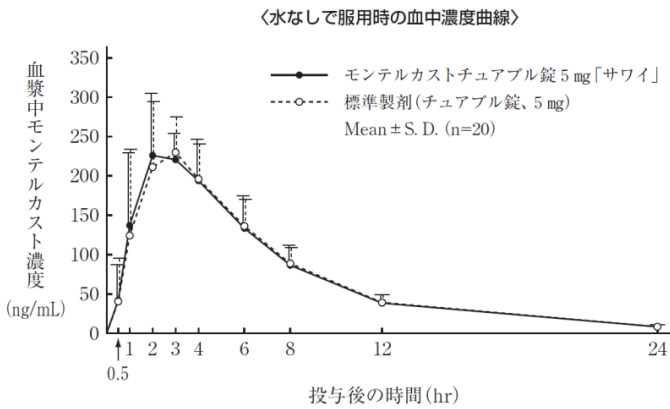


口中で溶かして服用



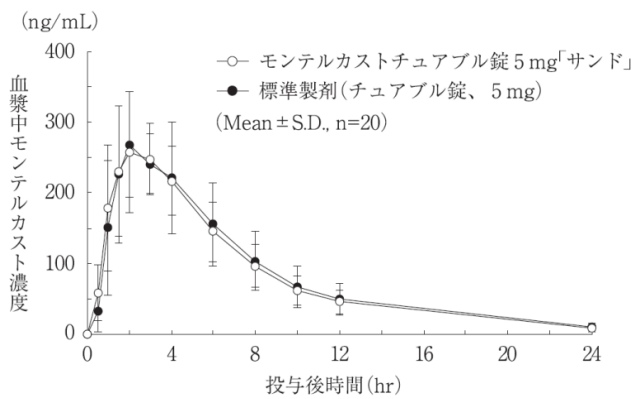
(インタビューフォームより)

かみくだいて服用

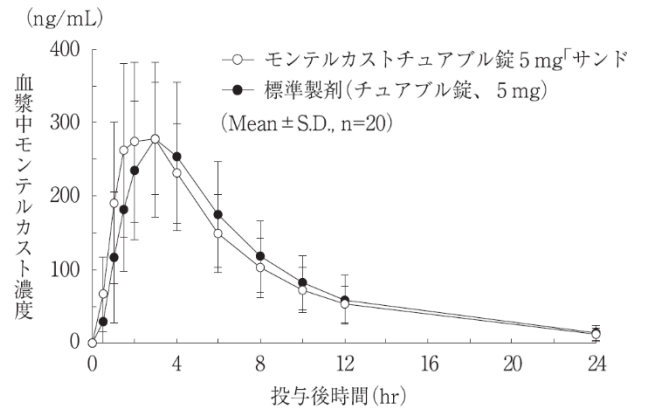


(インタビューフォームより)

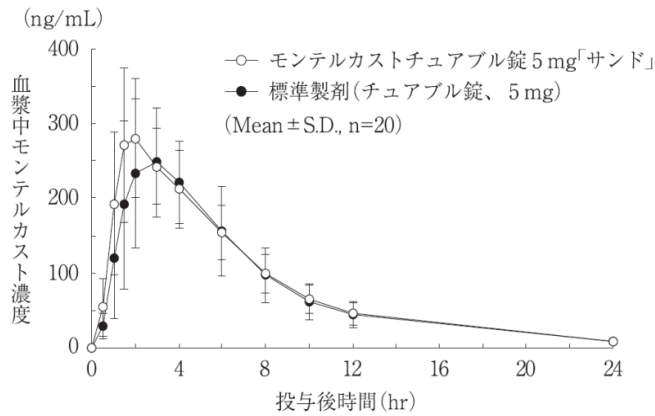
モンテルカストチュアブル錠 5 mg「サンド」投与後の血漿中濃度推移 (水あり、口中で溶かして服用)



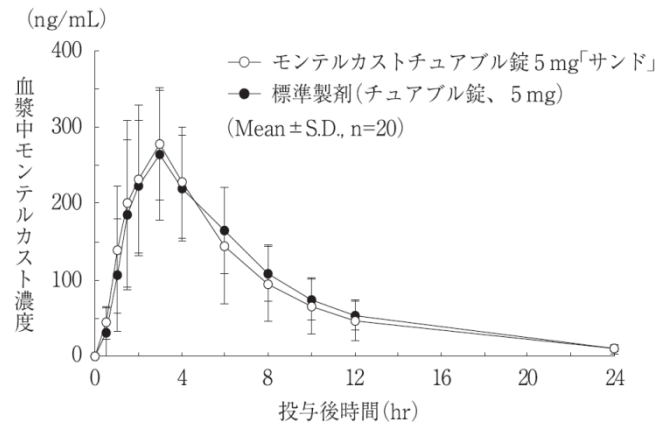
モンテルカストチュアブル錠 5 mg「サンド」投与後の血漿中濃度推移 (水なし、口中で溶かして服用)



モンテルカストチュアブル錠 5mg「サンド」投与後の血漿中濃度推移
(水あり、噛み砕いて服用)



