

# 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 2008 に準拠して作成

高血圧症治療剤

**カタプレス®錠75 $\mu$ g**  
Catapres® Tablets 75 $\mu$ g**カタプレス®錠150 $\mu$ g**  
Catapres® Tablets 150 $\mu$ g

(クロニジン塩酸塩製剤)

® = 登録商標

|                                 |                                                                                                                                                     |                    |
|---------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------|
| 剤形                              | 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                           | カタプレス錠 75 $\mu$ g：1錠中クロニジン塩酸塩 0.075mg 含有<br>カタプレス錠 150 $\mu$ g：1錠中クロニジン塩酸塩 0.150mg 含有                                                               |                    |
| 一般名                             | 和名：クロニジン塩酸塩<br>洋名：Clonidine Hydrochloride                                                                                                           |                    |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載年月日<br>発売年月日 | カタプレス錠 75 $\mu$ g                                                                                                                                   | カタプレス錠 150 $\mu$ g |
|                                 | 2006 年 8 月 4 日                                                                                                                                      | 2006 年 8 月 4 日     |
|                                 | 2006 年 12 月 8 日                                                                                                                                     | 2006 年 12 月 8 日    |
|                                 | 1978 年 6 月 21 日                                                                                                                                     | 1970 年 7 月 10 日    |
| 開発・製造販売・<br>提携・販売会社名            | 株式会社 Medical Parkland                                                                                                                               |                    |
| 医薬情報担当者の連絡先                     |                                                                                                                                                     |                    |
| 問い合わせ窓口                         | 株式会社 Medical Parkland<br>カスタマーセンター TEL：0120-689-610<br>医療関係者向けホームページ<br><a href="http://www.medicalparkland.com">http://www.medicalparkland.com</a> |                    |

本 IF は 2022 年 5 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <http://www.info.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

## IF 利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

### 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、IF と略す）の位置付け並びに IF 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 IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、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 IF 記載要領が策定された。

### 2. IF とは

IF 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 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、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。

[IF 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。
- ②IF 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「IF 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。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF 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「IF 記載要領 2008」により作成された IF 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 (PDF) から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」(以下、「IF 記載要領 2008」と略す) は、平成 21 年 4 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、「IF 記載要領 2008」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 IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、PDF 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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の IF 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、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薬剤師等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、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、IF 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

IF 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。IF 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、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後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。

(2008 年 9 月)

# 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・製剤学的特性 .....     | 1 |
| II. 名称に関する項目 .....          | 2 |
| 1. 販 売 名 .....              | 2 |
| (1) 和 名 .....               | 2 |
| (2) 洋 名 .....               | 2 |
| (3) 名称の由来 .....             | 2 |
| 2. 一 般 名.....               | 2 |
| (1) 和 名 (命名法) .....         | 2 |
| (2) 洋 名 (命名法) .....         | 2 |
| (3) ステム .....               | 2 |
| 3. 構造式又は示性式 .....           | 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 |
| III. 有効成分に関する項目 .....       | 3 |
| 1. 物理化学的性質 .....            | 3 |
| (1) 外観・性状 .....             | 3 |
| (2) 溶 解 性 .....             | 3 |
| (3) 吸 湿 性 .....             | 3 |
| (4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点 ..... | 3 |
| (5) 酸塩基解離定数 .....           | 3 |
| (6) 分配係数 .....              | 3 |
| (7) その他の主な示性値 .....         | 3 |
| 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 .....         | 4 |
| 4. 有効成分の定量法 .....           | 4 |

|                                             |    |
|---------------------------------------------|----|
| IV. 製剤に関する項目 .....                          | 5  |
| 1. 剤    形 .....                             | 5  |
| (1) 剤形の区別, 規格及び性状 .....                     | 5  |
| (2) 製剤の物性 .....                             | 5  |
| (3) 識別コード .....                             | 5  |
| (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等 ..... | 5  |
| 2. 製剤の組成 .....                              | 5  |
| (1) 有効成分 (活性成分) の含量 .....                   | 5  |
| (2) 添 加 物 .....                             | 5  |
| (3) そ の 他 .....                             | 5  |
| 3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意 .....                  | 6  |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性 .....                    | 6  |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性 .....                       | 6  |
| 6. 他剤との配合変化 (物理化学的变化) .....                 | 6  |
| 7. 溶 出 性 .....                              | 6  |
| 8. 生物学的試験法 .....                            | 6  |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....                     | 7  |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法 .....                      | 7  |
| 11. 力        価 .....                        | 7  |
| 12. 混入する可能性のある夾雑物 .....                     | 7  |
| 13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 .....                 | 7  |
| 14. そ の 他 .....                             | 7  |
| V. 治療に関する項目 .....                           | 8  |
| 1. 効能又は効果 .....                             | 8  |
| 2. 用法及び用量 .....                             | 8  |
| 3. 臨 床 成 績 .....                            | 8  |
| (1) 臨床データパッケージ (2009 年 4 月以降承認品目) .....     | 8  |
| (2) 臨床効果 .....                              | 8  |
| (3) 臨床薬理試験: 忍容性試験 .....                     | 8  |
| (4) 探索的試験: 用量反応探索試験 .....                   | 8  |
| (5) 検証的試験 .....                             | 9  |
| (6) 治療的使用 .....                             | 9  |
| VI. 薬効薬理に関する項目 .....                        | 10 |
| 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 .....                 | 10 |
| 2. 薬 理 作 用 .....                            | 10 |
| (1) 作用部位・作用機序 .....                         | 10 |
| (2) 薬効を裏付ける試験成績 .....                       | 10 |
| (3) 作用発現時間・持続時間 .....                       | 10 |

