

## 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>高尿酸血症治療剤 日本薬局方 アロプリノール錠</p> <p><b>アロプリノール錠50mg「杏林」</b> <b>アロプリノール錠100mg「杏林」</b> ALLOPURINOL Tablets “KYORIN”</p>
---

剤形	素錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品 <sup>注)</sup> 注) 注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	アロプリノール錠 50mg「杏林」： 1錠中、日局アロプリノール 50mg 含有 アロプリノール錠 100mg「杏林」： 1錠中、日局アロプリノール 100mg 含有
一般名	和名：アロプリノール(JAN) 洋名：Allopurinol(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	アロプリノール錠 50mg「杏林」 製造販売承認年月日：2010年 7月15日 薬価基準収載年月日：2010年11月19日 発売年月日：2010年11月19日 アロプリノール錠 100mg「杏林」： 製造販売承認年月日：2012年 2月27日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2012年12月14日（販売名変更による） 発売年月日：1978年 4月
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：8時～22時（日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://med.kyorin-rmd.com/">https://med.kyorin-rmd.com/</a>

本 IF は 2020 年 2 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

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

# I F 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、I F と略す）の位置付け並びに I F 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 I F 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新たな I F 記載要領 2008 が策定された。

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

最新版の e-I F 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-I F 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-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F 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、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

## 2. I F とは

I F 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 I F 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 I F 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。

### 【I F の様式】

- ①規格は A 4 判、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。
- ② I F 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「I F 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。

### 【 I F の作成】

- ① I F 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。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F 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、「 I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F 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（ P D F ）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

### 【 I F の発行】

- ① 「 I F 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、「 I F 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 I F が改訂される。

## 3. I F の利用にあたって

「 I F 記載要領 2013」においては、 P D F 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 I F 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、 I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の M R 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、 I F 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、 I F 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、 I F 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

I F 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。 I F 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、 I F 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	VII. 薬物動態に関する項目	14
1. 開発の経緯	1	1. 血中濃度の推移・測定法	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 薬物速度論的パラメータ	16
II. 名称に関する項目	2	3. 吸収	16
1. 販売名	2	4. 分布	16
2. 一般名	2	5. 代謝	16
3. 構造式又は示性式	2	6. 排泄	17
4. 分子式及び分子量	2	7. トランスポーターに関する情報	17
5. 化学名(命名法)	2	8. 透析等による除去率	17
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	18
7. CAS登録番号	2	1. 警告内容とその理由	18
III. 有効成分に関する項目	3	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	18
1. 物理化学的性質	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	18
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	18
3. 有効成分の確認試験法	3	5. 慎重投与内容とその理由	18
4. 有効成分の定量法	3	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	18
IV. 製剤に関する項目	4	7. 相互作用	19
1. 剤形	4	8. 副作用	21
2. 製剤の組成	4	9. 高齢者への投与	23
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	23
4. 製剤の各種条件下における安定性	5	11. 小児等への投与	23
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	23
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	13. 過量投与	23
7. 溶出性	7	14. 適用上の注意	24
8. 生物学的試験法	11	15. その他の注意	24
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	11	16. その他	24
10. 製剤中の有効成分の定量法	11	IX. 非臨床試験に関する項目	25
11. 力価	11	1. 薬理試験	25
12. 混入する可能性のある夾雑物	11	2. 毒性試験	25
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	11	X. 管理的事項に関する項目	26
14. その他	11	1. 規制区分	26
V. 治療に関する項目	12	2. 有効期間又は使用期限	26
1. 効能又は効果	12	3. 貯法・保存条件	26
2. 用法及び用量	12	4. 薬剤取扱い上の注意点	26
3. 臨床成績	12	5. 承認条件等	26
VI. 薬効薬理に関する項目	13	6. 包装	27
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	13	7. 容器の材質	27
2. 薬理作用	13	8. 同一成分・同効薬	27
		9. 国際誕生年月日	27
		10. 製造販売承認年月日及び承認番号	27
		11. 薬価基準収載年月日	28

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	28
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	28
14. 再審査期間	28
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	28
16. 各種コード	28
17. 保険給付上の注意	28
<b>XI. 文献</b>	<b>29</b>
1. 引用文献	29
2. その他の参考文献	29
<b>XII. 参考資料</b>	<b>30</b>
1. 主な外国での発売状況	30
2. 海外における臨床支援情報	30
<b>XIII. 備考</b>	<b>31</b>
1. その他の関連資料	31

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

50mg錠は、後発医薬品として薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、2010 年 7 月に承認を取得、2010 年 11 月に「アロプリノール錠 50mg「杏林）」として発売に至った。

100mg錠は、1976 年 8 月に承認を取得し、1978 年 4 月に「アロプリノール錠」として発売に至った。その後、医療事故防止のため、2006 年 6 月に「アロプリノール錠 100mg」に名称変更した。更に、2012 年 12 月に「アロプリノール錠 100mg「杏林）」に名称変更した。

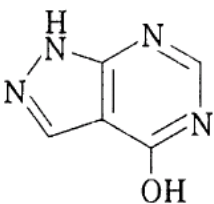
## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1)尿酸は、ヒポキサンチンやキサンチンからキサンチンオキシダーゼの働きで生成するが、アロプリノールはこの酵素を競合的に阻害することによって尿酸の産生を抑制する。アロプリノール自体もキサンチンオキシダーゼの作用でアロキサンチンに代謝されるが、アロキサンチンにも非競合的キサンチンオキシダーゼ阻害作用がある。<sup>1)</sup>

2)重大な副作用として、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)、剝脱性皮膚炎等の重篤な皮膚障害又は過敏性血管炎、薬剤性過敏症症候群、ショック、アナフィラキシー、再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少、劇症肝炎等の重篤な肝機能障害、黄疸、腎不全、腎不全の増悪、間質性腎炎を含む腎障害、間質性肺炎、横紋筋融解症、無菌性髄膜炎が報告されている。

(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。)

