

**2014年11月改訂 (第6版)
*2012年10月改訂

日本標準商品分類番号
872149

| | |
|------|---------------|
| 貯 法 | 気密容器 |
| 使用期限 | 外箱、容器に使用期限を表示 |

| | 錠75 μ g | 錠150 μ g |
|------|------------------|------------------|
| 承認番号 | 21800AMX10658000 | 21800AMX10657000 |
| 薬価収載 | 2006年12月 | 2006年12月 |
| 販売開始 | 1978年6月 | 1970年7月 |

高血圧症治療剤

**処方箋医薬品^{注)}

カタプレス®錠75 μ g カタプレス®錠150 μ g Catapres® Tablets 75 μ g・Tablets 150 μ g

(クロニジン塩酸塩製剤)

®=登録商標

**注) 注意-医師等の処方箋により使用すること



【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

【組成・性状】

| 販売名 | カタプレス錠75 μ g | カタプレス錠150 μ g |
|-------|---|------------------------|
| 成分・含量 | 1錠中クロニジン塩酸塩 0.075mg | 1錠中クロニジン塩酸塩 0.150mg |
| 添加物 | 乳糖水和物、リン酸水素カルシウム水和物、トウモロコシデンプン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸、ポビドンK25 | |
| 剤形 | 白色の素錠(割線) | 白色の素錠(割線) |
| 外形 | | |
| 直径 | 6.0mm | 8.0mm |
| 厚さ | 2.3mm | 2.6mm |
| 重さ | 0.095g | 0.19g |
| 識別コード | 1C | 15C |

【効能・効果】

各種高血圧症(本態性高血圧症、腎性高血圧症)

【用法・用量】

カタプレス錠75 μ g: 通常1回1~2錠(クロニジン塩酸塩として0.075mg~0.150mg)を1日3回経口投与する。なお、症状により適宜増減する。重症の高血圧症には1回4錠を1日3回投与する。

カタプレス錠150 μ g: 通常1回1/2~1錠(クロニジン塩酸塩として0.075mg~0.150mg)を1日3回経口投与する。なお、症状により適宜増減する。重症の高血圧症には1回2錠を1日3回投与する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1)腎障害のある患者
[急激な降圧により腎機能を悪化させることがある。]
- (2)虚血性心疾患又は高血圧以外の原因による心不全のある患者
[急激な降圧により心機能を悪化させることがある。]
- (3)虚血性心疾患及びうっ血性心不全の既往歴のある患者
[急激な降圧により心機能を悪化させることがある。]
- (4)脳梗塞又は脳血管障害のある患者
[急激な降圧により症状を悪化させることがある。]
- (5)高度の徐脈(著しい洞性徐脈)のある患者
[症状を悪化させることがある。]
- (6)発熱患者
[血圧、心機能等に著明な変化を来すおそれがある。]
- (7)高齢者
「高齢者への投与」の項参照

2. 重要な基本的注意

- (1)ときに起立性低血圧があらわれることがあるので、臥位のみならず、立位又は坐位で血圧測定を行い、体位変換による血圧変化を考慮し、坐位にて血圧をコントロールすること。
- (2)本剤を投与している患者で急に投与を中止すると、まれに血圧の上昇、神経過敏、頻脈、不安感、頭痛等のリバウンド現象があらわれることがあるので、投与を中止しなければならない場合には、高血圧治療で、一般に行われているように、投与量を徐々に減らすこと。
- (3)鎮静作用により反射運動等が减弱されることがあるので、高所作業、自動車の運転等危険を伴う作業に注意させること。

3. 相互作用

【併用注意】(併用に注意すること)

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|------------------|--|--|
| 中枢神経抑制剤 アルコール | 鎮静作用が増強されることがある。 | 本剤との併用により相加的に鎮静作用が増強される。 |
| β 遮断剤 | 本剤の投与中止後のリバウンド現象が強められる可能性があるため、本剤の投与を中止する場合には、 β 遮断剤を先に中止し、数日間経過を観察した後、本剤の投与を中止すること。 | 本剤はノルエピネフリンの遊離を抑制するため、急激な中止により血中ノルエピネフリンの上昇が起こる。 β 遮断剤の併用時は、 β 受容体が遮断されているため、ノルエピネフリンの α 受容体刺激作用が増強され、血圧が急激に上昇する。 |

4. 副作用

国内調査症例8,074例(承認時及び再評価調査結果)中副作用が報告されたのは2,637件(32.66%)であった。主な副作用は口渇1,537件(19.04%)、眠気・鎮静492件(6.09%)、めまい320件(3.96%)、倦怠・脱力感81件(1.00%)等であった。また、臨床検査値においては特に一定の傾向を示す変動は認められていない。

(1)重大な副作用

- 幻覚:**まれに幻覚があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には、適切な処置を行うこと。
- 錯乱:**患者の状態に十分注意し、このような症状があらわれた場合には、適切な処置を行うこと。

