

## 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

高尿酸血症治療剤

日本薬局方 アロプリノール錠

アロプリノール錠50mg「TCK」

アロプリノール錠100mg「TCK」

ALLOPURINOL

剤 形	錠剤(素錠)		
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意—医師等の処方箋により使用すること）		
規格・含量	錠50mg：1錠中にアロプリノールを50mg含有する。 錠100mg：1錠中にアロプリノールを100mg含有する。		
一般名	和名：アロプリノール 洋名：Allopurinol		
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	錠50mg	錠100mg	
製造販売承認年月日	2013年 2月15日	2016年 7月26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	2010年11月19日	1981年11月	
開発・製造販売（輸入） 提携・販売会社名	製造販売元：辰巳化学株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	辰巳化学株式会社 薬事学術・安全管理部 TEL:076-247-2132 FAX:076-247-5740 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.tatsumi-kagaku.com">https://www.tatsumi-kagaku.com</a>		

本IFは2020年2月改訂(第18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、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」  
<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

# I F 利用の手引きの概要 一日本病院薬剤師会一

## 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見て、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会において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-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。

②I 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、表紙に統けて日病薬作成の「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]

①I 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。

②I 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、I Fの利用性を高める必要がある。また、隨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があり、その取扱いには十分留意すべきである。

### 4. 利用に際しての留意点

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し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
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
<b>II. 名称に関する項目</b>	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示式式	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
<b>III. 有効成分に関する項目</b>	3
1. 物理化学的性質	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
<b>IV. 製剤に関する項目</b>	4
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4
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全性	8
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8
7. 溶出性	8
8. 生物学的試験法	12
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	12
10. 製剤中の有効成分の定量法	12
11. 力価	12
12. 混入する可能性のある夾雑物	12
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	12
14. その他	12
<b>V. 治療に関する項目</b>	13
1. 効能又は効果	13
2. 用法及び用量	13
3. 臨床成績	13
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>	14
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	14
2. 薬理作用	14
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	15
1. 血中濃度の推移・測定法	15
2. 薬物速度論的パラメータ	16
3. 吸収	16
4. 分布	17
5. 代謝	17
6. 排泄	17
7. トランスポーターに関する情報	17
8. 透析等による除去率	17
<b>VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目</b>	18
1. 警告内容とその理由	18
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	18
3. 効能又は効果に関する使用上の注意とその理由	18
4. 用法及び用量に関する使用上の注意とその理由	18
5. 慎重投与内容とその理由	18
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	18
7. 相互作用	18
8. 副作用	20
9. 高齢者への投与	22
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	22
11. 小児等への投与	22
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	22
13. 過量投与	23
14. 適用上の注意	23
15. その他の注意	23
16. その他	23
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	24
1. 薬理試験	24
2. 毒性試験	24
<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	25
1. 規制区分	25
2. 有効期間又は使用期限	25
3. 貯法・保存条件	25
4. 薬剤取扱い上の注意点	25
5. 承認条件等	25
6. 包装	25
7. 容器の材質	25
8. 同一成分・同効薬	25
9. 国際誕生年月日	25
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	26
11. 薬価基準収載年月日	26
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	26
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	26
14. 再審査期間	26
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	26
16. 各種コード	26
17. 保険給付上の注意	26
<b>X I. 文献</b>	27
1. 引用文献	27
2. その他の参考文献	27
<b>X II. 参考資料</b>	27
1. 主な外国での発売状況	27
2. 海外における臨床支援情報	27
<b>X III. 備考</b>	27

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

アロプリノールは高尿酸血症治療剤であり、本邦では1969年に上市されている。アリスマット錠は、辰巳化学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、安定性試験を実施し、1980年6月に承認を得て、1981年11月発売に至った。医療事故防止のため2006年にアリスマット錠100mg、2016年にアロプリノール錠100mg「TCK」と販売名変更を経て現在に至っている。また、アリスマット錠50mgは、辰巳化学株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第0331015号（2005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実施し、2010年7月に承認を得て、2010年11月発売に至った。2016年に医療事故防止のためアロプリノール錠50mg「TCK」と販売名変更を経て現在に至っている。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

○アロプリノール錠50mg「TCK」及びアロプリノール錠100mg「TCK」はそれぞれアロプリノールを有効成分とし、「下記の場合（痛風、高尿酸血症を伴う高血圧症）における高尿酸血症の是正」に効能を有する白色～微黄白色の素錠及び白色～類白色の素錠である。

○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)、剥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、無菌性髄膜炎があらわれることがある。