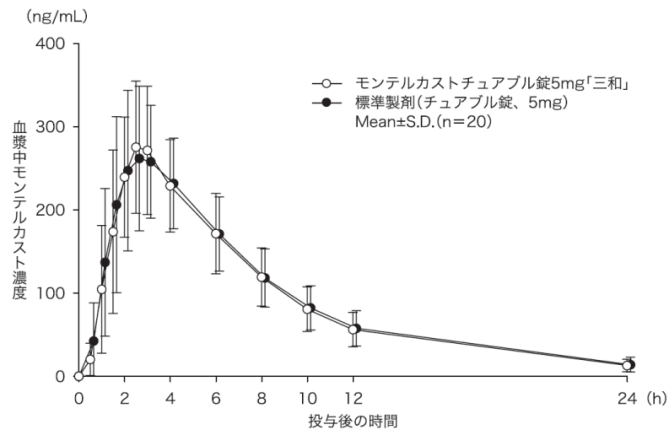
モンテルカストチュアブル錠 5mg「サンド」投与後の血漿中濃度推移
(水なし、噛み砕いて服用)



15

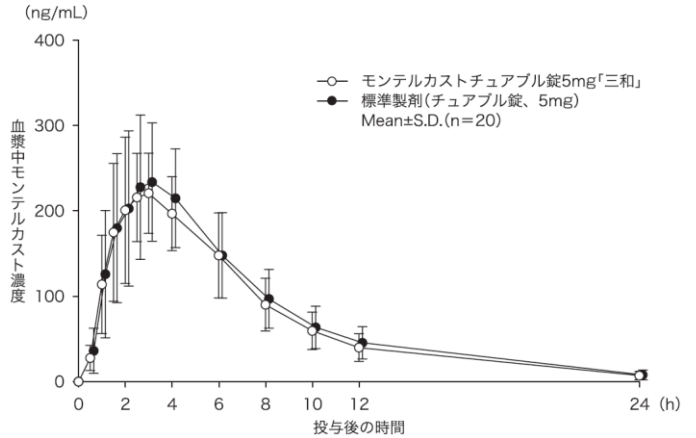
口腔内で噛み砕いた場合

—水なし投与試験—



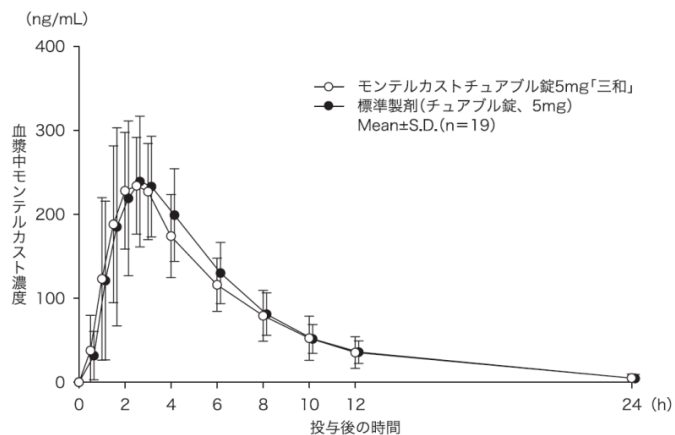
口腔内で噛み砕いた場合

—水あり投与試験—



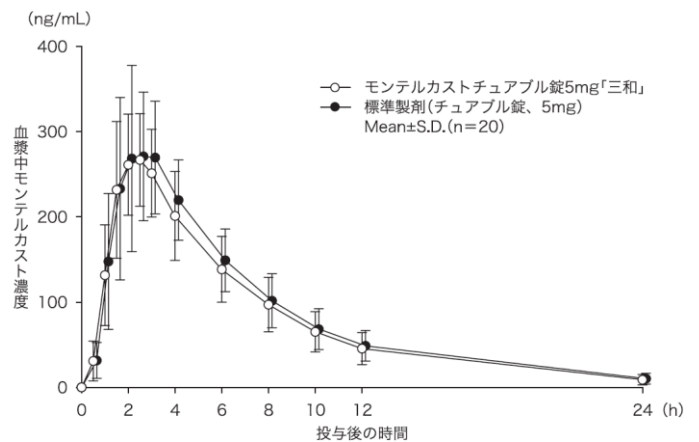
口腔内で溶かした場合

—水なし投与試験—

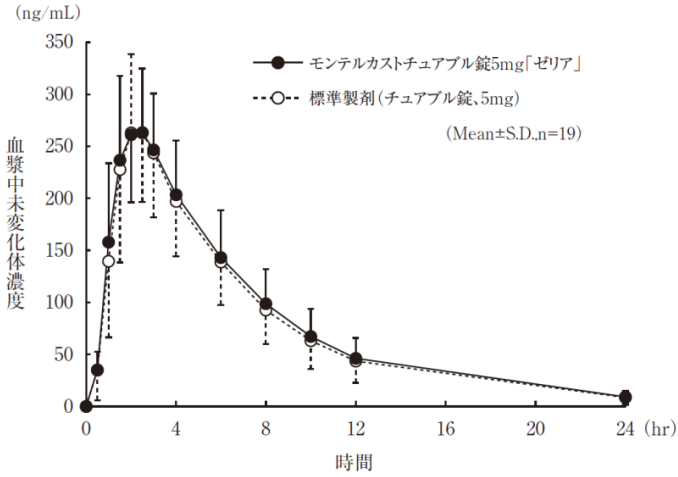


