2026 年 2 月改訂（第 13 版）

日本標準商品分類番号：873943

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 2018（2019 年更新版）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「NIG」
アロプリノール錠 100mg「NIG」
Allopurinol Tablets

剤形	フィルムコーティング錠		
製剤の規制区分	処方箋医薬品[注)] 注）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 錠中アロプリノール　50mg 含有 錠 100mg：1 錠中アロプリノール 100mg 含有		
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・販売開始年月日		50mg	100 mg
	製造販売承認	2013 年　7 月 22 日	2013 年　7 月 22 日
	薬価基準収載	2023 年　8 月 30 日	2023 年　8 月 30 日
	販売開始	2011 年 11 月 28 日	1998 年　7 月 10 日
開発・製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元：日医工岐阜工場株式会社 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　https://www.nichiiko.co.jp/		

本 IF は 2026 年 2 月改訂（第 2 版）の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要　―日本病院薬剤師会―

（2020 年 4 月改訂）

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

２．IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

３．IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目　　次

Ⅰ．概要に関する項目……1

1．開発の経緯……1
2．製品の治療学的特性……1
3．製品の製剤学的特性……1
4．適正使用に関して周知すべき特性……2
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項……2
6．RMP の概要……2

Ⅱ．名称に関する項目……3

1．販売名……3
2．一般名……3
3．構造式又は示性式……3
4．分子式及び分子量……3
5．化学名（命名法）又は本質……3
6．慣用名、別名、略号、記号番号……3

Ⅲ．有効成分に関する項目……4

1．物理化学的性質……4
2．有効成分の各種条件下における安定性……4
3．有効成分の確認試験法、定量法……4

Ⅳ．製剤に関する項目……5

1．剤形……5
2．製剤の組成……5
3．添付溶解液の組成及び容量……6
4．力価……6
5．混入する可能性のある夾雑物……6
6．製剤の各種条件下における安定性……6
7．調製法及び溶解後の安定性……9
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）……9
9．溶出性……9
10．容器・包装……11
11．別途提供される資材類……11
12．その他……11

Ⅴ．治療に関する項目……12

1．効能又は効果……12
2．効能又は効果に関連する注意……12
3．用法及び用量……12
4．用法及び用量に関連する注意……12
5．臨床成績……12

Ⅵ．薬効薬理に関する項目……13

1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群……13
2．薬理作用……13

Ⅶ．薬物動態に関する項目……14

1．血中濃度の推移……14
2．薬物速度論的パラメータ……15
3．母集団（ポピュレーション）解析……16
4．吸収……16
5．分布……16
6．代謝……16
7．排泄……17
8．トランスポーターに関する情報……17
9．透析等による除去率……17
10．特定の背景を有する患者……17
11．その他……17

Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目……18

1．警告内容とその理由……18
2．禁忌内容とその理由……18
3．効能又は効果に関連する注意とその理由……18
4．用法及び用量に関連する注意とその理由……18
5．重要な基本的注意とその理由……18
6．特定の背景を有する患者に関する注意……18
7．相互作用……19
8．副作用……20
9．臨床検査結果に及ぼす影響……22
10．過量投与……22
11．適用上の注意……22
12．その他の注意……22

Ⅸ．非臨床試験に関する項目……23

1．薬理試験……23
2．毒性試験……23

Ⅹ．管理的事項に関する項目……24

1．規制区分……24
2．有効期間……24
3．包装状態での貯法……24
4．取扱い上の注意点……24
5．患者向け資材……24

６．同一成分・同効薬 24
７．国際誕生年月日 24
８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 24
９．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 24
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 25
11．再審査期間 25
12．投薬期間制限に関する情報 25
13．各種コード 25
14．保険給付上の注意 25

ＸＩ．文献 26

１．引用文献 26
２．その他の参考文献 26

ＸⅡ．参考資料 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 29

ＸⅢ．備考 30

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 30
２．その他の関連資料 32

略 語 表

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
Tmax	最高血中濃度到達時間
$T_{1/2}$	消失半減期
SD	標準偏差

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

本剤は、アロプリノールを有効成分とする高尿酸血症治療剤である。

「プロデック錠」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）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、1998 年 2 月に承認を取得し、1998 年 7 月 10 日に販売を開始した。（薬発第 698 号（昭和 55 年 5 月 30 日）に基づき承認申請）

1999 年 10 月 7 日、再評価（品質再評価）の結果、薬事法第 14 条第 2 項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの再評価結果を得た。

2006 年 6 月 27 日に販売名を「プロデック錠」から「プロデック錠 100mg」に変更の承認を得て、2006 年 12 月 8 日に薬価収載された。

「プロデック錠 50mg」は、武田テバファーマ株式会社（旧興和テバ株式会社）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、2011 年 7 月 15 日に承認を取得し、2011 年 11 月 28 日に販売を開始した。（薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき承認申請）

医療事故防止のため、2013 年 7 月 22 日に販売名を「プロデック錠 50mg」及び「プロデック錠 100mg」から「アロプリノール錠 50mg「テバ」」及び「アロプリノール錠 100mg「テバ」」に変更の承認を得て、2013 年 12 月 13 日に薬価収載された。

2023 年 8 月 1 日、「アロプリノール錠 50mg「テバ」」及び「アロプリノール錠 100mg「テバ」」は武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「テバ」から「NIG」に変更した。
2023 年 8 月 30 日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

２．製品の治療学的特性

（１）本剤は、アロプリノールを有効成分とする高尿酸血症治療剤である。
（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）、剥脱性皮膚炎等の重篤な皮膚障害、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。
（「Ⅷ．8．（1）重大な副作用と初期症状」の項参照）