## II. 名称に関する項目

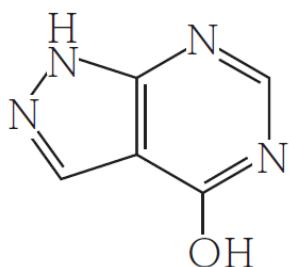
### 1. 販売名

- (1) 和名 : アロプリノール錠50mg 「TCK」  
アロプリノール錠100mg 「TCK」
- (2) 洋名 : ALLOPURINOL Tablets 50mg 「TCK」  
ALLOPURINOL Tablets 100mg 「TCK」
- (3) 名称の由来 : 一般名 + 剤形 + 含量 + 「TCK」

### 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*H*-Pyrazolo[3,4-*d*]pyrimidin-4-ol (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

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

*N, N*－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

日局「アロプリノール」の確認試験法による。

#### 4. 有効成分の定量法

日局「アロプリノール」の定量法による。

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

	外 形			色 調 剤 形	識別コード
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)		
アロプリノール錠 50mg「TCK」				白色～微黄白色 素錠	AR 50
アロプリノール錠 100mg「TCK」				白色～類白色 素錠	Tu-AR 100

#### (2) 製剤の物性

#### (3) 識別コード

	本体	包装材料
アロプリノール錠50mg「TCK」	AR 50	Tu AR-50
アロプリノール錠100mg「TCK」	Tu-AR 100	Tu AR-100

#### (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

- アロプリノール錠50mg「TCK」  
1錠中にアロプリノールを50mg含有する。
- アロプリノール錠100mg「TCK」  
1錠中にアロプリノールを100mg含有する。

#### (2) 添加物

乳糖水和物、セルロース、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度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

#### (3) その他

該当資料なし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### 4. 製剤の各種条件下における安定性

##### ＜加速試験＞<sup>1)</sup>

###### ●アロプリノール錠50mg「TCK」

加速試験（40℃、相対湿度75%、6カ月）の結果、アロプリノール錠50mg「TCK」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。

試験条件：40℃、相対湿度75%、6カ月、PTP包装

	規格	試験開始時	1カ月後	3カ月後	6カ月後
性状	白色～微黄白色の素錠	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	(1)、(2)	適	適	適	適
製剤均一性	含量均一性試験	適	適	適	適
溶出性	日局医薬品各条溶出試験	適	適	適	適
定量(%)	表示量の93.0～107.0%を含む	100.5 101.1 100.8	102.0 101.5 101.9	101.8 100.8 101.6	100.7 101.1 101.5

(3ロット、各ロットn=3)

(1) 吸収極大：波長248～252nmに吸収の極大を示す

(2) TLC：試料溶液及び標準溶液から得られたスポットのRf値は等しい

##### ＜苛酷試験＞<sup>1)</sup>

###### ●アロプリノール錠100mg「TCK」

室温保存（室温、6カ月）、光照射（37℃、1000ルクス、2カ月）及び加温加湿（40℃、湿度80%、3カ月）の各条件下での安定性試験の結果、アロプリノール錠100mg「TCK」は経時に安定であると考えられた。

試験条件：室温、6カ月、PTP包装

	規格	試験開始時	1カ月後	2カ月後	3カ月後	6カ月後
性状	白色～類白色の錠剤	類白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	(1)	適	適	適	適	適
崩壊試験	日局一般試験法の崩壊試験法	適	適	適	適	適
定量(%)	表示量の93.0～107.0%を含む	99.9 99.5 99.9	99.4 98.8 99.8	98.7 98.7 99.5	99.1 99.6 98.8	99.6 99.0 99.4

(3ロット、各ロットn=3)

(1) 吸収スペクトル：波長248～252nmに吸収の極大を示す

試験条件：37°C、1000ルクス、2カ月、PTP包装

	規格	試験開始時	1カ月後	2カ月後
性状	白色～類白色の錠剤	類白色の錠剤	変化なし	変化なし
確認試験	(1)	適	適	適
崩壊試験	日局一般試験法 の崩壊試験法	適	適	適
定量 (%)	表示量の 93.0～107.0% を含む	99.9 99.5 99.9	98.7 98.9 99.5	98.8 99.2 99.2

(3ロット、各ロットn=3)

(1) 吸収スペクトル：波長248～252nmに吸収の極大を示す

試験条件：40°C、湿度80%、3カ月、PTP包装

	規格	試験開始時	1カ月後	2カ月後	3カ月後
性状	白色～類白色の 錠剤	類白色の錠剤	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	(1)	適	適	適	適
崩壊試験	日局一般試験法 の崩壊試験法	適	適	適	適
定量 (%)	表示量の 93.0～107.0% を含む	99.9 99.5 99.9	99.1 99.4 99.4	99.2 99.0 98.8	98.8 99.0 99.1