口腔内で溶かした場合

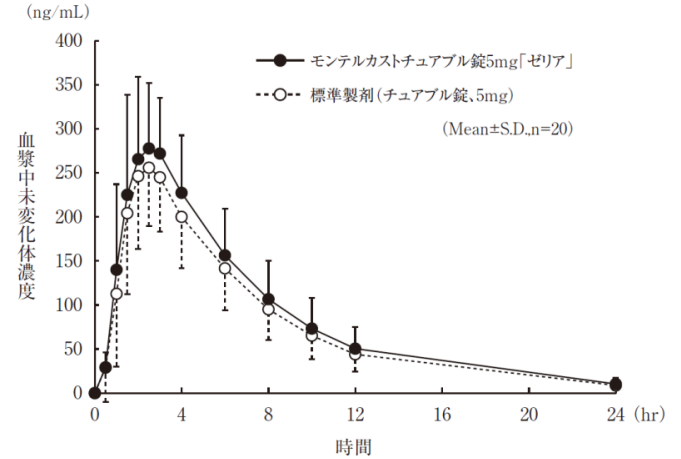
—水あり投与試験—



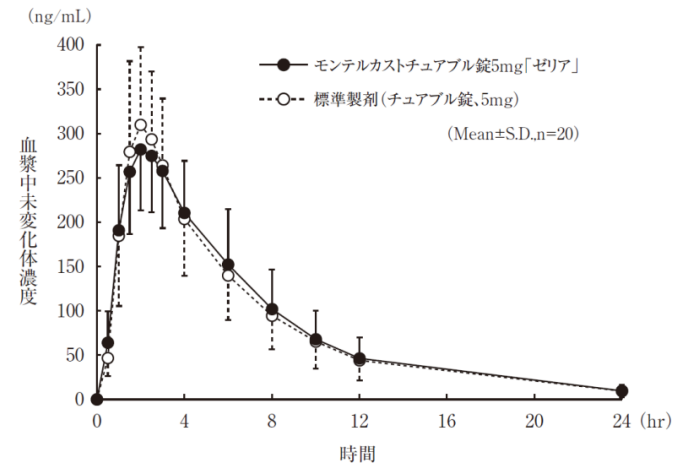
口中で溶かして水で服用



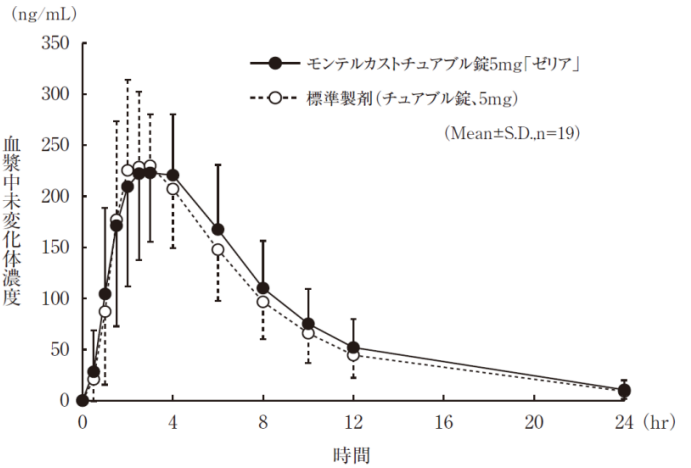
口中で溶かして唾液で服用 (水なし)



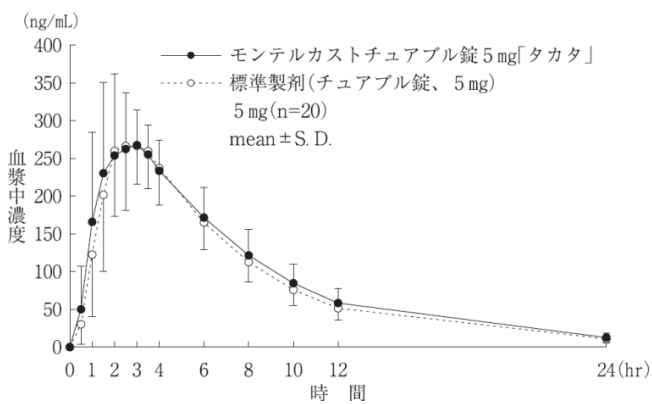
口中でかみくだいて水で服用



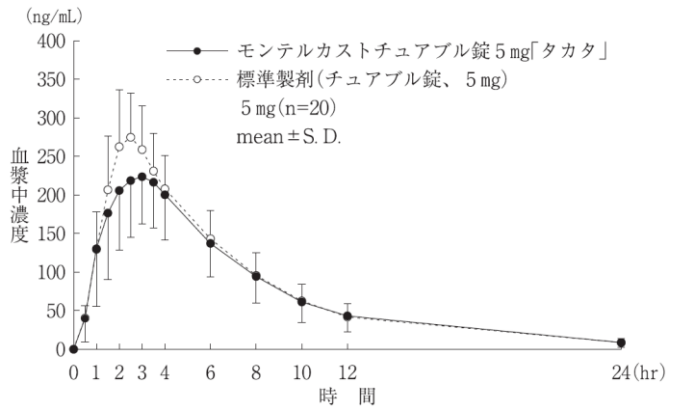
口中でかみくだいて唾液で服用 (水なし)