## II. 名称に関する項目

1. 販売名	
(1) 和名	アロプリノール錠 50mg「杏林」 アロプリノール錠 100mg「杏林」
(2) 洋名	ALLOPURINOL Tablets 50mg “KYORIN” ALLOPURINOL Tablets 100mg “KYORIN”
(3) 名称の由来	成分の一般名に由来する。
2. 一般名	
(1) 和名（命名法）	アロプリノール(JAN)
(2) 洋名（命名法）	Allopurinol(JAN、INN)
(3) ステム	不明
3. 構造式又は示性式	
4. 分子式及び分子量	分子式：C <sub>5</sub> H <sub>4</sub> N <sub>4</sub> O 分子量：136.11
5. 化学名（命名法）	1- <i>H</i> -Pyrazolo[3,4- <i>d</i> ]pyrimidin-4-ol (IUPAC)
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	特になし
7. CAS 登録番号	315-30-0

### 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～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。
(2) 溶解性	<i>N,N</i> -ジメチルホルムアミドに溶けにくく、水又はエタノール(99.5)に極めて溶けにくい。 アンモニア試液に溶ける。
(3) 吸湿性	該当資料なし
(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	日本薬局方「アロプリノール」の確認試験による。 (1) 紫外可視吸光度測定法 (2) 赤外吸収スペクトル測定法
4. 有効成分の定量法	日本薬局方「アロプリノール」の定量法による。 電位差滴定法(0.1mol/Lテトラメチルアンモニウムヒドロキシド液で滴定)



## 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	アロプリノール錠 50mg「杏林」	アロプリノール錠 100mg「杏林」
剤形	素錠	素錠
色調	白色～微黄白色	白色
外観		
直径 (mm)	6.5	9.6
厚さ (mm)	2.2	3.9
重量 (mg)	100	300

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

アロプリノール錠 50mg「杏林」 : KRM126

アロプリノール錠 100mg「杏林」 : PH113

#### (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

アロプリノール錠 50mg「杏林」 : 1 錠中、日局アロプリノール 50mg 含有

アロプリノール錠 100mg「杏林」 : 1 錠中、日局アロプリノール 100mg 含有

#### (2) 添加物

アロプリノール錠 50mg「杏林」 :

乳糖水和物、トウモロコシデンプン、セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム

アロプリノール錠 100mg「杏林」 :

乳糖水和物、トウモロコシデンプン、セルロース、カルメロースカルシウム、ゼラチン、タルク、ステアリン酸カルシウム

#### (3) その他

特になし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## IV. 製剤に関する項目

### 4. 製剤の各種条件下における安定性<sup>2)~4)</sup>

#### 【加速試験】

〔アロプリノール錠 50mg「杏林」〕<sup>2)</sup>

<保存条件>

40±1℃、75±5%RH

<試験検体>

PTP 包装品：PTP 包装(ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミニウム箔)、  
ポリプロピレン袋に充てん、紙箱

<試験項目及び規格>

試験項目	規 格
性状	白色～微黄白色の素錠である。
溶出性	日本薬局方医薬品各条アロプリノール錠の溶出規格に適合する。
定量(含量)	93.0～107.0%

<試験結果>

試験項目	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後
性状	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量(含量)	100.8%	101.8%	101.4%	101.1%

(1ロット n=3 の 3 ロットの平均値)

#### 【長期保存試験】

〔アロプリノール錠 100mg「杏林」〕<sup>2)</sup>

<保存条件>

室温保存 (なりゆき室温)

<試験検体>

PTP 包装品：PTP 包装(ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミニウム箔)、  
ポリエチレン・ポリ塩化ビニリデン・ポリプロピレンラミ  
ネートフィルムでピロー包装、紙箱

<試験項目及び規格>

試験項目	規 格
性状	白色円板状錠剤である。
溶出性	日本薬局方医薬品各条アロプリノール 100mg 錠の溶出規格に適合する。
定量(含量)	90.0～110.0%

## IV. 製剤に関する項目

### < 試験結果 >

試験項目	開始時	1年後	2年後	3年後	4年後	5年後
性状	適	適	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適	適	適
定量(含量)	100.0%	99.6%	99.3%	100.5%	101.1%	102.0%

(1ロット n=3 の3ロットの平均値)

### 【無包装状態での安定性】

#### 〔アロプリノール錠 50mg「杏林」〕<sup>3)</sup>

保存条件	結 果			
	性状	溶出性	含量	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、 遮光・気密ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 [75%RH、25℃、3 ヶ月、 遮光・開放]	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) ※
光 [曝光量 60 万 lx・hr、 温度・湿度なりゆき、 気密ガラス瓶(無色)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

[規格] 性状：白色～微黄白色の素錠、溶出性：30 分間 80%以上、含量：93.0～107.0%、  
硬度：参考値

※ 5.5kgf(開始時)→3.7kgf(1 ヶ月)、3.1kgf(2 ヶ月)、3.1kgf(3 ヶ月)

#### 〔アロプリノール錠 100mg「杏林」〕<sup>4)</sup>

保存条件	結 果			
	性状	溶出性	含量	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、 遮光・気密瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 [75%RH、25℃、3 ヶ月、 遮光・開放瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) ※
光 [曝光量 60 万 lx・hr、 25℃、気密瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

[規格] 性状：白色円板状錠剤、溶出性：30 分間 80%以上、含量：90.0～110.0%、  
硬度：参考値

※ 7.0kgf(開始時)→4.2kgf(2 週間)、4.5kgf(1 ヶ月)、4.7kgf(3 ヶ月)

## IV. 製剤に関する項目

<参考>評価基準

分類	性状	溶出性	定量法(含量)	硬度
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	規格値内の場合	含量低下が3%未満の場合	硬度変化が30%未満の場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合		含量低下が3%以上で、規格値内の場合	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kg重以上の場合
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している場合	規格値外の場合	規格値外の場合	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kg重未満の場合

本試験は、「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成11年8月20日」を参考に評価しました。本資料は本剤の安定性に関する資料であり、無包装で保存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施しておりません。