(3ロット、各ロットn=3)

(1) 吸収スペクトル：波長248～252nmに吸収の極大を示す

### ＜無包装状態での安定性試験＞

#### ●アロプリノール錠50mg「TCK」

アロプリノール錠50mg「TCK」について、温度、湿度、光に対する無包装状態での安定性試験結果を以下に示す。

保存条件	試験項目	規格	結果			
			開始時	1箇月	2箇月	3箇月
温度	40±2°C 遮光 気密容器	性状	白色～微黄白色の素錠	白色の素錠	変化なし	変化なし
		硬度* <sup>1</sup> (kg)	2.0kg以上 (参考)	5.5	5.1	4.6
		溶出性* <sup>2</sup> (%)	30分間、80%以上 (最小値～最大値)	83～87	87～95	84～87
		定量* <sup>3</sup> (%)	93.0%～107.0%	100.3	100.6	99.9
湿度	25±1°C 75±5%RH 遮光 開放	性状	白色～微黄白色の素錠	白色の素錠	変化なし	変化なし
		硬度* <sup>1</sup> (kg)	2.0kg以上 (参考)	5.5	3.7	3.1
		溶出性* <sup>2</sup> (%)	30分間、80%以上 (最小値～最大値)	83～87	89～96	83～86
		定量* <sup>3</sup> (%)	93.0%～107.0%	100.3	101.4	99.8

保存条件	試験項目	規格	結果	
			開始時	60万lx・hr
光 温度 なりゆき 1000lx/hr 気密容器	性状	白色～微黄白色の素錠	白色の素錠	変化なし
	硬度 <sup>＊1</sup> (kg)	2.0kg以上 (参考)	5.5	4.5
	溶出性 <sup>＊2</sup> (%)	30分間、80%以上 (最小値～最大値)	83～87	91～97
	定量 <sup>＊3</sup> (%)	93.0%～107.0%	100.3	100.0

＊1 n=10の平均値

＊2 n=6

＊3 n=3の平均値

●アロプリノール錠100mg「TCK」

アロプリノール錠100mg「TCK」について、温度、湿度、光に対する無包装状態での安定性試験結果を以下に示す。

保存条件	試験項目	規格	結果			
			開始時	1箇月	2箇月	3箇月
温度 40±2°C 遮光 気密容器	性状	白色～類白色の錠剤	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
	硬度 <sup>＊1</sup> (kg)	2.0kg以上 (参考)	7.7	6.3	6.6	6.5
	溶出性 <sup>＊2</sup> (%)	30分間、80%以上 (最小値～最大値)	95.8～97.5	97.2 ～98.1	97.0 ～98.3	96.2 ～98.1
	定量 <sup>＊3</sup> (%)	95%～105%	100.6	98.9	98.6	98.1
湿度 25±1°C 75±5%RH 遮光 開放	性状	白色～類白色の錠剤	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
	硬度 <sup>＊1</sup> (kg)	2.0kg以上 (参考)	7.7	3.3	3.8	3.7
	溶出性 <sup>＊2</sup> (%)	30分間、80%以上 (最小値～最大値)	95.8～97.5	93.1 ～94.6	91.9 ～93.0	89.9 ～91.8
	定量 <sup>＊3</sup> (%)	95%～105%	100.6	99.3	99.2	99.3

保存条件	試験項目	規格	結果	
			開始時	60万lx・hr
光 温度 なりゆき 1000lx/hr 気密容器	性状	白色～類白色の錠剤	白色の素錠	変化なし
	硬度 <sup>＊1</sup> (kg)	2.0kg以上 (参考)	7.7	6.5
	溶出性 <sup>＊2</sup> (%)	30分間、80%以上 (最小値～最大値)	95.8～97.5	93.4～96.1
	定量 <sup>＊3</sup> (%)	95%～105%	100.6	99.1

＊1 n=10の平均値

＊2 n=6

＊3 n=3の平均値

## 5. 調製法及び溶解後の安全性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当資料なし

## 7. 溶出性<sup>2)</sup>

【溶出挙動における類似性及び同等性】

●アロプリノール錠50mg「TCK」

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：2006年11月24日付 薬食審査発第1124004号」)