噛み砕いて水なしで服用

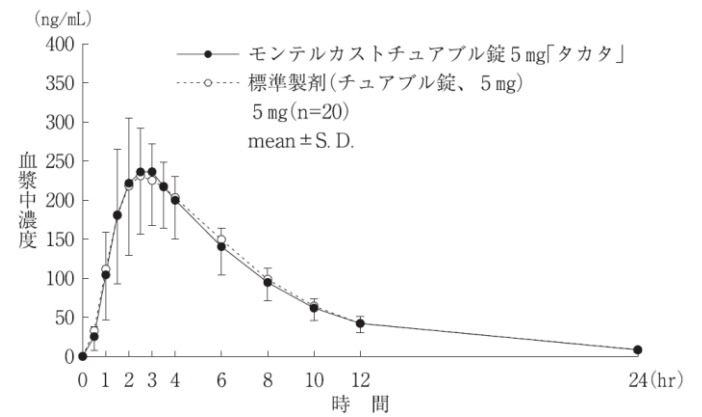
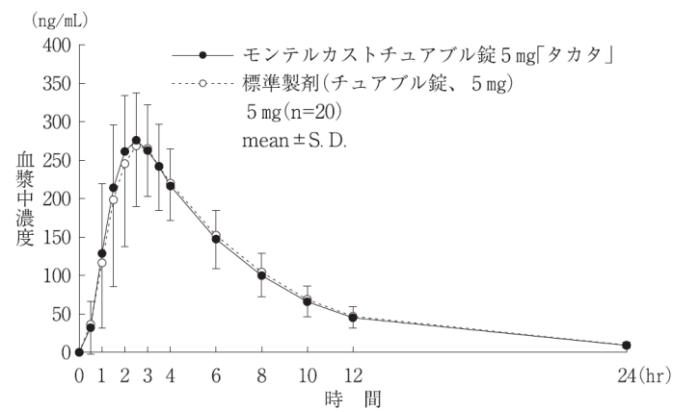


