

高血圧症治療剤
クロニジン塩酸塩製剤
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[®]Tablets75 μ g・Tablets150 μ g



® = 登録商標

注) 注意 - 医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	カタプレス錠75 μ g	カタプレス錠150 μ g
有効成分	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
添加剤	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	

3.2 製剤の性状

販売名	カタプレス錠75 μ g	カタプレス錠150 μ g
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

4. 効能又は効果

各種高血圧症(本態性高血圧症、腎性高血圧症)

6. 用法及び用量

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。

8. 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減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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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。9.1.2 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。9.1.3 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。9.1.4 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。

9.1.5 発熱のある患者

血圧、心機能等に著明な変化を来すおそれがある。

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 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。

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。本剤は胎盤を通過することが報告されている。

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。ヒト母乳中へ移行することが報告され、哺乳児に低血圧や眠気等の有害作用が認められている^{1,2)}。

9.7 小児等

小児等を対象とした国内臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

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。脳梗塞等が起こるおそれがあるため一般に過度の降圧は好ましくないとされている。

10. 相互作用

10.2 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。

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²⁾。

11.1 重大な副作用

11.1.1 幻覚（頻度不明）

11.1.2 錯乱（頻度不明）

11.2 その他の副作用

	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 (19.0%)	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		発疹、そう痒	
その他		鼻閉、血管神経性浮腫	眼の乾燥、血糖値の上昇

注)発現頻度は再評価調査結果を含む

13. 過量投与

13.1 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。

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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

高血圧症患者5例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(外国人のデータ)³⁾。

16.3 分布

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、吸収及び排泄に係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)⁴⁾。

16.4 代謝

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(外国人のデータ)⁵⁾。

16.5 排泄

健康成人にクロニジン塩酸塩を0.39mg又は1.44mgを経口投与した場合、24時間後までに尿中に約45%、96時間後までに尿中に約65%及び糞中に約22%が排泄される(外国人のデータ)⁴⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

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低下させる(ネコ、イヌ)⁶⁾

18.2 薬理作用

18.2.1 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⁷⁾。

18.2.2 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^{8,9)}。

18.2.3 血漿レニン活性低下作用

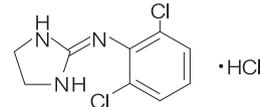
高血圧症患者に経口投与した場合、立位、臥位共に血漿レニン活性の低下が認められている⁹⁾。特に血漿レニン活性の高い高血圧症患者での血漿レニン活性の低下が著明である¹⁰⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：クロニジン塩酸塩(Clونidine Hydrochloride (JAN)、Clونidine (INN))(JAN)

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

化学構造式：



分子式：C₉H₉Cl₂N₃ · 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)

20. 取扱い上の注意

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

22. 包装

〈カタプレス錠 75 µg〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

〈カタプレス錠 150 µg〉

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

23. 主要文献

- 1) Hartikainen-Sorri AL et al. : Dept Obstet & Gynaecol & Paediat. 1987; 69(4): 598-600
- 2) Asher Ornoy: Pharm Res. 2018; 35: 46
- 3) Wing L M H et al. : Eur J Clin Pharmacol. 1977; 12: 463-469
- 4) Rehbinder D et al. : Arzneimittel-Forsch/Drug Res. 1969; 19: 169-176
- 5) Darda S et al. : Arzneimittel-Forsch/Drug Res. 1978; 28: 255-259
- 6) Kobinger W: Chest. 1983; 83: 296-299
- 7) 大島研三ほか: 総合臨牀. 1970; 19: 1237
- 8) Cohen I M et al. : Clin Pharmacol Ther. 1979; 26: 572-577
- 9) Morgan T: Chest. 1983; 83: 383-386
- 10) 浜本 肇ほか: 臨牀と研究. 1977; 54: 308-312

24. 文献請求先及び問い合わせ先

株式会社 Medical Parkland

カスタマーセンター

〒152-0035 東京都目黒区自由が丘3丁目2番17号202

0120-689-610

(受付時間) 9:00~17:00

(土・日・祝日・弊社休業日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

株式会社 Medical Parkland

東京都目黒区自由が丘3丁目2番17号202