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<sup>5)</sup>

【溶出挙動における類似性】

【アロプリノール錠 50mg「杏林」】

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(薬食審査発第1124004号平成18年11月24日)に従い、標準製剤との溶出挙動の比較を行った。

<試験方法>

試験法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)

試験液：900mL

試験液の温度：37±0.5℃

試験液		回転数
pH1.2	日本薬局方 溶出試験第1液	50回転/分
pH5.0	薄めたMcIlvaineの緩衝液	50回転/分
pH6.8	日本薬局方溶出試験第2液	50回転/分
水	日本薬局方 精製水	50回転/分
pH5.0	薄めたMcIlvaineの緩衝液	100回転/分

## IV. 製剤に関する項目

### <判定基準>

- 標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合：試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。(pH5.0/100rpm)
- 標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合：規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となるときの、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値は 42 以上である。

(pH1.2/50rpm、pH5.0/50rpm、pH6.8/50rpm、水/50rpm)

### <結 果>

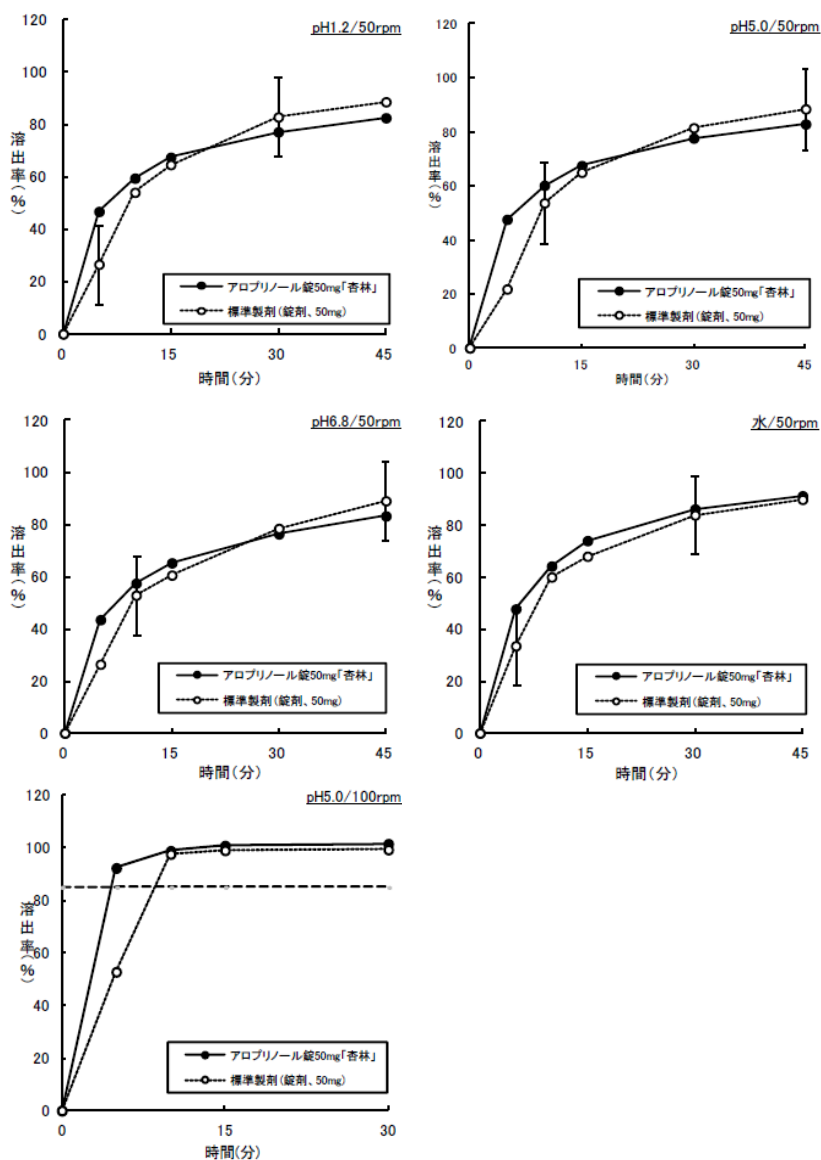
溶出条件	測定点 (分)	12 ベッセルの平均溶出率 (%)		平均溶 出率の 差 (%)	f2 関数 の値
		アロプリノール 錠 50mg「杏林」	標準製剤		
pH1.2/50rpm	5	46.8	26.6	+20.2	62.3
	30	77.2	82.9	-5.7	
pH5.0/50rpm	10	60.2	53.7	+6.5	—
	45	82.9	88.5	-5.6	
pH6.8/50rpm	10	57.5	52.9	+4.6	—
	45	83.3	89.1	-5.8	
水/50rpm	5	47.8	33.6	+14.2	—
	30	86.3	84.0	+2.3	
pH5.0/100rpm	15	100.8	99.0	+1.8	—

pH1.2/50rpm において標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲に入らなかったが f2 関数値が 42 以上となった。

pH5.0/50rpm、pH6.8/50rpm 及び水/50rpm において標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。pH5.0/100rpm において標準製剤、試験製剤ともに 15 分で 85%以上溶出した。

以上の結果より、アロプリノール錠 50mg「杏林」は標準製剤と類似性があると判定された。

## IV. 製剤に関する項目



### 〔アロプリノール錠 100mg「杏林」〕

平成 10 年 7 月 15 日の再評価指定(その 30)により、標準製剤との溶出挙動の比較を行った。

#### <試験方法>

試験法：日本薬局方 一般試験法 溶出試験法第 2 法(パドル法)

試験液：900mL

試験液の温度：37±0.5℃

試験液		回転数
pH1.2	日本薬局方 崩壊試験の第 1 液	50 回転/分
pH4.0	酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液(0.05mol/L)	50 回転/分
pH6.8	日本薬局方試薬・試液のリン酸塩緩衝液(1→2)	50 回転/分
水	日本薬局方 精製水	50 回転/分