試験方法 : 日本薬局方一般試験法溶出試験法パドル法

試験条件

試験液量 : 900 mL

温度 : 37 °C±0. 5 °C

試験液 : pH1. 2 =日本薬局方溶出試験第1液

pH5. 0 =薄めたMcIlvaineの緩衝液

pH6. 8 =日本薬局方溶出試験第2液

水 =日本薬局方精製水

回転数 : 50rpm(pH1. 2、pH5. 0、pH6. 8、水)、100rpm(pH5. 0)

標準製剤の平均溶出率が85%を越えた時点で、試験を終了することができる。

判定基準

pH1. 2

標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点（5分及び30分）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%の範囲にないが、f2関数の値が42以上である。

pH5. 0(50rpm)、pH6. 8

標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点（10分及び45分）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。

水

標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近となる適当な2時点（5分及び30分）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。

pH5. 0(100rpm)

試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。

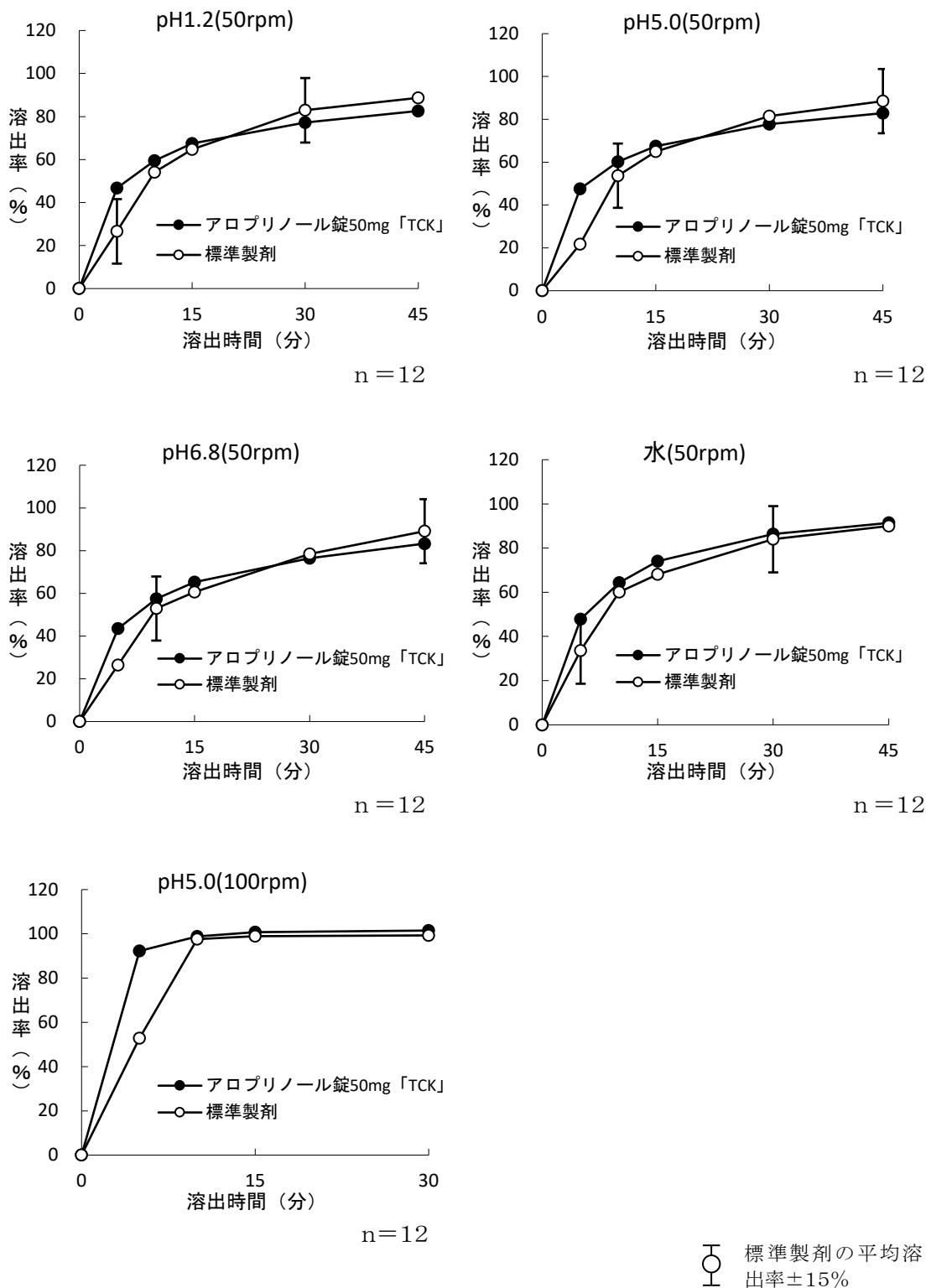


表 溶出挙動における類似性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				標準製剤 (錠剤、50mg)	アロプリノール錠 50mg「TCK」	判定
方法	回転数	試験液	採取時間	平均溶出率%	平均溶出率%	
パドル法	50rpm	pH1. 2	5分	26. 6	46. 8	範囲外
			30分	82. 9	77. 2	範囲内
			f2関数の値は62. 3で42以上			適
		pH5. 0	10分	53. 7	60. 2	範囲内
			45分	88. 5	82. 9	範囲内
		pH6. 8	10分	52. 9	57. 5	範囲内
			45分	89. 1	83. 3	範囲内
		水	5分	33. 6	47. 8	範囲内
			30分	84. 0	86. 3	範囲内
	100rpm	pH5. 0	15分	99. 0	100. 8	範囲内

(n=12)

●アロプリノール錠100mg「TCK」

(「医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について：1998年7月15日付 医薬発第634号」)

試験方法 : 日本薬局方一般試験法溶出試験法第2法(パドル法)

試験条件

試験液量 : 900 mL

温度 : 37 °C±0. 5 °C

試験液 : pH1. 2 =日本薬局方崩壊試験第1液

pH4. 0 =酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 (0. 05mol/L)

pH6. 8 =日本薬局方試葉・試液のリン酸塩緩衝液 (1→2)

水 =日本薬局方精製水

回転数 : 50rpm(pH1. 2、pH4. 0、pH6. 8、水)

標準製剤の平均溶出率が85%を越えた時点で、試験を終了することができる。

判定基準

pH1. 2、pH6. 8、水

試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。

pH4. 0

標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近となる適当な2時点(10分及び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。