|                                            |    |
|--------------------------------------------|----|
| VII. 薬物動態に関する項目 .....                      | 11 |
| 1. 血中濃度の推移・測定法 .....                       | 11 |
| (1) 治療上有効な血中濃度 .....                       | 11 |
| (2) 最高血中濃度到達時間 .....                       | 11 |
| (3) 臨床試験で確認された血中濃度 .....                   | 11 |
| (4) 中毒域 .....                              | 11 |
| (5) 食事・併用薬の影響 .....                        | 12 |
| (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 ..... | 12 |
| 2. 薬物速度論的パラメータ .....                       | 12 |
| (1) コンパートメントモデル .....                      | 12 |
| (2) 吸収速度定数 .....                           | 12 |
| (3) バイオアベイラビリティ .....                      | 12 |
| (4) 消失速度定数 .....                           | 12 |
| (5) クリアランス .....                           | 12 |
| (6) 分布容積 .....                             | 12 |
| (7) 血漿蛋白結合率 .....                          | 12 |
| 3. 吸収 .....                                | 12 |
| 4. 分布 .....                                | 13 |
| (1) 血液－脳関門通過性 .....                        | 13 |
| (2) 血液－胎盤関門通過性 .....                       | 13 |
| (3) 乳汁への移行性 .....                          | 13 |
| (4) 髄液への移行性 .....                          | 13 |
| (5) その他の組織への移行性 .....                      | 13 |
| 5. 代謝 .....                                | 13 |
| (1) 代謝部位及び代謝経路 .....                       | 13 |
| (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種 .....          | 13 |
| (3) 初回通過効果の有無及びその割合 .....                  | 13 |
| (4) 代謝物の活性の有無及び比率 .....                    | 13 |
| (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ .....                  | 13 |
| 6. 排泄 .....                                | 14 |
| (1) 排泄部位及び経路 .....                         | 14 |
| (2) 排泄率 .....                              | 14 |
| (3) 排泄速度 .....                             | 14 |
| 7. 透析等による除去率 .....                         | 14 |



|                                     |    |
|-------------------------------------|----|
| Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目               | 15 |
| 1. 警告内容とその理由                        | 15 |
| 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）               | 15 |
| 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由           | 15 |
| 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由           | 15 |
| 5. 慎重投与内容とその理由                      | 15 |
| 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法              | 16 |
| 7. 相互作用                             | 16 |
| (1) 併用禁忌とその理由                       | 16 |
| (2) 併用注意とその理由                       | 17 |
| 8. 副作用                              | 17 |
| (1) 副作用の概要                          | 17 |
| (2) 重大な副作用と初期症状                     | 17 |
| (3) その他の副作用                         | 18 |
| (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧           | 18 |
| (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 | 19 |
| (6) 薬剤アレルギーに対する注意及び試験法              | 19 |
| 9. 高齢者への投与                          | 19 |
| 10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与                  | 19 |
| 11. 小児等への投与                         | 19 |
| 12. 臨床検査結果に及ぼす影響                    | 19 |
| 13. 過量投与                            | 19 |
| 14. 適用上の注意                          | 20 |
| 15. その他の注意                          | 20 |
| 16. その他                             | 20 |
| Ⅸ. 非臨床試験に関する項目                      | 21 |
| 1. 薬理試験                             | 21 |
| (1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）       | 21 |
| (2) 副次的薬理試験                         | 21 |
| (3) 安全性薬理試験                         | 21 |
| (4) その他の薬理試験                        | 21 |
| 2. 毒性試験                             | 21 |
| (1) 単回投与毒性試験                        | 21 |
| (2) 反復投与毒性試験                        | 22 |
| (3) 生殖発生毒性試験                        | 22 |
| (4) その他の特殊毒性                        | 22 |