## IV. 製剤に関する項目

### <判定基準>

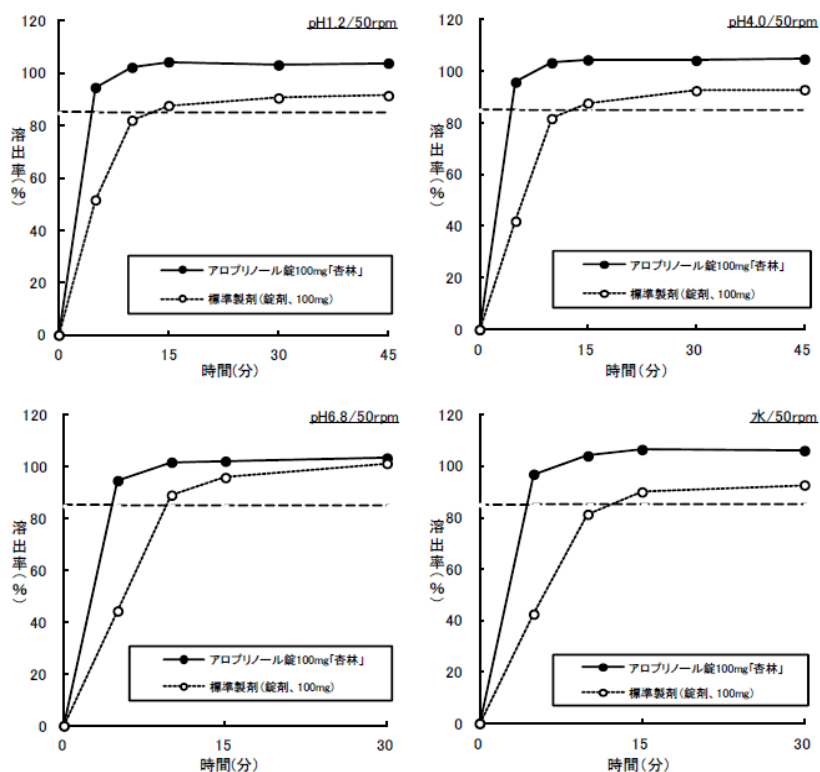
標準製剤の溶出に明確なラグ時間がなく標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合：試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は、15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率± 15%の範囲にある。

### <結果>

溶出条件	測定点 (分)	6 ベッセルの平均溶出率(%)		平均 溶出率 の差(%)
		アロプリノール錠 100mg「杏林」	標準製剤	
pH1.2/50rpm	15	104.3	87.6	+16.7
pH4.0/50rpm	15	104.3	87.6	+16.7
pH6.8/50rpm	15	102.1	95.8	+6.3
水/50rpm	15	106.5	90.0	+16.5

全ての溶出条件において、アロプリノール錠 100mg「杏林」が 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上の結果より、アロプリノール錠 100mg「杏林」は標準製剤と同等であると判定された。



## IV. 製剤に関する項目

	<p><b>【公的溶出規格への適合性】</b></p> <p>アロプリノール錠 50mg「杏林」及びアロプリノール錠 100mg「杏林」は、日本薬局方医薬品各条に定められたアロプリノール錠の溶出規格にそれぞれ適合していることが確認されている。</p> <p>試験条件：水 900mL、パドル法、毎分 50 回転</p> <p>溶出規格：30 分間 80%以上</p> <table border="1" data-bbox="550 548 1348 694"> <thead> <tr> <th colspan="2">30 分間の溶出率 (3 ロットの最小値～最大値)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>アロプリノール錠 50mg「杏林」</td> <td>86.2%～94.5%</td> </tr> <tr> <td>アロプリノール錠 100mg「杏林」</td> <td>97.2%～101.2%</td> </tr> </tbody> </table>	30 分間の溶出率 (3 ロットの最小値～最大値)		アロプリノール錠 50mg「杏林」	86.2%～94.5%	アロプリノール錠 100mg「杏林」	97.2%～101.2%
30 分間の溶出率 (3 ロットの最小値～最大値)							
アロプリノール錠 50mg「杏林」	86.2%～94.5%						
アロプリノール錠 100mg「杏林」	97.2%～101.2%						
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	<p>日本薬局方「アロプリノール錠」の確認試験による。</p> <p>(1) 紫外可視吸光度測定法</p> <p>(2) 薄層クロマトグラフィー</p>						
10. 製剤中の有効成分の定量法	<p>日本薬局方「アロプリノール錠」の定量法による。</p> <p>紫外可視吸光度測定法</p>						
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	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	下記の場合における高尿酸血症の是正 痛風、高尿酸血症を伴う高血圧症
2. 用法及び用量	通常、成人は1日量アロプリノールとして200～300mgを2～3回に分けて 食後に経口投与する。年齢、症状により適宜増減する。
3. 臨床成績	
(1) 臨床データパッケージ	該当資料なし
(2) 臨床効果	該当資料なし
(3) 臨床薬理試験	該当資料なし
(4) 探索的試験	該当資料なし
(5) 検証的試験	
1) 無作為化並行用量 反応試験	該当資料なし
2) 比較試験	該当資料なし
3) 安全性試験	該当資料なし
4) 患者・病態別試験	該当資料なし
(6) 治療的使用	
1) 使用成績調査・特定 使用成績調査(特別 調査)・製造販売後 臨床試験(市販後臨 床試験)	該当資料なし
2) 承認条件として実 施予定の内容又は 実施した試験の概 要	該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	フェブキソスタット、トピロキソスタット
2. 薬理作用	
(1) 作用部位・作用機序 <sup>1)</sup>	尿酸は、ヒポキサンチンやキサンチンからキサンチンオキシダーゼの働きで生成するが、アロプリノールはこの酵素を競合的に阻害することによって尿酸の産生を抑制する。アロプリノール自体もキサンチンオキシダーゼの作用でアロキサンチンに代謝されるが、アロキサンチンにも非競合的キサンチンオキシダーゼ阻害作用がある。
(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