３．製品の製剤学的特性

特になし

４．適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、 最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

（１）承認条件

該当しない

（２）流通・使用上の制限事項

該当しない

６．RMP の概要

該当しない

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「NIG」

アロプリノール錠 100mg「NIG」

（２）洋名

Allopurinol Tablets

（３）名称の由来

一般名より

２．一般名

（１）和名（命名法）

アロプリノール（JAN）

（２）洋名（命名法）

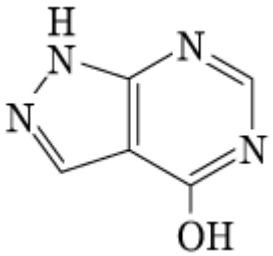
Allopurinol（JAN、INN）

（３）ステム（stem）

不明

３．構造式又は示性式

化学構造式：



４．分子式及び分子量

分子式：$C_5H_4N_4O$

分子量：136.11

５．化学名（命名法）又は本質

化学名：1*H*-Pyrazolo[3,4-*d*]pyrimidin-4-ol（IUPAC）

６．慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

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、定量法

（１）確認試験法

１）紫外可視吸光度測定法

本品の水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。

２）赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤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。

（２）定量法

電位差滴定法

本品を *N,N*-ジメチルホルムアミドに溶かし、テトラメチルアンモニウムヒドロキシド液で滴定する。

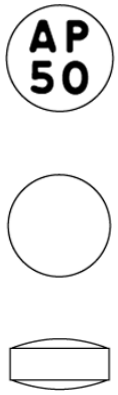
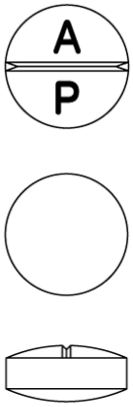
Ⅳ．製剤に関する項目

１．剤形

（１）剤形の区別

フィルムコーティング錠

（２）製剤の外観及び性状

販売名	アロプリノール錠 50mg「NIG」	アロプリノール錠 100mg「NIG」
色・剤形	白色のフィルムコーティング錠	白色の片面 1/2 割線入り フィルムコーティング錠
外形		
直径	6.1mm	8.1mm
厚さ	3.1mm	3.7mm
質量	99.5mg	200mg
識別コード （PTP）	t AP50	t AP

（３）識別コード

（「Ⅳ．1.（2）製剤の外観及び性状」の項参照）

（４）製剤の物性

（「Ⅳ．6．製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

（５）その他

該当しない

２．製剤の組成

（１）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	アロプリノール錠 50mg「NIG」	アロプリノール錠 100mg「NIG」
有効成分	1 錠中：アロプリノール　50mg	1 錠中：アロプリノール　100mg
添加剤	カルナウバロウ、クロスポビドン、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、デンプングリコール酸ナトリウム、ヒプロメロース、ポビドン、マクロゴール 400、マクロゴール 6000、D-マンニトール	クロスポビドン、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、デンプングリコール酸ナトリウム、ヒプロメロース、ポビドン、マクロゴール 400、マクロゴール 6000、D-マンニトール

（２）電解質等の濃度

該当資料なし

（３）熱量

該当資料なし

３．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

４．力価

該当しない

５．混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

６．製剤の各種条件下における安定性 1)

（１）加速試験

◇アロプリノール錠 50mg「NIG」　加速試験　40℃・75%RH　［最終包装形態（PTP 包装）］

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	6 ヵ月
性状　n=3※1 ＜白色のフィルムコーティング錠＞	適合	適合
確認試験　n=3※1 (紫外可視吸収スペクトル、 薄層クロマトグラフィー)	適合	適合
含量均一性 n=3※1 ＜判定値が 15.0%を超えない＞	適合	適合
溶出性（%）　n=3※1 ＜30 分、80%以上＞	91～103	93～98
含量（%）　n=3※1 ＜93.0～107.0%＞	99.9±0.6※2	100.7±1.2※2

※1：3 ロット　各ロット n=3

※2：平均値±標準偏差（SD）

◇アロプリノール錠 100mg「NIG」　加速試験　40℃・75%RH　［最終包装形態（PTP 包装）］

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 ヵ月	4 ヵ月	6 ヵ月
性状 ＜白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠＞	C5131 C5132 C5133	適合	適合	適合	適合
崩壊試験（分）	C5131 C5132 C5133	7～9	7～9	7～9	7～9
含量（%）※1 ＜93.0～107.0%＞	C5131 C5132 C5133	100.2±0.5※2	100.2±0.7※2	100.7±0.5※2	100.0±0.4※2

※1：表示量に対する含有率（%）

※2：平均値±標準偏差（SD）

（2）無包装状態の安定性

◇アロプリノール錠 50mg「NIG」　無包装　40℃［遮光・気密容器］

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヵ月
性状 ＜白色のフィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性（%） ＜30 分、80%以上＞	95～96	98
残存率（%）	100	99.6
（参考値）硬度（kg）	12.7	13.4

◇アロプリノール錠 50mg「NIG」　無包装　25℃・75%RH［遮光・開放］

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3 ヵ月
性状 ＜白色のフィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性（%） ＜30 分、80%以上＞	95～96	88～95
残存率（%）	100	103.3
（参考値）硬度（kg）	12.7	9.6