|                                          |    |
|------------------------------------------|----|
| X. 管理的事項に関する項目 .....                     | 23 |
| 1. 規 制 区 分 .....                         | 23 |
| 2. 有効期間又は使用期限 .....                      | 23 |
| 3. 貯法・保存条件 .....                         | 23 |
| 4. 薬剤取扱い上の注意点 .....                      | 23 |
| (1) 薬局での取り扱いについて .....                   | 23 |
| (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等） .....       | 23 |
| 5. 承認条件等 .....                           | 23 |
| 6. 包        装 .....                      | 23 |
| 7. 容器の材質 .....                           | 23 |
| 8. 同一成分・同効薬 .....                        | 24 |
| 9. 国際誕生年月日 .....                         | 24 |
| 10. 製造販売承認年月日及び承認番号 .....                | 24 |
| 11. 薬価基準収載年月日 .....                      | 24 |
| 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 ..... | 24 |
| 13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 .....         | 24 |
| 14. 再審査期間 .....                          | 24 |
| 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 .....                | 24 |
| 16. 各種コード .....                          | 25 |
| 17. 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 .....                    | 28 |
| XIII. 備        考 .....                   | 29 |
| その他の関連資料 .....                           | 29 |



## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

クロニジン塩酸塩はドイツ Boehringer Ingelheim 社により 1966 年に開発された高血圧症治療薬である。現在、外国においては錠剤（普通錠）及び注射剤がドイツ、フランス等で発売されている。我国においては、カタプレス錠の販売名で 1969 年 5 月に輸入承認を取得し、1970 年 7 月より発売された。また、カタプレス錠 75 は 1976 年 7 月に輸入承認を取得し、1978 年 6 月より発売された。その後、「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について」（平成 16 年 6 月 2 日付薬食発第 0602009 号）による事故防止対策の観点から名称変更品（カタプレス錠 75 $\mu$ g, カタプレス錠 100 $\mu$ g）が、2006 年 8 月に新たに承認された。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤は、脳幹部における選択的な  $\alpha_2$  受容体刺激作用を有する。

本剤は脳幹部の  $\alpha_2$  受容体を選択的に刺激して、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下降させる。

## Ⅱ. 名称に関する項目

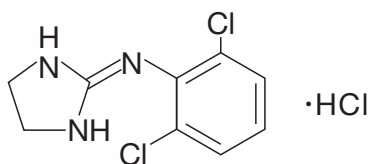
### 1. 販 売 名

- (1) 和 名 カタプレス<sup>®</sup>錠 75 $\mu$ g  
カタプレス<sup>®</sup>錠 150 $\mu$ g
- (2) 洋 名 Catapres<sup>®</sup> Tablets 75 $\mu$ g  
Catapres<sup>®</sup> Tablets 150 $\mu$ g
- (3) 名称の由来 Cut - Pressure の意に因んだもの。

### 2. 一 般 名

- (1) 和 名 (命名法) クロニジン塩酸塩 (JAN)
- (2) 洋 名 (命名法) Clonidine Hydrochloride (JAN)  
Clonidine (INN)
- (3) ステム 降圧剤, クロニジン誘導体: -onidine

### 3. 構造式又は至性式



### 4. 分子式及び分子量

$C_9H_9Cl_2N_3 \cdot HCl$  : 266.55

### 5. 化 学 名 (命名法)

- (英 名) 2-(2, 6-Dichlorophenylimino)imidazolidine monohydrochloride
- (日本名) 2-(2, 6-ジクロロフェニルイミノ)イミダゾリジン塩酸塩

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

- (1) 慣用名 なし
- (2) 別 名 塩酸クロニジン
- (3) 略 号 なし
- (4) 記号番号 ST-155

### 7. CAS 登録番号

4205-90-7 (Clonidine)

4205-91-8 (Clonidine hydrochloride)

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

## 1. 物理化学的性質

## (1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

## (2) 溶解性

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。

（測定温度：20℃）

| 溶媒       | 1g を溶かすのに必要な量, mL |           |           |
|----------|-------------------|-----------|-----------|
|          | ロット 1             | ロット 2     | ロット 3     |
| 水        | 14～15             | 14～15     | 14～15     |
| エタノール    | 23～25             | 23～25     | 23～25     |
| 酢酸（100）  | 310～370           | 300～320   | 300～330   |
| 無水酢酸     | 10,000 以上         | 10,000 以上 | 10,000 以上 |
| ジエチルエーテル | 10,000 以上         | 10,000 以上 | 10,000 以上 |