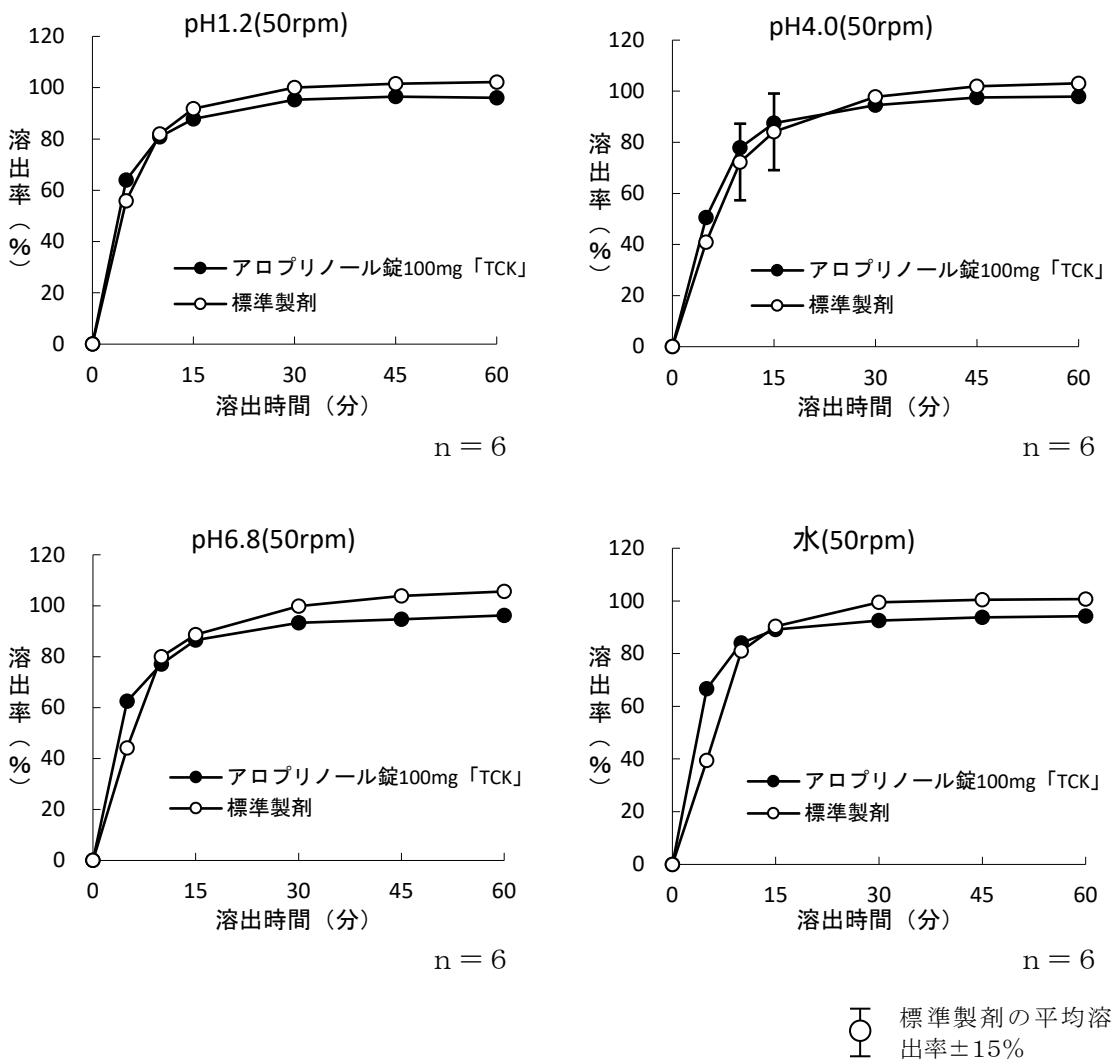


表 溶出挙動における類似性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				標準製剤 (錠剤、100mg)	アロプリノール錠 100mg「TCK」	判定
方法	回転数	試験液	採取時間	平均溶出率%	平均溶出率%	
パドル法	50rpm	pH1.2	15分	91.8	87.8	範囲内
		pH4.0	10分	72.3	77.9	範囲内
			15分	84.1	87.5	範囲内
		pH6.8	15分	88.7	86.5	範囲内
		水	15分	90.4	89.1	範囲内

(n=6)

#### 【公的溶出規格への適合】

アロプリノール錠50mg「TCK」及びアロプリノール錠100mg「TCK」は、日本薬局方医薬品各条に定められた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**

日局「アロプリノール錠」の確認試験法による。

**10. 製剤中の有効成分の定量法**

日局「アロプリノール錠」の定量法による。

**11. 力価**

該当しない

**12. 混入する可能性のある夾雜物**

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**

該当しない

## 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

●アロプリノール錠50mg「TCK」

表中の◎：評価資料 ー：非検討もしくは評価の対象とせず を表す

phase	対象	有効性	安全性	薬物動態	概要
生物学的同等性試験	日本人健康成人男子	ー	◎	◎	非盲検化 単回経口投与

●アロプリノール錠100mg「TCK」

該当しない

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

#### (6) 治療的使用

##### 1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

該当資料なし