◇アロプリノール錠 50mg「NIG」　無包装　25℃・曝光量 60 万 Lx･hr［気密容器］

試験項目 ＜規格＞	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx･hr
性状 ＜白色のフィルムコーティング錠＞	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
溶出性（%） ＜30 分、80%以上＞	95～96	89～93
残存率（%）	100	100.2
（参考値）硬度（kg）	12.7	12.6

◇アロプリノール錠 100mg「NIG」　無包装　40℃［遮光・気密容器］

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間	
		開始時	3 ヵ月
性状 ＜白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠＞	243401	白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠	白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠
溶出性（%） ＜30 分、80%以上＞	243401	91.5～94.2	95.1～100.3
残存率（%）	243401	100	100.1
（参考値）硬度（kg）	243401	10.1	13.7

◇アロプリノール錠 100mg「NIG」　無包装　25℃・75%RH［遮光・開放］

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間	
		開始時	3 ヵ月
性状 ＜白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠＞	243401	白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠	白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠
溶出性（%） ＜30 分、80%以上＞	243401	91.5～94.2	92.0～95.1
残存率（%）	243401	100	100.1
（参考値）硬度（kg）	243401	10.1	5.9

◇アロプリノール錠 100mg「NIG」　無包装　曝光量 60 万 Lx･hr［気密容器］

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx･hr
性状 ＜白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠＞	243401	白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠	白色の片面 1/2 割線入りの フィルムコーティング錠
溶出性（%） ＜30 分、80%以上＞	243401	91.5～94.2	90.7～93.6
残存率（%）	243401	100	99.8
（参考値）硬度（kg）	243401	10.1	9.3

７．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

８．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

９．溶出性

（１）溶出規格

アロプリノール錠 50mg「NIG」及びアロプリノール錠 100mg「NIG」は、日本薬局方医薬品各条に定められたメキタジン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

（試験液に水 900mL を用い、パドル法により、50rpm で試験を行う）

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
50mg、100mg	30 分	80%以上

（２）溶出試験 [2)]

＜アロプリノール錠 50mg「NIG」＞

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 18 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 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、pH5.0、pH6.8、水）、100rpm（pH5.0）

［判定］

・pH1.2（50rpm）では、f2 関数の値が 42 以上であった。

・pH5.0（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

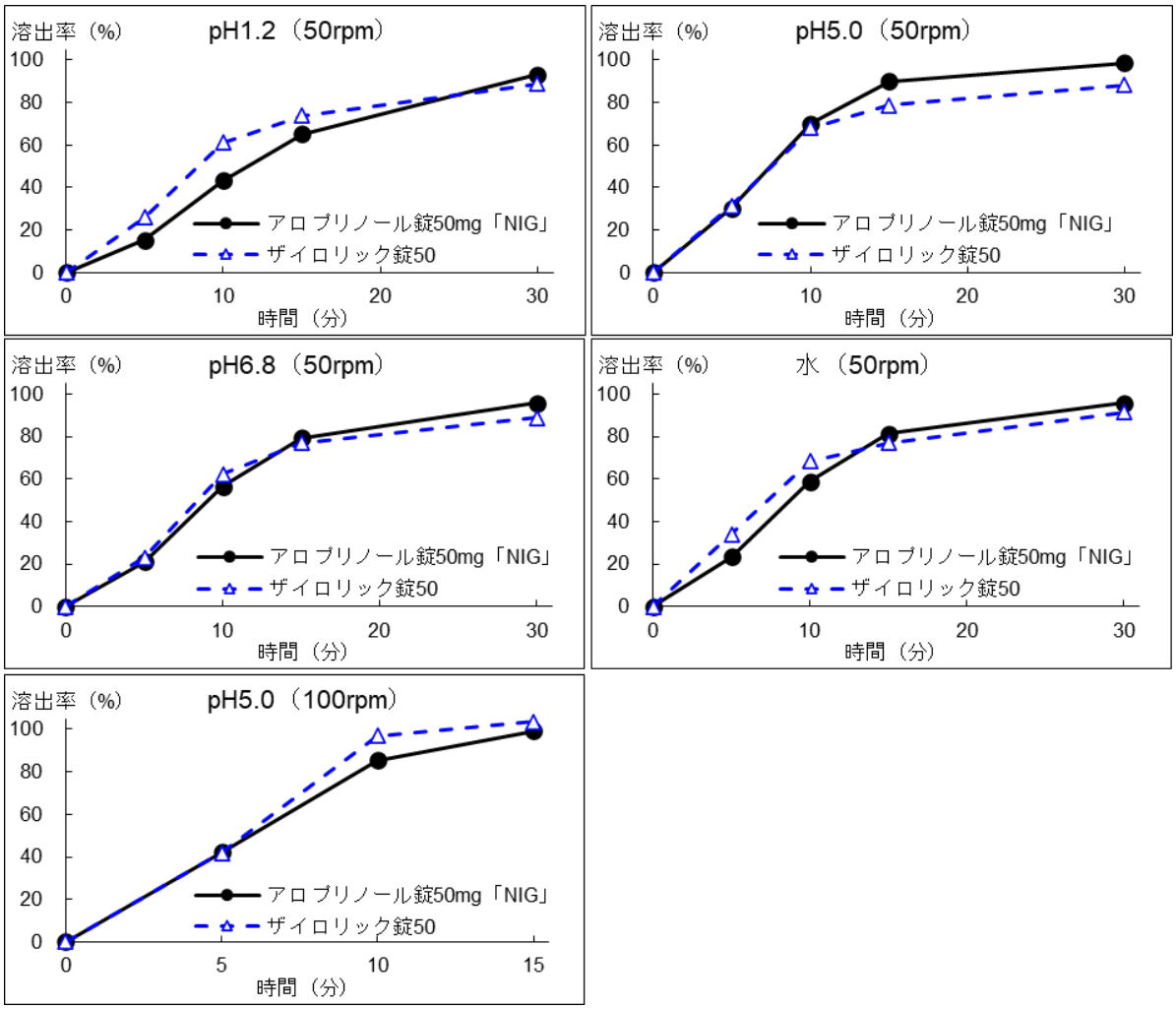
・pH6.8（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