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

(3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>6)</sup>

#### 【生物学的同等性試験】

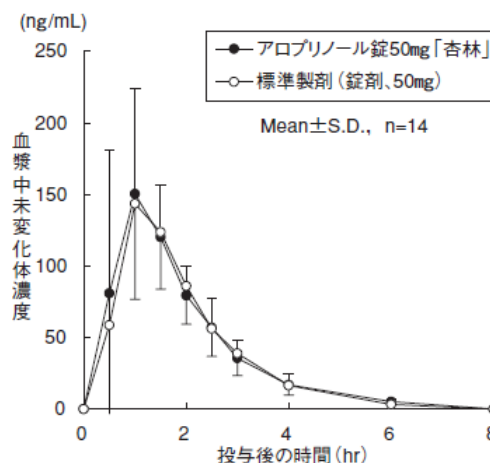
#### 〔アロプリノール錠 50mg「杏林」〕

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(薬食審査発第 1124004 号平成 18 年 11 月 24 日)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

アロプリノール錠 50mg「杏林」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (アロプリノールとして 50mg) 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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-8</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
アロプリノール 錠 50mg「杏林」	306.5 ±71.3	185.1 ±82.3	1.14 ±0.36	1.08 ±0.25
標準製剤 (錠剤、50mg)	294.3 ±91.0	187.0 ±80.6	1.32 ±0.46	0.93 ±0.17

(Mean ± S. D., n=14)



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。

## VII. 薬物動態に関する項目

### [アロプリノール錠 100mg「杏林」]

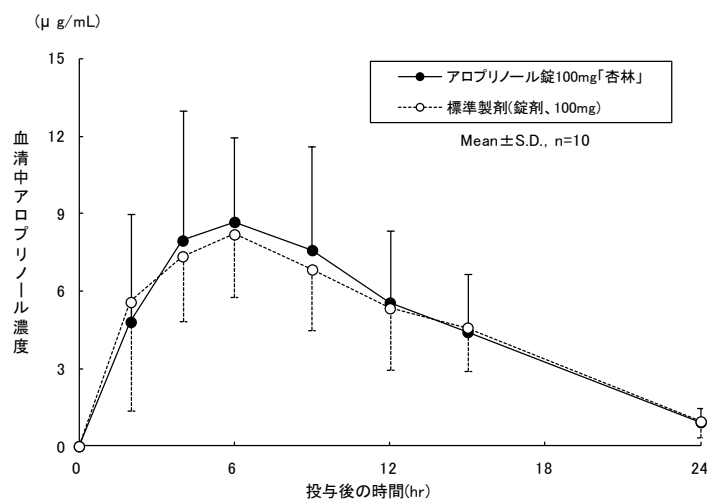
アロプリノール錠 100mg「杏林」は、現行の後発医薬品の生物学的同等性ガイドライン及び生物学的同等性に関する試験基準(薬審第 718 号 昭和 55 年 5 月 30 日)の施行以前の品目であり、ヒトでの生物学的同等性試験は実施していない。

<参考 (ウサギ) ><sup>7)</sup>

アロプリノール錠 100mg「杏林」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ 3 錠 (アロプリノールとして 300mg) 雄性家兔に単回経口投与し、血中アロプリノールについて比較検討した結果、両製剤間の濃度の差には有意な差は認められなかった。

	判定パラメータ	
	AUC <sub>0→24</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	C <sub>max</sub> ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )
アロプリノール錠 100mg「杏林」	117.40 ± 53.25	9.69 ± 4.20
標準製剤 (錠剤、100mg)	114.76 ± 30.42	9.43 ± 2.89

(Mean ± S. D., n=10)



(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

(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

## VII. 薬物動態に関する項目

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 <sup>1)</sup>	53%
(4) 消失速度定数	アロプリノール錠 50mg「杏林」:0.6756 (hr <sup>-1</sup> ) (n=14)
(5) クリアランス <sup>1)</sup>	全身クリアランス : 9.6mL/min/kg
(6) 分布容積 <sup>1)</sup>	1.6L/kg
(7) 血漿蛋白結合率 <sup>1)</sup>	アロプリノール、オキシプリノール共に血漿タンパクにはほとんど結合しない。
3. 吸収 <sup>1)</sup>	経口投与で比較的速やかに吸収される。
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. 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(1)の項を参照
(3) 乳汁への移行性	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 <sup>1)</sup>	アロプリノールはキサンチンオキシダーゼにより速やかに代謝され、オキシプリノールになる。

## VII. 薬物動態に関する項目

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	該当資料なし
(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	代謝物であるオキシプリノールには活性がある。
(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 <sup>1)</sup>	投与量の 20% は 24~72 時間の間にふん便中に検出されるが、これは未吸収のアロプリノールであると考えられる。吸収されたアロプリノールは 24 時間後にオキシプリノールとして 50%、未変化体として 10% 以下が尿中排泄される。
(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)	<div style="border: 1px solid red; padding: 5px;"> <p><b>【禁忌（次の患者には投与しないこと）】</b> 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者</p> </div>
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	該当しない
5. 慎重投与内容とその理由	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）</b></p> <p>(1) 肝疾患を有するか、又はその既往歴のある患者〔肝障害が発現又は増悪するおそれがあるので、投与する場合は定期的に肝機能検査を実施すること。〕</p> <p>(2) 腎機能障害のある患者〔高い血中濃度が持続するので、減量等を考慮すること（「重要な基本的注意」の項参照）。〕</p> <p>(3) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）</p> <p>(4) メルカプトプリン(6-MP)又はアザチオプリンを投与中の患者（「相互作用」の項参照）</p> <p>(5) ペントスタチンを投与中の患者（「相互作用」の項参照）</p> </div>
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p><b>重要な基本的注意</b></p> <p>(1) 本剤の投与により皮膚症状又は過敏症状が発現し、重篤な症状に至ることがあるので、発熱、発疹等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（「重大な副作用」の項参照）。</p> <p>(2) 腎機能障害のある患者では本剤やその代謝物の排泄が遅延し高い血中濃度が持続するので、投与量の減量や投与間隔の延長を考慮すること。特に腎不全患者に副作用が発現した場合は重篤な転帰をたどることがあり、死亡例も報告されているので、患者の状態を十分に観察し注意しながら投与すること（「慎重投与」の項参照）。</p> <p>(3) 急性痛風発作がおさまるまで、本剤の投与を開始しないこと。</p> <p>(4) 投与初期に尿酸の移動により、痛風発作の一時的な増強をみることが</p> </div>