##### 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

## **VI. 薬効薬理に関する項目**

### **1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群**

オキシブリノール

### **2. 薬理作用**

#### **(1) 作用部位・作用機序<sup>3)</sup>**

高尿酸血症治療薬。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、アロブ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。アロブリノール自体もキサンチノ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<sup>4)</sup>

	Tmax (hr)
アロプリノール錠50mg「TCK」	1. 14±0. 36

(Mean±S. D. ,n=14)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>4)</sup>

##### 【生物学的同等性試験】

アロプリノール製剤であるアロプリノール錠50mg「TCK」の医薬品製造販売承認申請を行うに当たり、標準製剤又はアロプリノール錠50mg「TCK」健康成人男子に単回経口投与し、血漿中のアロプリノール濃度を測定して、薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。

##### ・治験デザイン

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 2006年11月24日)に準じ、非盲検下における2剤2期クロスオーバー法を用いる。

はじめの入院期間を第Ⅰ期とし、2回目の入院期間を第Ⅱ期とする。なお、第Ⅰ期と第Ⅱ期の間の休薬期間は7日間以上とする。

##### ・投与条件

被験者に対して12時間以上の絶食下において、1錠中にアロプリノールを50mg含有するアロプリノール錠50mg「TCK」1錠又は標準製剤1錠を150mLの水とともに経口投与する。投与後4時間までは、絶食とする。