・水（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

・pH5.0（100rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（ザイロリック錠50）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）

＜アロプリノール錠 100mg「NIG」＞

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日　医薬審第 487 号別添）

試験条件

装置：日本薬局方　溶出試験法　パドル法

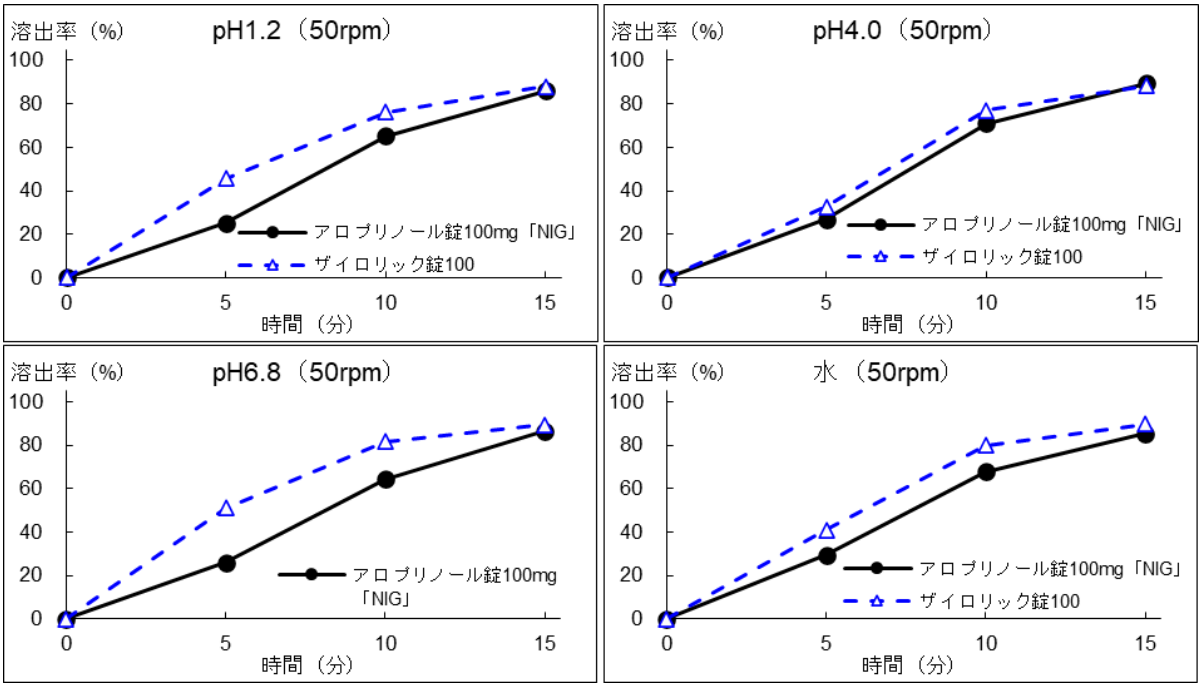
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）

［判定］

・pH1.2（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
・pH4.0（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
・pH6.8（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
・水（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（ザイロリック錠 100）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=6）

10. 容器・包装

（１）注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

（２）包装

＜アロプリノール錠 50mg「NIG」＞

100 錠［10 錠（PTP）×10］

＜アロプリノール錠 100mg「NIG」＞

100 錠［10 錠（PTP）×10］

1000 錠［10 錠（PTP）×100］

（３）予備容量

該当しない

（４）容器の材質

販売名	PTP 包装
アロプリノール錠 50mg「NIG」	PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔 ピロー：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム
アロプリノール錠 100mg「NIG」	PTP：ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当記載事項なし

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．効能又は効果に関連する注意

設定されていない

３．用法及び用量

（１）用法及び用量の解説

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。

（２）用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

４．用法及び用量に関連する注意

7.用法及び用量に関連する注意

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。［8.3 参照］

５．臨床成績

（１）臨床データパッケージ

該当資料なし

（２）臨床薬理試験

該当資料なし

（３）用量反応探索試験

該当資料なし

（４）検証的試験

１）有効性検証試験

該当資料なし

２）安全性試験

該当資料なし

（５）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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

（７）その他

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

高尿酸血症治療剤、尿酸生成阻止薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

２．薬理作用

（１）作用部位・作用機序

アロプリノールは、キサンチンオキシダーゼに対して、ヒポキサンチン及びキサンチンと拮抗することによって尿酸の生合成を抑制し、その結果血中尿酸値及び尿中尿酸値を低下させる[3)-6)]。