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

ある。[血中尿酸値を測定しながら投与し、治療初期 1 週間は 1 日 100mg 投与が望ましい。]

(5) 本剤投与中に痛風が増悪した場合にはコルヒチン、インドメタシン等を併用すること。

### 7. 相互作用

(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）**

(1) 次の医薬品の代謝または排泄を阻害するとの報告がある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
メルカプトプリン (6-MP) アザチオプリン	骨髄抑制等の副作用を増強する。 これらの薬剤の用量を 1/3～1/4 に減量すること。	本剤がアザチオプリンの代謝酵素であるキサンチンオキシダーゼを阻害する。その結果 6-メルカプトプリンの血中濃度が上昇する。
ビダラビン	ビダラビンの作用を増強し、幻覚、振戦、神経障害等が発現したとの報告がある。 副作用の発現に注意すること。	本剤がビダラビンの代謝を抑制し、ビダラビンの作用を増強すると報告されている。
クマリン系抗凝血剤 ワルファリンカリウム	クマリン系抗凝血剤の作用を増強するとの報告がある。 凝固能の変動に注意し、クマリン系抗凝血剤の投与量の減量あるいは投与間隔の延長を考慮すること。	本剤による肝代謝酵素活性の低下作用により、クマリン系抗凝血剤の代謝を阻害するためクマリン系抗凝血剤の半減期が延長すると報告されている。
クロルプロパミド	クロルプロパミドの作用を増強する。血糖値の変動に注意し、クロルプロパミドの投与量の減	尿細管分泌の競合によりクロルプロパミドの半減期が延長すると報告されている。



## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

	量あるいは投与間隔の延長を考慮すること。	
シクロホスファミド	骨髄抑制が発現したとの報告がある。 定期的に血液検査を行い、白血球減少等の副作用の発現に注意すること。	本剤または本剤の代謝物がシクロホスファミドの肝代謝を阻害する、または、シクロホスファミド腎排泄を競合阻害すると報告されている。
シクロスポリン	シクロスポリンの血中濃度が上昇し、腎機能低下が発現したとの報告がある。 シクロスポリンの投与量に注意すること。	本剤がシクロスポリンの肝代謝を阻害するためシクロスポリンの血中濃度が上昇すると報告されている。
フェニトイン	フェニトインの血中濃度が上昇し、嗜眠が発現したとの報告がある。 フェニトインの投与量に注意すること。	本剤がフェニトインの肝代謝を阻害するためフェニトインの血中濃度が上昇すると報告されている。
キサンチン系薬剤 テオフィリン等	キサンチン系薬剤（テオフィリン等）の血中濃度が上昇する。 キサンチン系薬剤の投与量に注意すること。	本剤がテオフィリンの代謝酵素であるキサンチンオキシダーゼを阻害するためテオフィリンの血中濃度が上昇すると報告されている。
ジダノシン	健康成人及びHIV患者において、ジダノシンのCmax及びAUCが2倍に上昇したとの報告がある。 ジダノシンの投与量に注意すること。 なお、ジダノシンの半減期には影響は見られていない。	本剤がジダノシンの代謝酵素であるキサンチンオキシダーゼを阻害するため、ジダノシンの血中濃度が上昇すると考えられる。
(2) 次の医薬品との併用により過敏反応を発現するとの報告がある。患者の状態を注意深く観察し、発熱を伴う皮疹等の過敏症状が発現した場合には直ちに両剤の投与を中止すること。		

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ペントスタチン	重症の過敏反応（過敏性血管炎）が発現したとの報告がある。	機序は不明である。
カプトプリル	過敏症状（Stevens-Johnson症候群、関節痛等）が発現したとの報告がある。	機序は不明である。特に腎障害のある患者では注意すること。
ヒドロクロチアジド	重症の過敏反応（悪寒、全身性の皮疹等）が発現したとの報告がある。	機序は不明である。
アンピシリン	発疹の発現が増加するとの報告がある。	機序は不明であるが、本剤または高尿酸血症によりアンピシリンの過敏反応が増強される可能性が報告されている。

### 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) 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）、剝脱性皮膚炎等の重篤な皮膚障害又は過敏性血管炎があらわれることがある。特に肝障害又は腎機能異常を伴うときは、重篤な転帰をたどることがある。従って、発熱、発疹等が認められた場合には、直ちに投与を中止し、再投与しないこと。また、ステロイド剤の投与等適切な処置を行うこと。<sup>註1</sup>
- 2) 薬剤性過敏症症候群<sup>1)</sup>：初期症状として発疹、発熱がみられ、更にリンパ節腫脹、白血球増加、好酸球増多、異型リンパ球出現、肝機能障害等の臓器障害を伴う遅発性の重篤な過敏症状があらわれることがある。また、1型糖尿病（劇症1型糖尿病を含む）を発症し、ケトアシドーシスに至った例も報告されている。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。なお、ヒトヘルペスウイルス6(HHV-6)等のウイルスの再活性化を伴うことが多く、投与中止後も発疹、発熱、肝機能障害等の症状が再燃あるいは遷延化

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

したり、脳炎等の中枢神経症状があらわれたりすることがあるので注意すること。

- 3) ショック、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投与を中止し適切な処置を行うこと。
- 4) 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少があらわれることがあるので、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) 劇症肝炎等の重篤な肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、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。
- 6) 腎不全、腎不全の増悪、間質性腎炎を含む腎障害があらわれることがあるので、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。
- 7) 間質性肺炎があらわれることがあるので、発熱、咳嗽、呼吸困難等の呼吸器症状があらわれた場合には、速やかに胸部 X 線等の検査を実施し、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。
- 8) 横紋筋融解症があらわれることがあるので、筋肉痛、脱力感、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等の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。
- 9) 無菌性髄膜炎：項部硬直、発熱、頭痛、悪心・嘔吐又は意識障害等の症状を伴う無菌性髄膜炎があらわれることがある。なお、本剤投与後数時間で発症した例も報告されている。