噛み砕いて水で服用



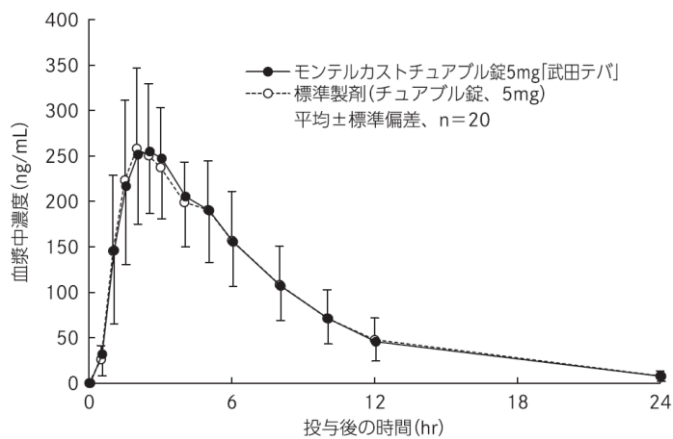
溶かして水なしで服用

溶かして水で服用

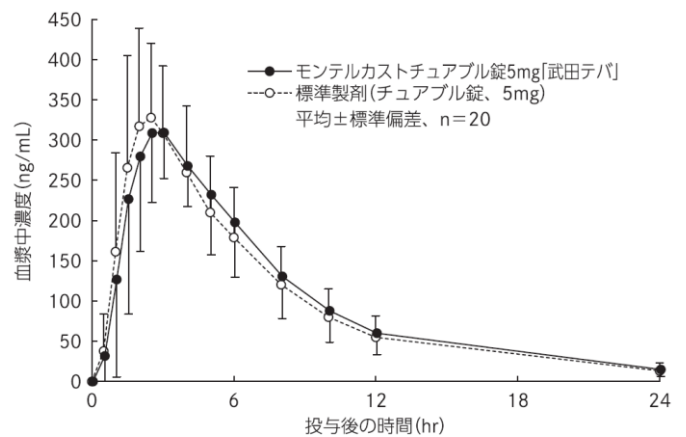


18

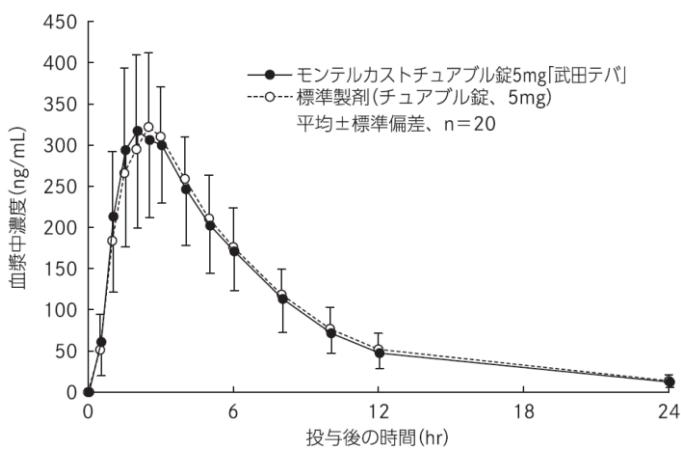
咀嚼・水で服用時



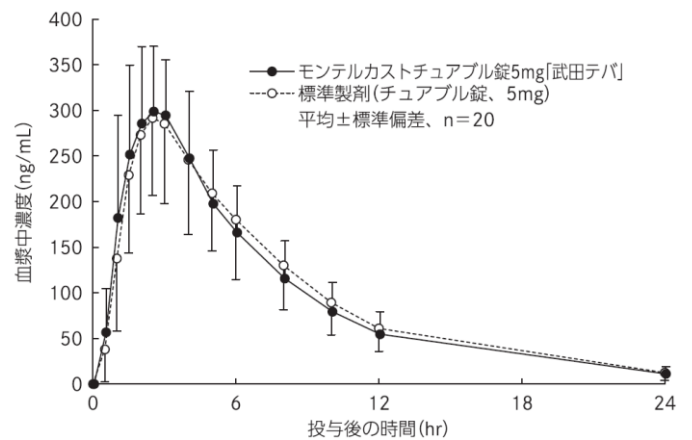
咀嚼・水なしで服用時



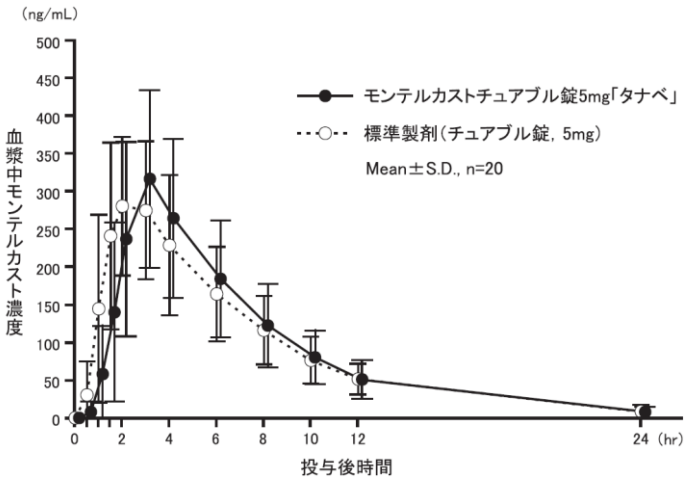
口中溶解・水で服用時



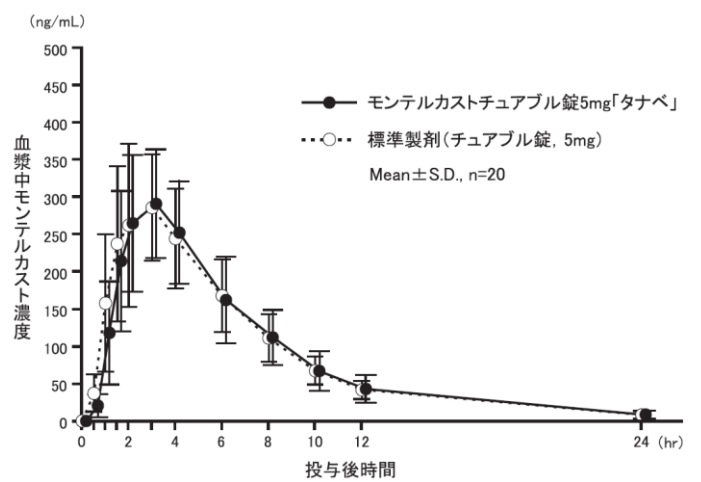
口中溶解・水なしで服用時



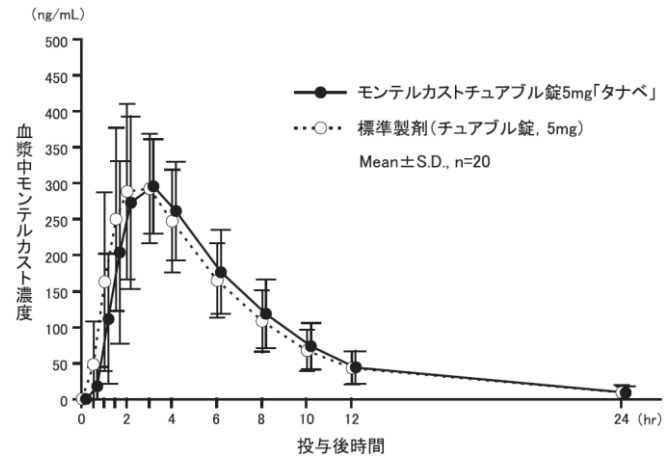