また、アロプリノールの主代謝物であるオキシプリノールもキサンチンオキシダーゼ抑制作用を有する[7)]。［10. 参照］

（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

（１）治療上有効な血中濃度

該当資料なし

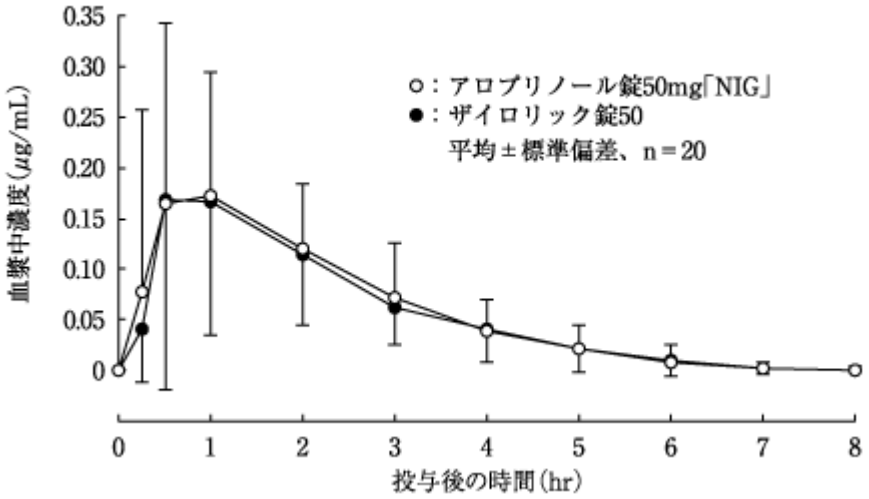
（２）臨床試験で確認された血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

＜アロプリノール錠 50mg「NIG」＞

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 18 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 号）

アロプリノール錠 50mg「NIG」とザイロリック錠 50 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）～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 [8]。



薬物動態パラメータ

	投与量 （mg）	$AUC_{0\text{-}8}$ （μg・hr/mL）	Cmax （μg/mL）	Tmax （hr）	$T_{1/2}$ （hr）
アロプリノール 錠 50mg「NIG」	50	0.4727 ±0.2439	0.2766 ±0.1710	1.29 ±0.94	1.09 ±0.43
ザイロリック錠 50	50	0.4496 ±0.2162	0.2648 ±0.1367	1.26 ±1.00	1.18 ±0.39

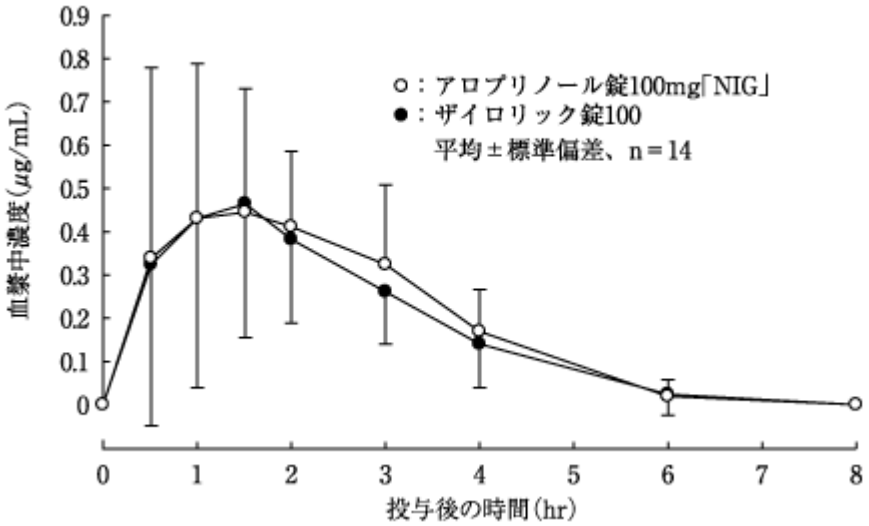
（平均±標準偏差、n=20）

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。

＜アロプリノール錠 100mg「NIG」＞

医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱い等について（昭和 55 年 5 月 30 日薬審第 718 号）

アロプリノール錠 100mg「NIG」とザイロリック錠 100 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 100mg）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）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された[8)]。



薬物動態パラメータ

	投与量 （mg）	$AUC_{0\text{-}8}$ （μg・hr/mL）	Cmax （μg/mL）	Tmax （hr）	$T_{1/2}$ （hr）
アロプリノール 錠 100mg「NIG」	100	1.54 ±0.80	0.68 ±0.27	1.6 ±0.9	1.01 ±0.39
ザイロリック錠 100	100	1.42 ±0.62	0.68 ±0.31	1.7 ±1.0	1.10 ±0.23

（平均±標準偏差、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。

（３）中毒域

該当資料なし

（４）食事・併用薬の影響

（「Ⅷ．7．相互作用」の項参照）

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）消失速度定数

該当資料なし

（４）クリアランス

該当資料なし

（５）分布容積

該当資料なし

（６）その他

該当資料なし

３．母集団（ポピュレーション）解析

（１）解析方法

該当資料なし

（２）パラメータ変動要因

該当資料なし

４．吸収

該当資料なし

５．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．6.（5）妊婦」の項参照）

（３）乳汁への移行性

（「Ⅷ．6.（6）授乳婦」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

（６）血漿蛋白結合率

該当資料なし

６．代謝

（１）代謝部位及び代謝経路

アロプリノールはキサンチンオキシダーゼにより酸化されて、大部分がオキシプリノールとなる[9)]。

（２）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

（「Ⅶ．6.（1）代謝部位及び代謝経路」の項参照）

（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活性比、存在比率

本剤はキサンチンオキシダーゼを阻害する。［18.1 参照］

（（「Ⅵ．2.（1）作用部位・作用機序」の項参照）

７．排泄

患者に ^{14}C-アロプリノール 169mg [注)] を単回経口投与した時、一部は未変化体のまま尿中に排泄され、残りの大部分はオキシプリノールに代謝されて、48 時間で投与量の約 40%が尿中に排泄された。また、投与量の 20%が未吸収のまま 48 時間で糞便中に排泄された [10)]（外国人データ）。