##### ・採血時点

第Ⅰ期及び第Ⅱ期ともに投与前、0.5, 1, 1.5, 2, 2.5, 3, 4, 6及び8時間後の10時点とする。採血量は1回につき7mLとする。

##### ・分析法：HPLC法

#### <薬物動態パラメータ>

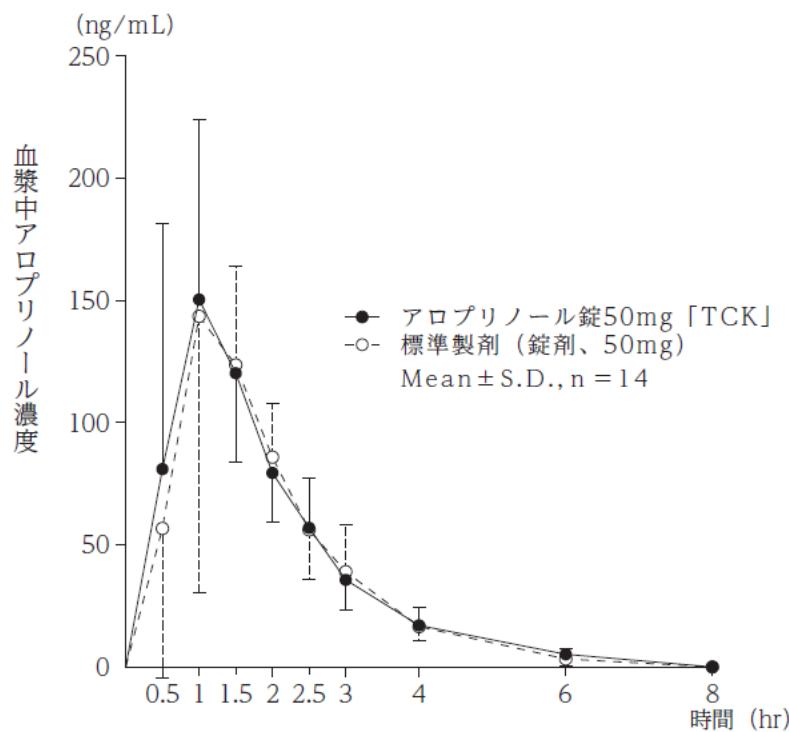
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→8hr</sub> (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
アロプリノール錠 50mg「TCK」	306. 50±71. 33	185. 12±82. 25	1. 14±0. 36	1. 08±0. 25
標準製剤 (錠剤、50mg)	294. 34±91. 00	187. 02±80. 61	1. 32±0. 46	0. 93±0. 17

(Mean±S. D. ,n=14)

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。

表 アロプリノール錠50mg「TCK」と標準製剤の対数値の平均値の差の90%信頼区間

	90%信頼区間
	$\log(0.80) \sim \log(1.25)$
AUC <sub>0→8hr</sub>	$\log(1.00) \sim \log(1.12)$
Cmax	$\log(0.88) \sim \log(1.09)$



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. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 7. 相互作用」の項を参照すること。

#### (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 解析方法

該当資料なし

#### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (3) バイオアベイラビリティ

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

該当資料なし

##### (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

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

該当資料なし

##### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

#### 6. 排泄

##### (1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

##### (2) 排泄率

該当資料なし

##### (3) 排泄速度

該当資料なし

#### 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

#### 8. 透析等による除去率

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）  
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 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。〕
- (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）〕
- (3) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）
- (4) メルカブトプリン（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）
- (5) ペントスタチンを投与中の患者（「相互作用」の項参照）

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (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）
- (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）
- (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。
- (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量あるいは投与間隔の延長を考慮すること。	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。
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。
シクロスボリン	シクロスボ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。シクロスボリンの投与量に注意すること。	本剤がシクロスボリンの肝代謝を阻害するためシクロスボリンの血中濃度が上昇すると報告されている。
フェニトイイン	フェニトイ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。フェニトイインの投与量に注意すること。	本剤がフェニトイインの肝代謝を阻害するためフェニトイ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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジダノシン	健康成人及びHIV患者において、ジダノシンのC <sub>max</sub> 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。

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

#### （1）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）、剥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。
- 2) 薬剤性過敏症症候群<sup>5)</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、好酸球增多、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された場合には、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さ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、恶心・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されることがある。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**

頻度不明	
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹、瘙痒、関節痛
血液液 <sup>注)</sup>	貧血、白血球減少、紫斑、好酸球增多、リンパ節症
腎臓 <sup>注)</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、CK (CPK) 上昇、味覚障害、女性化乳房、末梢神経障害

注) このような症状があらわされた場合には投与を中止すること。

**(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧**

該当資料なし

**(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度**

該当資料なし

**(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法**

- 禁忌 (次の患者には投与しないこと)  
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 重要な基本的注意  
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。
- 相互作用  
併用注意 (併用に注意すること)  
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。

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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。

#### 4. 重大な副作用

- 1) 薬剤性過敏症症候群：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、好酸球增多、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。
- 2) 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。

#### 5. その他の副作用

**過敏症<sup>注)</sup>**：発疹、瘙痒、関節痛

<sup>注)</sup>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。

#### 9. 高齢者への投与

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。

#### 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。[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。]
- (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。]