口中溶解による服用 水なしで服用



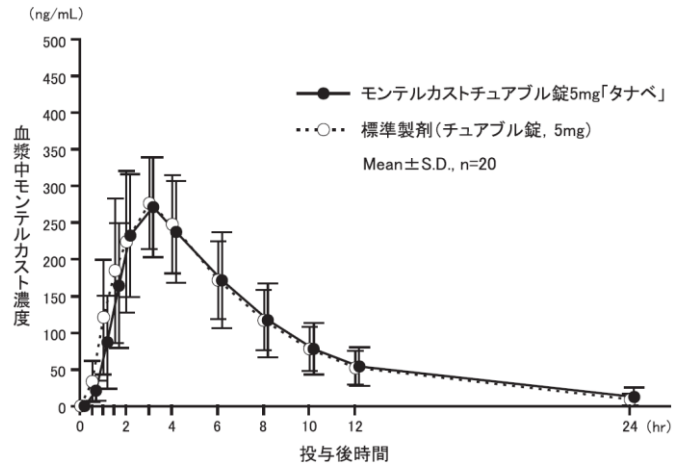
口中溶解による服用 水で服用



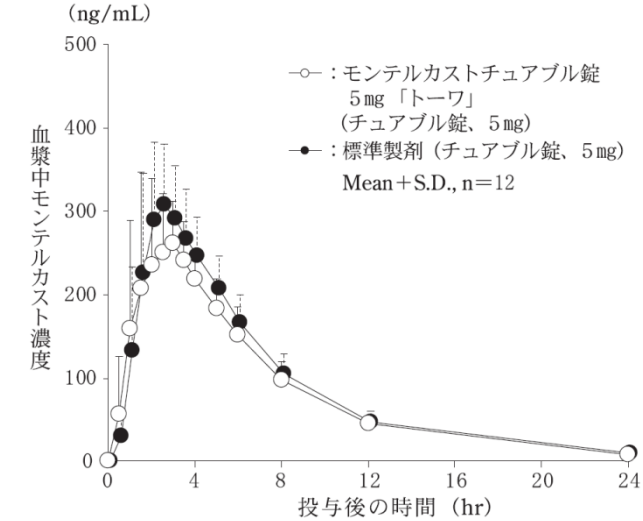
咀嚼による服用 水なしで服用



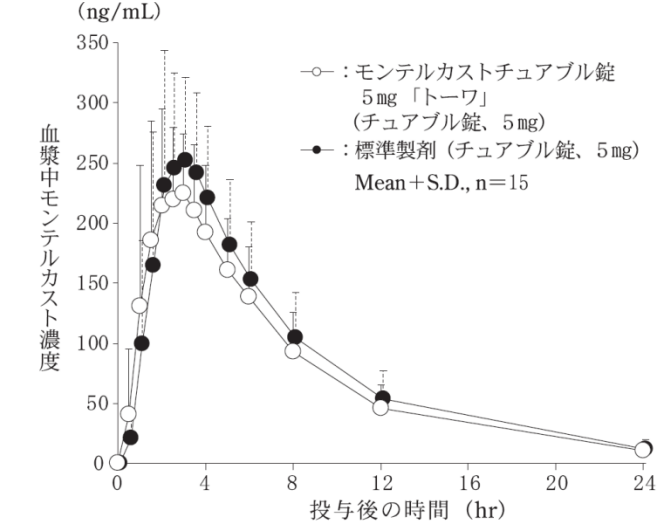
咀嚼による服用 水で服用



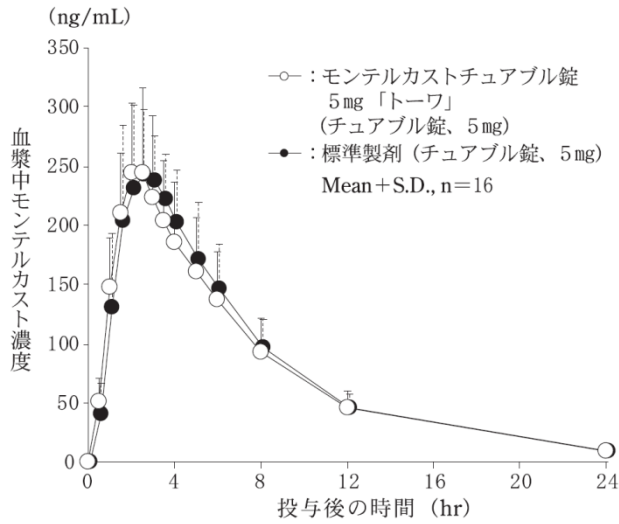
口中で溶かして水なしで服用



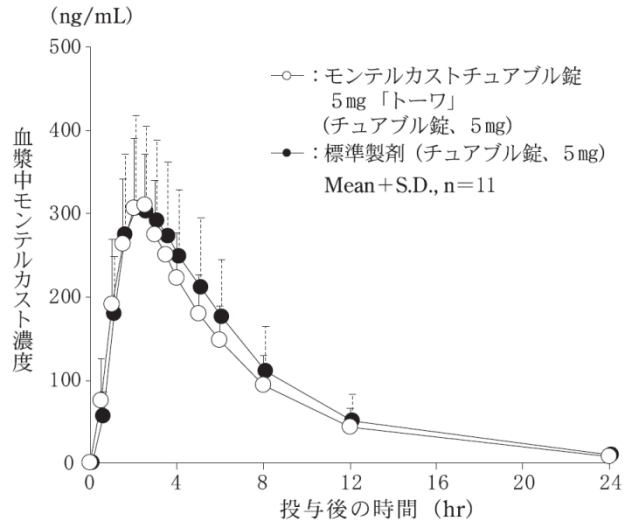
かみくだいて水なしで服用



口中で溶かして水で服用

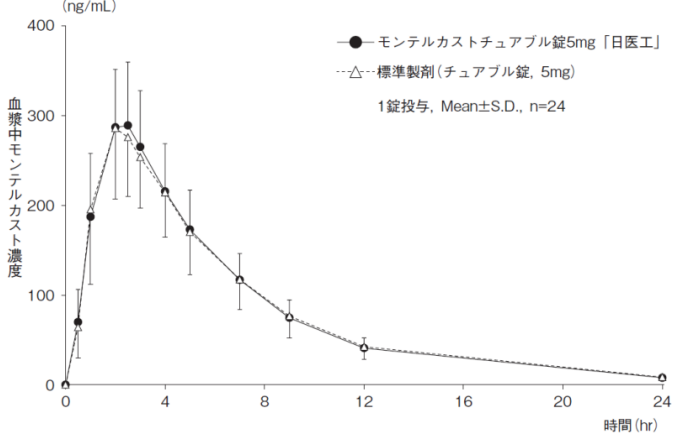


かみくだいて水で服用