注）本剤の承認用量は、1 日 200～300mg を 2～3 回に分けて食後投与である。

８．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

９．透析等による除去率

該当資料なし

10．特定の背景を有する患者

該当資料なし

11．その他

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

設定されていない

２．禁忌内容とその理由

2.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注意とその理由

設定されていない

４．用法及び用量に関連する注意とその理由

（「Ⅴ．4．用法及び用量に関連する注意」を参照すること。）

５．重要な基本的注意とその理由

8.重要な基本的注意

8.1 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。［11.1.1、11.1.2、15.1.3 参照］

8.2 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。

8.3 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。［7. 参照］

8.4 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。

６．特定の背景を有する患者に関する注意

（１）合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

（２）腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

投与量の減量や投与間隔の延長を考慮すること。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。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。

（３）肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 肝疾患を有する患者又はその既往歴のある患者

定期的に肝機能検査を実施すること。肝障害が発現又は増悪するおそれがある。

（４）生殖能を有する者

設定されていない

（５）妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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[11)]。

（６）授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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。

（７）小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

（８）高齢者

9.8 高齢者

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。本剤の主代謝物は主として腎から排泄される。高齢者では腎機能が低下していることが多い。

７．相互作用

10.相互作用

本剤はキサンチンオキシダーゼを阻害する。［18.1 参照］

（１）併用禁忌とその理由

設定されていない

（２）併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）

次の医薬品の代謝又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
メルカプトプリン水和物 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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
シクロホスファミド水和物	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。	本剤又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、又は、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。

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。
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、本剤又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

11.副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

（１）重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 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（いずれも頻度不明）

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。［8.1、15.1.3 参照］

11.1.2 薬剤性過敏症症候群（頻度不明）

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[12)]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。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。［8.1 参照］

11.1.3 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

11.1.4 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少（いずれも頻度不明）

11.1.5 劇症肝炎等の重篤な肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

11.1.6 腎不全、腎不全の増悪、間質性腎炎を含む腎障害（いずれも頻度不明）

11.1.7 間質性肺炎（頻度不明）

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 線等の検査を実施すること。

11.1.8 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK 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ることがある。

11.1.9 無菌性髄膜炎（頻度不明）

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。

（２）その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	発疹		瘙痒、関節痛
血液		貧血	白血球減少、紫斑、好酸球増多、リンパ節症
腎臓			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 上昇、味覚障害、女性化乳房、末梢神経障害

９．臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14.適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

12. その他の注意

（１）臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 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。

15.1.2 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[13)]。

15.1.3 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[14)]。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[15)、16)]。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。［8.1、11.1.1 参照］

（解説）

15.1.1

尿量を多くして結石の形成を予防するためにできるだけ水分を多くとるように指導する。

（２）非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

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。

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」の項参照）

（２）安全性薬理試験

該当資料なし

（３）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）遺伝毒性試験

該当資料なし

（４）がん原性試験

該当資料なし

（５）生殖発生毒性試験

該当資料なし

（６）局所刺激性試験

該当資料なし

（７）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「NIG」 アロプリノール錠 100mg「NIG」	処方箋医薬品[注)] 注）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	劇薬[注1)]

注 1）1 錠中 0.1g 以下を含有するものは劇薬とはならない。

２．有効期間

有効期間：3 年

３．包装状態での貯法

室温保存

４．取扱い上の注意点

設定されていない

５．患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：有（「ⅩⅢ．2．その他の関連資料」の項参照）

６．同一成分・同効薬

同一成分：ザイロリック錠 50、ザイロリック錠 100

７．国際誕生年月日

不明

８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

＜アロプリノール錠 50mg「NIG」＞

履歴	販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
販売開始	プロデック錠 50mg	2011 年 7 月 15 日	22300AMX00727000	2011 年 11 月 28 日	2011 年 11 月 28 日
販売名変更	アロプリノール錠 50mg「テバ」	2013 年 7 月 22 日	22500AMX01312000	2013 年 12 月 13 日	2013 年 12 月 13 日
承継	アロプリノール錠 50mg「NIG」	〃	〃	2023 年 8 月 30 日	2023 年 8 月 30 日

＜アロプリノール錠 100mg「NIG」＞

履歴	販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
販売開始	プロデック錠	1998 年 2 月 1 日	21000AMZ00268000	1998 年 7 月 10 日	1998 年 7 月 10 日
販売名変更	プロデック錠 100mg	2006 年 6 月 27 日	21800AMX10483000	2006 年 12 月 8 日	2006 年 12 月 8 日
販売名変更	アロプリノール錠 100mg「テバ」	2013 年 7 月 22 日	22500AMX01311000	2013 年 12 月 13 日	2013 年 12 月 13 日
承継	アロプリノール錠 100mg「NIG」	〃	〃	2023 年 8 月 30 日	2023 年 8 月 30 日

９．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

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

＜再評価（品質再評価）＞

公表年月日：1999 年 10 月 7 日

販売名：プロデック錠

内容：薬事法第 14 条第 2 項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJ コード）	HOT（9 桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
アロプリノール錠 50mg「NIG」	3943001F2019	3943001F2388	121031604	622103103
アロプリノール錠 100mg「NIG」	3943001F1012	3943001F1730	108562449	620856248