(2)その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

| | 5%以上又は頻度不明 | 0.1~5%未満 | 0.1%未満 |
|-------------------|-------------|--------------------------|-------------|
| 精神神経系 | 眠気、鎮静作用、疲労感 | 不安、めまい、倦怠感 | 見当識障害 |
| 循環器 | 徐脈 | 起立性低血圧、蒼白・レイノー様症状 | |
| 消化器 | 口渇 | 悪心、食欲不振、下痢、便秘、心窩部膨満感、胸やけ | 腹痛 |
| 泌尿・生殖器 | | 陰萎 | |
| 過敏症 ^{注)} | | 発疹、痒痒 | |
| その他 | | 鼻閉、血管神経性浮腫 | 眼の乾燥、血糖値の上昇 |

注)発現した場合には、投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者では一般に過度の降圧は好ましくないとされている(脳梗塞等が起こるおそれがある)ので、低用量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

* 6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、本剤は胎盤を通過することが報告されている。]

(2)授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。

[ヒト母乳中へ移行することが報告されている。]

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

8. 過量投与

症状:

過量投与した場合、交感神経抑制によって一般的に認められる瞳孔収縮、嗜眠、徐脈、低血圧、低体温、昏睡、無呼吸等の症状が発現する。また、末梢の α_1 受容体の刺激による血圧上昇が起こる可能性もある。

処置:

注意深くモニタリングし、必要に応じて対症療法を行うこと。

9. 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。)

【薬物動態】

1. 吸収・代謝・排泄

高血圧症患者にクロニジン塩酸塩0.3mgを経口投与した場合、90分で最高血中濃度約1.3ng/mLに達する。血中濃度の半減期は約10時間である。¹⁾

一部は肝臓においてイミダゾリン環の開裂、フェニル環の水酸化を受けるが、大部分は未変化体である。²⁾健康成人にクロニジン塩酸塩を0.39mg又は1.44mg経口投与した場合、24時間後までに、尿中に約45%、96時間後までに、尿中に約65%また糞中に約22%が排泄される。³⁾

[参考:1,2,3)は外国人でのデータ]

2. 分布(参考)

クロニジン塩酸塩0.1mg/kgを経口投与した場合、消化管から吸収後、全組織に均等に分布し、吸収及び排泄に関係のある臓器以外に特定の臓器に集中する傾向は認められなかった(ラット³⁾)。

【臨床成績】

国内で実施された臨床試験の結果、承認された効能・効果に対する本剤の臨床効果が認められた。

【薬効薬理】

1. 血圧降下作用

脳幹部の α_2 受容体に選択的に作用して、交感神経緊張を抑制することにより、末梢血管を拡張させ血圧を降下させる(ネコ⁴⁾、イヌ⁵⁾)。

2. 臨床薬理

(1)血圧降下作用

高血圧症患者に経口投与した場合、有意な血圧降下作用が認められ、作用は30~60分で発現し、2~4時間で最大効果に達し、10時間以上持続する。⁵⁾

(2)末梢血管抵抗低下作用

高血圧症患者に長期投与した場合、末梢血管抵抗の低下が認められている。また、腎血管抵抗の低下に基づく腎血流量の増加傾向が認められている。^{6,7)}

(3)血漿レニン活性低下作用

高血圧症患者に経口投与した場合、立位、臥位共に血漿レニン活性の低下が認められている。⁷⁾特に血漿レニン活性の高い高血圧症患者での血漿レニン活性の低下が著明である。⁸⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

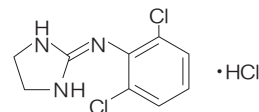
一般名:クロニジン塩酸塩(JAN)

Clonidine Hydrochloride(JAN)

Clonidine(INN)

化学名:2-(2,6-Dichlorophenylimino)imidazolidine monohydrochloride

化学構造式:



分子式: $C_9H_9Cl_2N_3 \cdot HCl$

分子量: 266.55

性状:

- ・白色の結晶又は結晶性の粉末である。
 - ・メタノールに溶けやすく、水又はエタノール(95)にやや溶けやすく、酢酸(100)に溶けにくく、無水酢酸又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。
 - ・本品1.0gを水20mLに溶かした液のpHは4.0~5.5である。
- 融点: 約310°C(分解)

【包装】

カタプレス錠75 μ g: 100錠(10錠 \times 10) PTP

カタプレス錠150 μ g: 100錠(10錠 \times 10) PTP

【主要文献】

- 1) Wing L M H et al: Eur J Clin Pharmacol 12: 463, 1977
- 2) Darda S et al: Arzneim-Forsch/Drug Res 28: 255, 1978
- 3) Rehbinder D et al: Arzneim-Forsch/Drug Res 19: 169, 1969
- 4) Kobinger W: Chest 83: 296, 1983
- 5) 大島研三ほか: 総合臨牀 19: 1237, 1970
- 6) Cohen I M et al: Clin Pharmacol Ther 26: 572, 1979
- 7) Morgan T: Chest 83: 383, 1983
- 8) 浜本 肇ほか: 臨牀と研究 54: 308, 1977

【文献請求先】

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社

DIセンター

〒141-6017 東京都品川区大崎2丁目1番1号

ThinkPark Tower

フリーダイヤル: 0120-189-779

(受付時間) 9:00~18:00

(土・日・祝日・弊社休業日を除く)

製造販売

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社
東京都品川区大崎2丁目1番1号

06-07 ①②

0876

011383-B