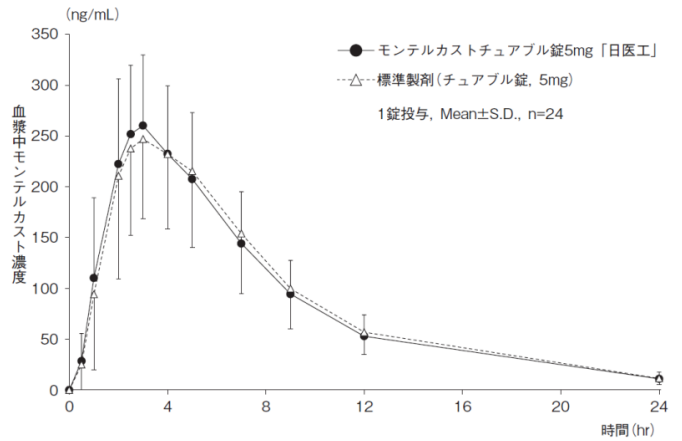


21

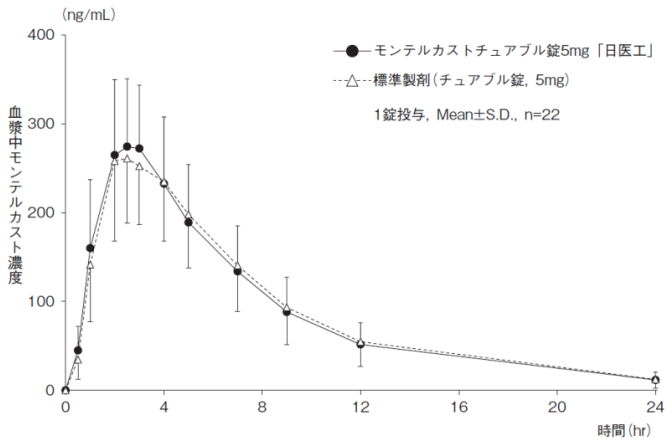
咀嚼・水あり投与



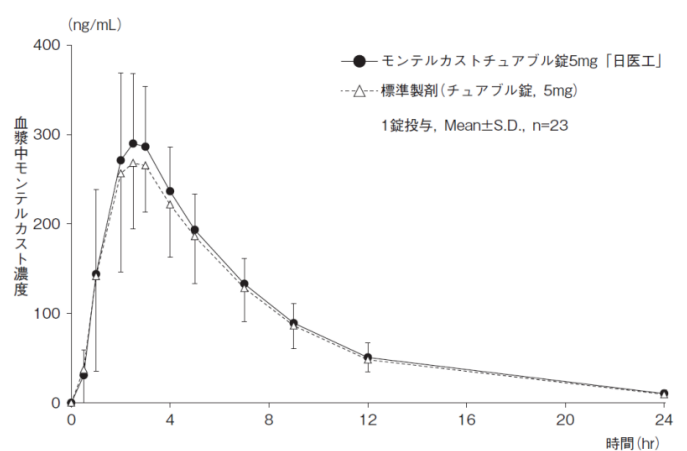
咀嚼・水なし投与



口腔内溶解・水あり投与



口腔内溶解・水なし投与

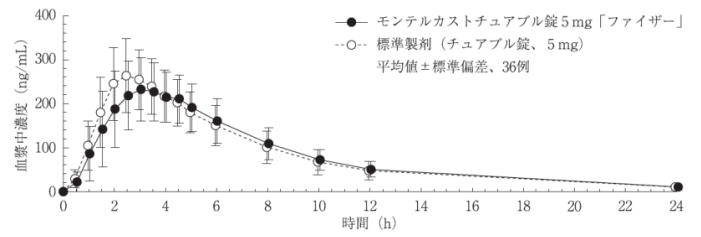
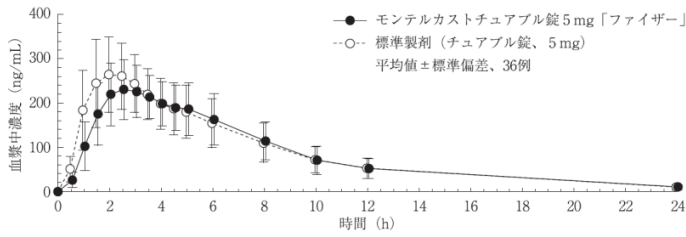


口中で溶かして水で服用

口中で溶かして水なしで服用

血漿中モンテルカストの濃度推移

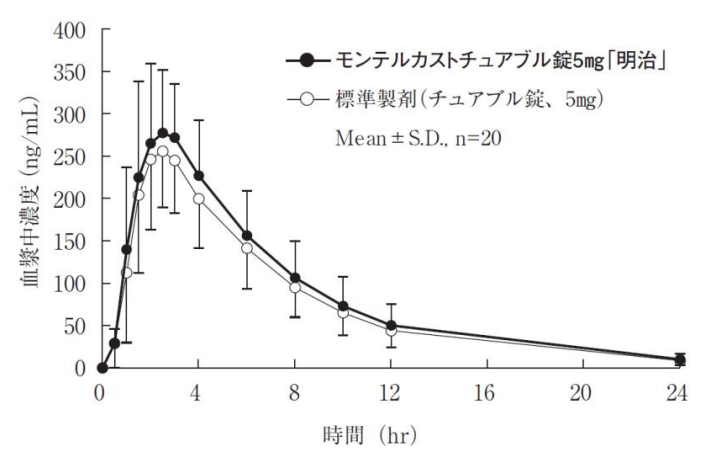
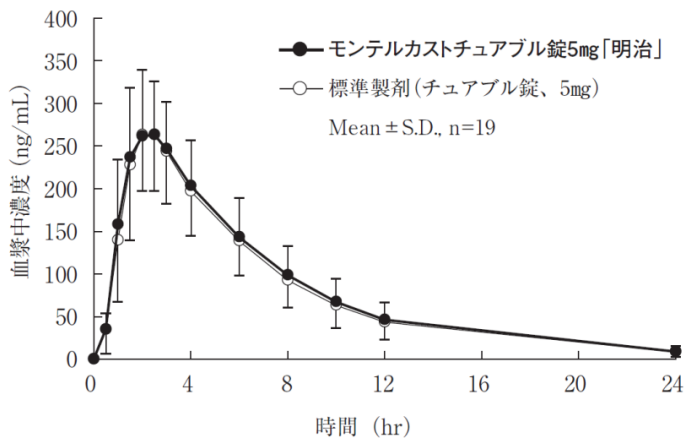
血漿中モンテルカストの濃度推移