14. 保険給付上の注意

アロプリノール錠 50mg「NIG」は、診療報酬上の後発医薬品に該当しない。

アロプリノール錠 100mg「NIG」は、診療報酬上の後発医薬品である。

ＸＩ．文献

１．引用文献

1）　社内資料：安定性試験
2）　社内資料：溶出試験
3）　Elion GB：Ann Rheum Dis. 1966；25：608-614（PMID：5958693）
4）　伊佐真之ほか：日本薬理学雑誌. 1968；64：108-122
5）　Rundles RW, et al.：Trans Assoc Am Physicians. 1963；76：126-140
6）　大島良雄ほか：リウマチ. 1968；8：349-370
7）　Rundles RW：Ann Rheum Dis. 1966；25：615-620（PMID：5226510）
8）　社内資料：生物学的同等性試験
9）　Elion GB, et al.：Am J Med. 1968；45：69-77
10）Elion GB, et al.：Biochem Pharmacol. 1966；15：863-880（PMID：5967902）
11）Fujii T, et al.：Jpn J Pharmacol. 1972；22：201-206（PMID：4538410）
12）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
13）Garbe E, et al.：Arch Ophthalmol. 1998；116：1652-1656（PMID：9869797）
14）Hung SI, et al.：Proc Natl Acad Sci USA. 2005；102：4134-4139（PMID：15743917）
15）Kaniwa N, et al.：Pharmacogenomics. 2008；9：1617-1622（PMID：19018717）
16）Lonjou C, et al.：Pharmacogenetics and Genomics. 2008；18：99-107

２．その他の参考文献

該当資料なし

ＸⅡ．参考資料

１．主な外国での発売状況

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

効能又は効果	用法及び用量
下記の場合における高尿酸血症の是正： 痛風、高尿酸血症をともなう高血圧症	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。年令・症状により適宜増減する。

＜DailyMed（USA）、2023 年 7 月検索＞

国　名	米国
会社名	Actavis Pharma, Inc.
販売名	ALLOPURINOL tablet
剤形・規格	tablet；100mg、300 mg

INDICATIONS AND USAGE

THIS IS NOT AN INNOCUOUS DRUG. IT IS NOT RECOMMENDED FOR THE TREATMENT OF ASYMPTOMATIC HYPERURICEMIA.

Allopurinol reduces serum and urinary uric acid concentrations. Its use should be individualized for each patient and requires an understanding of its mode of action and pharmacokinetics .

Allopurinol is indicated in:
the management of patients with signs and symptoms of primary or secondary gout (acute attacks, tophi, joint destruction, uric acid lithiasis, and/or nephropathy).

the management of patients with leukemia, lymphoma and malignancies who are receiving cancer therapy which causes elevations of serum and urinary uric acid levels. Treatment with allopurinol should be discontinued when the potential for overproduction of uric acid is no longer present.

the management of patients with recurrent calcium oxalate calculi whose daily uric acid excretion exceeds 800 mg/day in male patients and 750 mg/day in female patients. Therapy in such patients should be carefully assessed initially and reassessed periodically to determine in each case that treatment is beneficial and that the benefits outweigh the risks.

DOSAGE AND ADMINISTRATION

The dosage of allopurinol to accomplish full control of gout and to lower serum uric acid to normal or near-normal levels varies with the severity of the disease. The average is 200 to 300 mg/day for patients with mild gout and 400 to 600 mg/day for those with moderately severe tophaceous gout. The appropriate dosage may be administered in divided doses or as a single equivalent dose with the 300 mg tablet. Dosage requirements in excess of 300 mg should be administered in divided doses. The minimal effective dosage is 100 to 200 mg daily and the maximal recommended dosage is 800 mg daily. To reduce the possibility of flare-up of acute gouty attacks, it is recommended that the patient start with a low dose of allopurinol (100 mg daily) and increase at weekly intervals by 100 mg until a serum uric acid level of 6 mg/dL or less is attained but without exceeding the maximal recommended dosage.

Normal serum urate levels are usually achieved in 1 to 3 weeks. The upper limit of normal is about 7 mg/dL for men and postmenopausal women and 6 mg/dL for premenopausal women. Too much reliance should not be placed on a single serum uric acid determination since, for technical reasons, estimation of uric acid may be difficult. By selecting the appropriate dosage and, in certain patients, using uricosuric agents concurrently, it is possible to reduce serum uric acid to normal or, if desired, to as low as 2 to 3 mg/dL and keep it there indefinitely.

While adjusting the dosage of allopurinol in patients who are being treated with colchicine and/or anti-inflammatory agents, it is wise to continue the latter therapy until serum uric acid has been normalized and there has been freedom from acute gouty attacks for several months.

In transferring a patient from a uricosuric agent to allopurinol, the dose of the uricosuric agent should be gradually reduced over a period of several weeks and the dose of allopurinol gradually increased to the required dose needed to maintain a normal serum uric acid level.

It should also be noted that allopurinol is generally better tolerated if taken following meals. A fluid intake sufficient to yield a daily urinary output of at least 2 liters and the maintenance of a neutral or preferably, slightly alkaline urine are desirable.

Since allopurinol and its metabolites are primarily eliminated only by the kidney, accumulation of the drug can occur in renal failure, and the dose of allopurinol should consequently be reduced. With a creatinine clearance of 10 to 20 mL/min, a daily dosage of 200 mg of allopurinol is suitable. When the creatinine clearance is less than 10 mL/min, the daily dosage should not exceed 100 mg. With extreme renal impairment (creatinine clearance less than 3 mL/min) the interval between doses may also need to be lengthened.