### (3) その他の副作用

#### その他の副作用

分類	副作用（頻度不明）
過敏症 <sup>注1)</sup>	発疹、痒痒、関節痛
血液 <sup>注1)</sup>	貧血、白血球減少、紫斑、好酸球増多、リンパ節症
腎臓 <sup>注1)</sup>	腎機能異常
消化器	食欲不振、胃部不快感、軟便、下痢、口内炎
全身症状	全身倦怠感、浮腫、脱力感
その他	脱毛 <sup>註2)</sup> 、CK(CPK)上昇 <sup>註3)</sup> 、味覚障害、女性化乳房、末梢神経障害 <sup>註4)</sup>

注1) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(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	<p>(1) 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</p> <p>(2) 重要な副作用（頻度不明） ショック、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投与を中止し適切な処置を行うこと。</p> <p>(3) その他の副作用（頻度不明） 過敏症：発疹、瘙痒、関節痛 このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。</p>
9. 高齢者への投与	<p>本剤の主代謝物は主として腎から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、用量に留意して慎重に投与すること。</p>
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。[動物実験（マウス）の妊娠 10 日目又は 13 日目に 50 及び 100mg/kg を腹腔内投与したところ、胎児に催奇形作用が認められたと報告されている。]</p> <p>(2) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。[ヒト母乳中へ本剤及びその代謝物が移行することが報告されている。]</p>
11. 小児等への投与	小児等に対する安全性は確立していない。
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

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 14. 適用上の注意

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、更には穿孔をお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。]

### 15. その他の注意

- (1) 使用中は摂水量を多くし、1 日の尿量を 2L 以上とすることが望ましい。
- (2) 外国における疫学調査報告で、本剤の投与により白内障があらわれたとの報告がある。<sup>註5</sup>
- (3) 動物実験において、鉄剤と併用した場合に、本剤の大量投与により、肝の鉄貯蔵量が増加したとの報告がある。
- (4) 漢民族 (Han-Chinese) を対象としたレトロスペクティブな研究において、アロプリノールによる中毒性表皮壊死融解症 (Toxic Epidermal Necrolysis : TEN) 及び皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson 症候群) 等の重症薬疹発症例の HLA 型を解析した結果、51 例中全ての症例が *HLA-B\*5801* 保有者であったとの報告がある。また、別の研究では、アロプリノールにより中毒性表皮壊死融解症及び皮膚粘膜眼症候群を発症した日本人及びヨーロッパ人において、それぞれ 10 例中 4 例 (40%)、27 例中 15 例 (55%) が *HLA-B\*5801* 保有者であったとの報告もある。なお、*HLA-B\*5801* の保有率は漢民族では 20-30% に対し、日本人及びヨーロッパ人では 1-2% である。

### 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	アロプリノール錠 50mg「杏林」	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
	アロプリノール錠 100mg「杏林」	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	アロプリノール	劇薬、処方箋医薬品 <sup>注)</sup>

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：

アロプリノール錠 50mg「杏林」：3年（安定性試験結果に基づく<sup>2)</sup>）

アロプリノール錠 100mg「杏林」：5年（安定性試験結果に基づく<sup>2)</sup>）

### 3. 貯法・保存条件

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

特になし

#### (2) 薬剤交付時の取り扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

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  
くすりのしおり：有り

患者用指導箋：

アロプリノール錠 50mg「杏林」をお飲みになる患者さんへ  
アロプリノール錠100mg「杏林」

このお薬は、高尿酸血症（血液中の尿酸が多くなる状態）や痛風（血液中の尿酸が多くなって起こる病気）の治療に用いられます。体内で尿酸が作られるのを抑え、血液中の尿酸の量を低下させるお薬です。

お薬をお飲みになる前に…

- 以前に薬を飲んで、発疹などが出たことがある。
- 肝臓の病気がある、あるいは過去にかかったことがある。
- 腎臓の病気がある。

などがあれば、このお薬をお飲みになる前に医師又は薬剤師にお伝えください。

飲み始めた後は…

このお薬を飲み始めた後、まれではありますが、重篤な副作用があらわれることがあります。裏面に示すような症状があらわれたら、服用を中止し、すぐに医師又は薬剤師にご相談ください。

次のような症状に気づいたときには、服用を中止し、すぐに医師又は薬剤師にご相談ください。

**発熱、発疹、のどの痛み、全身がだるい、食欲がない**

また、この他にも、何か変だなど感じた場合には、すぐに医師又は薬剤師にご相談ください。

**副作用の初期症状**  
アロプリノール錠50mg「杏林」・錠100mg「杏林」を飲み始めた後、まれに見られる重篤な副作用の初期症状は以下の通りです。

**皮膚の障害**  
◆発熱、発疹、のどの痛み、関節の痛みなどの感冒様症状、皮膚が斑状に赤くなる、眼が充血する、口の中が赤いなどがあらわれた場合。

**血液の障害**  
◆発熱あるいはさむけがする、のどが痛い、全身がだるい、顔やまぶたのうらが白っぽい、出血しやすくなる（歯ぐきの出血、鼻血など）、青あざができる（押しても色が消えない）、気分が悪くなりくらっとする（貧血の症状）などがあらわれた場合。

**肝臓の障害**  
◆食欲がない、全身がひどくだるい、皮膚や白目が黄色くなる、尿の色が濃く（茶色く）なった、体がかゆく、発疹が出たなどがあらわれた場合。

#### (3) 調剤時の留意点について

特になし

### 5. 承認条件等

該当しない

## X. 管理的事項に関する項目

### 6. 包装

アロプリノール錠 50mg「杏林」	PTP：100 錠
アロプリノール錠 100mg「杏林」	PTP：100 錠、1200 錠 バラ：1200 錠

### 7. 容器の材質

アロプリノール錠 50mg「杏林」

[PTP 包装品]