#### 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

### 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。
- (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

該当しない

## 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「TCK」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>  
アロプリノール錠100mg「TCK」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>

注意—医師等の処方箋により使用すること

有効成分：アロプリノール 効薬、処方箋医薬品

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：外装に表示（3年）

### 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

該当資料なし

#### （2）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14. 適用上の注意」を参照すること。  
くすりのしおり：有り

#### （3）調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

#### ●アロプリノール錠50mg「TCK」

PTP包装：100錠

#### ●アロプリノール錠100mg「TCK」

PTP包装：100錠、1, 200錠

### 7. 容器の材質

#### ●アロプリノール錠50mg「TCK」

PTP包装：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

#### ●アロプリノール錠100mg「TCK」

PTP包装：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ザイロリック錠50／錠100

同 効 薬：プロベネシド、ベンズプロマイン など

### 9. 國際誕生年月日

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

- アロプリノール錠50mg 「TCK」  
製造販売承認年月日：2013年2月15日  
承 認 番 号：22500AMX00663000  
(2010年7月15日 -旧販売名- アリスマット錠50mg)
- アロプリノール錠100mg 「TCK」  
製造販売承認年月日：2016年7月26日  
承 認 番 号：22800AMX00444000  
(2006年6月27日 -旧販売名- アリスマット錠100mg)

## 11. 薬価基準収載年月日

- アロプリノール錠50mg 「TCK」  
2016年12月9日  
(2010年11月19日 -旧販売名- アリスマット錠50mg)
- アロプリノール錠100mg 「TCK」  
2016年12月9日  
(2006年12月8日 -旧販売名- アリスマット錠100mg)

## 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

販売名	HOT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 「TCK」	120024901	3943001F2310	622002402
アロプリノール錠100mg 「TCK」	108562411	3943001F1012	620856211

## 17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## X I. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 辰巳化学株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 辰巳化学株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 3) 第十七改正 日本薬局方解説書
- 4) 辰巳化学株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験)
- 5) 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

なし

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

### 2. 海外における臨床支援情報

## X III. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

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

#### (1) 粉碎

##### 粉碎時の安定性試験結果

###### ●アロプリノール錠50mg「TCK」

保存条件	試験項目	規格	結果		
			開始時	2週間	4週間
25±1°C 75±5%RH 遮光 開放	定量 (%)	93.0%～107.0%	100.3	99.8	98.0

###### ●アロプリノール錠100mg「TCK」

保存条件	試験項目	規格	結果		
			開始時	2週間	4週間
室内散乱光 シャーレ開放	定量 (%)	95%～105%	100.7	99.6	99.8

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管チューブの通過性

「内服薬 経管投与ハンドブック 第二版（監修：藤島一郎、執筆：倉田なおみ）、じほう」を参考に、製剤の崩壊・懸濁性および経管投与チューブの通過性の試験を行った。

##### 試験方法

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に製剤をそのまま1個入れてピストンを戻し、ディスペンサーに55°Cの温湯20mLを吸い取り、筒先に蓋をして5分間自然放置する。5分後にディスペンサーを手で90度15往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察する。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行う。それでも崩壊懸濁しない場合は、この方法を中止する。中止した製品は、破壊（乳棒で数回叩く）後、上述と同様の操作を行う。

得られた懸濁液を経管チューブの注入端より、約2～3mL/secの速度で注入し、通過性を観察する。体内挿入端から3分の2を水平にし、他端（注入端）を30cmの高さにセットする。注入後に適量の水を注入して経管チューブ内を洗うとき、経管チューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

## 判定方法

水（約55°C）

製剤を55°Cの温湯20mLに入れ、5分または10分放置後に搅拌したときの通過性  
破壊→水

製剤を破壊した後に、55°Cの温湯20mLに入れ、5分または10分放置後に搅拌したときの通過性

○：経管チューブを通過

△：時間をかければ崩壊しそうな状況、または経管チューブを閉塞する危険性がある

×：通過困難

## 結果

### ●アロプリノール錠50mg 「TCK」

経管チューブサイズ	水（約55°C）		破壊→水	
	5分	10分	5分	10分
8Fr.	○	△	△	△

### ●アロプリノール錠100mg 「TCK」

経管チューブサイズ	水（約55°C）		破壊→水	
	5分	10分	5分	10分
8Fr.	○	△	△	△

## 2. その他の関連資料

該当資料なし



〒921-8164 金沢市久安3丁目406番地  
電話 (076) 247-1231番 代表