The correct size and frequency of dosage for maintaining the serum uric acid just within the normal range is best determined by using the serum uric acid level as an index.

For the prevention of uric acid nephropathy during the vigorous therapy of neoplastic disease, treatment with 600 to 800 mg daily for 2 or 3 days is advisable together with a high fluid intake. Otherwise similar considerations to the above recommendations for treating patients with gout govern the regulation of dosage for maintenance purposes in secondary hyperuricemia.

The dose of allopurinol recommended for management of recurrent calcium oxalate stones in hyperuricosuric patients is 200 to 300 mg/day in divided doses or as the single equivalent. This dose may be adjusted up or down depending upon the resultant control of the hyperuricosuria based upon subsequent 24 hour urinary urate determinations. Clinical experience suggests that patients with recurrent calcium oxalate stones may also benefit from dietary changes such as the reduction of animal protein, sodium, refined sugars, oxalate-rich foods, and excessive calcium intake, as well as an increase in oral fluids and dietary fiber.

Children, 6 to 10 years of age, with secondary hyperuricemia associated with malignancies may be given 300 mg allopurinol daily while those under 6 years are generally given 150 mg daily. The response is evaluated after approximately 48 hours of therapy and a dosage adjustment is made if necessary.

２．海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。

（「Ⅷ．6．特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

	Drug Name	Category
オーストラリアの分類	allopurinol	B2

（2021 年 4 月検索）

参考：分類の概要

オーストラリアの分類（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

Category B2：

Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals are inadequate or may be lacking, but available data show no evidence of an increased occurrence of fetal damage.

ⅩⅢ．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）粉砕

粉砕物の安定性試験

アロプリノール錠 50mg「NIG」

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時白色のフィルム片を含む白色の粉末であり、4 週間後白色のフィルム片を含む白色の粉末で、一部塊があった。含量は規格内であった。60 万 Lx･hr の保存条件で検討した結果、性状は白色のフィルム片を含む白色の粉末で、含量は規格内であった。

検体作成方法：試験製剤を乳鉢で粉砕した。
試験報告日：2011/8/8

● 粉砕物　25℃・75%RH［遮光・開放］

（最小値～最大値）

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間	
		開始時	4 週
性状　n=3	AF0553	白色のフィルム片を含む 白色の粉末	白色のフィルム片を含む 白色の粉末一部塊※2
含量（%）※1　n=3 ＜93.0～107.0%＞	AF0553	98.96～99.46	98.09～98.62

※1：表示量に対する含有率（%）
※2：塊は軽く押すことで容易に粉末となった

● 粉砕物　曝光量 60 万 Lx･hr［気密容器］

（最小値～最大値）

試験項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量	
		開始時	60 万 Lx･hr
性状　n=3	AF0553	白色のフィルム片を含む 白色の粉末	白色のフィルム片を含む 白色の粉末
含量（%）※　n=3 ＜93.0～107.0%＞	AF0553	98.96～99.46	98.17～98.80

※：表示量に対する含有率（%）

アロプリノール錠 100mg「NIG」

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH 保存条件で検討した結果、性状は開始時白色のフィルム片を含む白色の粉末であり、4 週後、白色のフィルム片を含む白色の粉末で、一部塊があった。

検体作成方法：試験製剤を乳鉢で粉砕した。

● 粉砕物　25℃・75%RH［遮光・開放］

試験項目	保存期間	
	開始時	4 週
性状　n=3	白色のフィルム片を含む白色の粉末	白色のフィルム片を含む白色の粉末一部塊※
残存率（%）　n=3	100	98.1

※：塊は軽く押すことで容易に粉末となった

（２）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

アロプリノール錠 50mg「NIG」

１）試験方法

［崩壊懸濁試験］

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。充分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で充分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

［通過性試験］

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

試験実施日：2011/8/4

ロット番号：AF0553

２）試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
アロプリノール錠 50mg「NIG」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（(株) じほう)」に準じて実施しました。

アロプリノール錠 100mg「NIG」

１）試験方法

［崩壊懸濁試験］

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体１個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約55℃の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。充分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で充分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体１個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

［通過性試験］

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐときのチューブ内の残存物の有無にて通過性を観察した。

試験実施日：2011/8/4

ロット番号：A70963

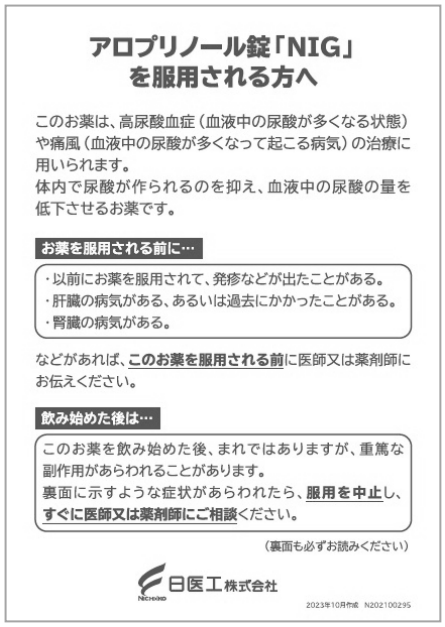
２）試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
アロプリノール錠 100mg「NIG」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（(株) じほう)」に準じて実施しました。

２．その他の関連資料

アロプリノール錠「NIG」を服用される方へ



アロプリノール錠「NIG」を服用される方へ

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。

お薬を服用される前に…

・以前にお薬を服用されて、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、**このお薬を服用される前**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。

（裏面も必ずお読みください）

日医工株式会社

2023年10月作成 N202100295