PTP 包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー包装：ポリプロピレンフィルム

箱：紙

アロプリノール錠 100mg「杏林」

[PTP 包装品]

PTP 包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー包装：ポリエチレン・ポリ塩化ビニリデン・ポリプロピレンラミネートフィルム

箱：紙

[バラ包装品]

ポリエチレン製袋、金属製缶

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ザイロリック錠 50、ザイロリック錠 100

同効薬：フェブキシソスタット、トピロキシソスタット

### 9. 国際誕生年月日

1966 年

### 10. 製造販売承認年月日 及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
アロプリノール錠 50mg「杏林」	2010 年 7 月 15 日	22200AMX00853000
アロプリノール錠 100mg「杏林」	2012 年 2 月 27 日 (販売名変更による)	22400AMX00628000

(旧販売名)：アロプリノール錠 100mg

製造販売承認年月日：2006 年 2 月 3 日

(旧販売名)：アロプリノール錠

製造販売承認年月日：1976 年 8 月 30 日



## X. 管理的事項に関する項目

11. 薬価基準収載年月日	<table border="1"> <tr> <th data-bbox="480 264 911 309">販売名</th> <th colspan="3" data-bbox="911 264 1434 309">薬価基準収載年月日</th> </tr> <tr> <td data-bbox="480 309 911 353">アロプリノール錠 50mg「杏林」</td> <td colspan="3" data-bbox="911 309 1434 353">2010年11月19日</td> </tr> <tr> <td data-bbox="480 353 911 409">アロプリノール錠 100mg「杏林」</td> <td colspan="3" data-bbox="911 353 1434 409">2012年12月14日(販売名変更による)</td> </tr> </table>				販売名	薬価基準収載年月日			アロプリノール錠 50mg「杏林」	2010年11月19日			アロプリノール錠 100mg「杏林」	2012年12月14日(販売名変更による)		
販売名	薬価基準収載年月日															
アロプリノール錠 50mg「杏林」	2010年11月19日															
アロプリノール錠 100mg「杏林」	2012年12月14日(販売名変更による)															
	<p>(旧販売名)：アロプリノール錠 100mg  薬価基準収載年月日：2006年6月9日  経過措置期間満了：2013年9月30日</p> <p>(旧販売名)：アロプリノール錠  薬価基準収載年月日：1978年4月  経過措置期間満了：2007年3月31日</p>															
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	該当しない															
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	該当しない															
14. 再審査期間	該当しない															
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。															
16. 各種コード	<table border="1"> <thead> <tr> <th data-bbox="480 1402 719 1547">販売名</th> <th data-bbox="719 1402 956 1547">HOT(9桁)番号</th> <th data-bbox="956 1402 1195 1547">厚生労働省薬価基準収載医薬品コード</th> <th data-bbox="1195 1402 1434 1547">レセプト電算コード</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="480 1547 719 1644">アロプリノール錠 50mg「杏林」</td> <td data-bbox="719 1547 956 1644">120318901</td> <td data-bbox="956 1547 1195 1644">3943001F2094</td> <td data-bbox="1195 1547 1434 1644">622031801</td> </tr> <tr> <td data-bbox="480 1644 719 1742">アロプリノール錠 100mg「杏林」</td> <td data-bbox="719 1644 956 1742">108562441</td> <td data-bbox="956 1644 1195 1742">3943001F1012</td> <td data-bbox="1195 1644 1434 1742">620856241</td> </tr> </tbody> </table>				販売名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード	アロプリノール錠 50mg「杏林」	120318901	3943001F2094	622031801	アロプリノール錠 100mg「杏林」	108562441	3943001F1012	620856241
販売名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード													
アロプリノール錠 50mg「杏林」	120318901	3943001F2094	622031801													
アロプリノール錠 100mg「杏林」	108562441	3943001F1012	620856241													
17. 保険給付上の注意	<p>アロプリノール錠 50mg「杏林」  後発医薬品として承認された医薬品であっても、先発医薬品と薬価が同額又は高いものについては、診療報酬における加算等の算定対象とならない後発医薬品</p> <p>アロプリノール錠 100mg「杏林」  診療報酬上の後発医薬品である。</p>															

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方解説書、C-414 (廣川書店 2016)
- 2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アロプリノール錠 50mg「杏林」・100mg「杏林」の安定性試験に関する資料
- 3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アロプリノール錠 50mg「杏林」の無包装状態での安定性に関する資料
- 4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アロプリノール錠 100mg「杏林」の無包装状態での安定性に関する資料
- 5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アロプリノール錠 50mg「杏林」・100mg「杏林」の溶出性に関する資料
- 6) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アロプリノール錠 50mg「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
- 7) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アロプリノール錠 100mg「杏林」の吸収排泄に関する資料
- 8) 厚生労働省：重篤副作用疾患別対応マニュアル薬剤性過敏症症候群

### 2. その他の参考文献

1. Hitchings, G. H. :Ann. rheum. Dis. **25**, 601 (1966)
2. Elion, G. B. :Ann. rheum. Dis. **25**, 608 (1966)
- 註 1. Bennet, T. O. , et al. :Arch, Ophthalmol. **95**, 1362 (1977)  
Assaad, D. , et al. :C. M. A. J. **118**, 154 (1978)  
加茂ら：臨床皮膚科, **31**(5), 361 (1977)
- 註 2. Auerbach, R. , et al. :Arch. Derm. , **98**, 104 (1968)
- 註 3. 北口 正孝 他：尿酸, **10**(2)80~86 (1986)
- 註 4. Azulay, J. P. , et al. :Eur. Neurol. , **33**, 193~194 (1993)
- 註 5. Garbe, E. , et al. :Arch. Ophthalmol. , **116**(12) 1652 (1998)

## XII. 参考資料

---

- |                 |        |
|-----------------|--------|
| 1. 主な外国での発売状況   | 該当しない  |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 該当資料なし |

## XII. 備考

---

1. その他の関連資料

該当資料なし