24

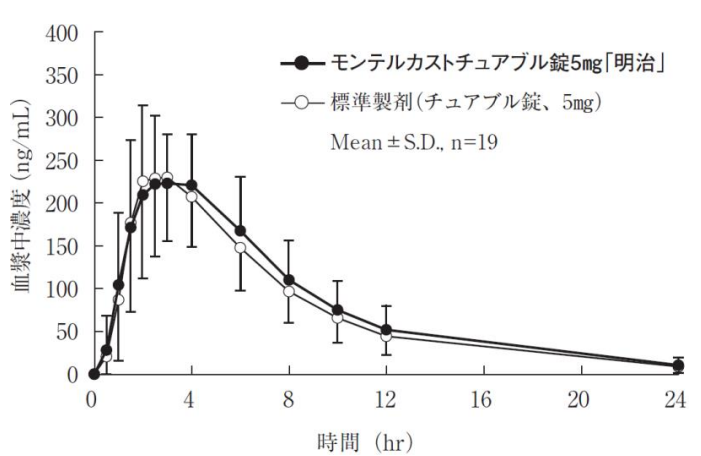
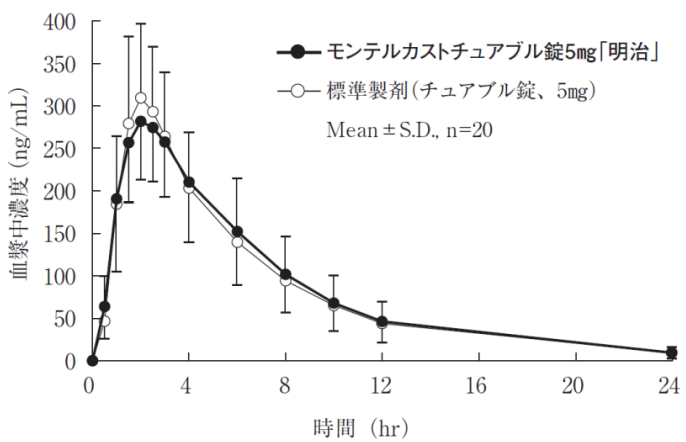
口中で溶かして水とともに服用

口中で溶かして唾液とともに服用 (水なし)



口中で噛み砕いて水とともに服用

口中で噛み砕いて唾液とともに服用 (水なし)



【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】

なし

【溶出試験結果（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】

なし

【後発医薬品品質確保対策事業検査結果】

なし

モンテルカストナトリウムチュアブル錠

Montelukast Sodium Chewable Tablets

溶出性 〈6.10〉 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。

本操作は遮光した容器を用いて行う。本品1個をとり、試験を開始し、規定された時間に溶出液15mL以上をとり、遠心分離する。上澄液1mLを正確に量り、1mL中にモンテルカスト($C_{35}H_{36}ClNO_3S$)約5.6 μ gを含む液となるように試験液を加えて正確に V' mLとし、試料溶液とする。別にモンテルカストジシクロヘキシルアミン標準品約35mgを精密に量り、メタノールに溶かし、正確に100mLとする。この液2mLを正確に量り、試験液を加えて正確に100mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液50 μ Lずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフィー〈2.01〉により試験を行い、それぞれの液のモンテルカストのピーク面積 A_1 及び A_5 を測定する。

モンテルカスト($C_{35}H_{36}ClNO_3S$)の表示量に対する溶出率(%)

$$= M_5 \times A_1 / A_5 \times V' / V \times 1 / C \times 18 \times 0.764$$

M_5 : モンテルカストジシクロヘキシルアミン標準品の秤取量(mg)

C : 1錠中のモンテルカスト($C_{35}H_{36}ClNO_3S$)の表示量(mg)

試験条件

製剤均一性の試験条件を準用する。

検出器 : 紫外吸光光度計(測定波長 : 389nm)

カラム : 内径3.0mm、長さ10cmのステンレス管に5 μ mの液体クロマトグラフィー用フェニル化シリカゲルを充填する。

カラム温度 : 50 $^{\circ}$ C付近の一定温度

移動相 : トリフルオロ酢酸の水/液体クロマトグラフィー用アセトニトリル混液(1 : 1)溶液(1→500)

流量 : モンテルカストの保持時間が約2分になるように調整する。

システム適合性

システムの性能 : 標準溶液50 μ Lにつき、上記の条件で操作するとき、モンテルカストのピークの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ2000段以上、1.5以下である。

システムの再現性 : 標準溶液50 μ Lにつき、上記の条件で試験を5回繰り返すとき、モンテルカストのピーク面積の相対標準偏差は2.0%以下である。

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) キプレス錠 5mg/10mg/チュアブル錠 5mg/OD錠 10mg/細粒 4mg（製造販売元：杏林製薬株式会社）医薬品インタビューフォーム（2018年2月改訂、第41版）
- 2) シングレア錠 5mg/10mg/チュアブル錠 5mg/OD錠 10mg/細粒 4mg（製造販売元：MSD株式会社）医薬品インタビューフォーム（2018年2月改訂、第38版）
- 3) 第十七改正日本薬局方（平成28年3月7日厚生労働省告示第64号）