## (3) 吸湿性

ほとんど吸湿性はない。

測定条件：25℃ 51% R. H. , 25℃ 79% R. H. , 40℃ 51% R. H. ,  
40℃ 75% R. H. , 12 カ月

## (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融 点：約 310℃（分解）

## (5) 酸塩基解離定数

pKa：8.05（20℃，電位差滴定法）

## (6) 分配係数

該当資料なし

## (7) その他の主な示性値

溶液の液性

本品 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 4.0 ～ 5.5 である。

## 2．有効成分の各種条件下における安定性

| 溶媒             | 保存条件    | 保存期間  | 保存形態                    | 結 果  |
|----------------|---------|-------|-------------------------|------|
| 長期保存試験         | 室 温     | 24 カ月 | 遮光した気密容器                | 変化なし |
| 苛酷試験<br>(個体状態) | 40℃     | 24 カ月 | 遮光した気密容器                | 変化なし |
|                | 40℃ 79% | 12 カ月 | 遮光した秤量瓶                 | 変化なし |
|                | 太陽光線    | 9 カ月  | 無 色 瓶<br>褐 色 瓶<br>(密 栓) | 変化なし |

## 3．有効成分の確認試験法

- (1) 本品の水溶液 (1 → 1000) 5mL にドラージェンドルフ試液 6 滴を加えるとき、だいたい色の沈殿を生じる。
- (2) 本品の 0.01mol/L 塩酸試液溶液 (3 → 10000) につき、紫外可視吸光測定法により吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと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。
- (3) 本品を乾燥し、赤外吸収スペクトル測定法の塩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。
- (4) 本品の水溶液 (1 → 50) は塩化物の定性反応を呈する。

## 4．有効成分の定量法

本品を乾燥し、その約 0.4g を精密に量り、酢酸 (100) 30mL を加え、加温して溶かす。冷後、無水酢酸 70mL を加え、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する (電位差滴定法)。同様の方法で空試験を行い補正する。

$$0.1\text{mol/L 過塩素酸 } 1\text{mL} = 26.66\text{mg } \text{C}_9\text{H}_9\text{Cl}_2\text{N}_3 \cdot \text{HCl}$$

## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤 形

## (1) 剤形の区別, 規格及び性状

|                       | 剤形・色調         | 直径<br>(mm) | 高さ<br>(mm) | 重さ<br>(g) | 平 面 |  | 側 面 |
|-----------------------|---------------|------------|------------|-----------|-----|--|-----|
| カタプレス錠<br>75 $\mu$ g  | 白色の素錠<br>(割線) | 6.0        | 2.3        | 0.095     |     |  |     |
| カタプレス錠<br>150 $\mu$ g | 白色の素錠<br>(割線) | 8.0        | 2.6        | 0.19      |     |  |     |

## (2) 製剤の物性

該当資料なし

## (3) 識別コード

| 販売名                | 薬物本体 | 包装材料                                                     |
|--------------------|------|----------------------------------------------------------|
| カタプレス錠 75 $\mu$ g  |      | 表: CT 75<br>Catapres 75<br>裏:  MEDICAL PARKLAND CT 75    |
| カタプレス錠 150 $\mu$ g |      | 表: CT 150<br>Catapres 150<br>裏:  MEDICAL PARKLAND CT 150 |

## (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

カタプレス錠 75 $\mu$ g : 1 錠中クロニジン塩酸塩 0.075mg 含有カタプレス錠 150 $\mu$ g : 1 錠中クロニジン塩酸塩 0.150mg 含有

## (2) 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

## (3) そ の 他

該当しない

## 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

・カタプレス錠 150  $\mu$ g・カタプレス錠 75  $\mu$ g の各種条件下における安定性

| 保存条件 |     |         |      |         | 性 状                           |
|------|-----|---------|------|---------|-------------------------------|
| 温度   | 湿度  | 光       | 期間   | 包装状態    |                               |
| 40℃  |     |         | 3 カ月 | 無色びん・密栓 | 変化なし                          |
| 25℃  | 75% |         | 3 カ月 | 無色びん・開栓 | 3 カ月後に崩壊時間の短縮が認められるが,<br>変化なし |
|      |     | 60 万 lx | 1 時間 | 無色びん・密栓 | 変化なし                          |

## 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）

該当資料なし

## 7. 溶出性

（方法）日局溶出試験第 2 法により試験を行う。

条 件：回転数 毎分 50 回転

試験液 水 900mL

（結果）溶出規格：0.075mg 30 分 75%以上

0.15mg 45 分 75%以上

## 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

### (1) 呈色沈殿反応①

本品の試料溶液につき、ドラーゲンドルフ試液を加えるとき、だいたい色の沈殿を生じる。

### (2) 呈色沈殿反応②

本品の試料溶液につき、ライネッケ塩試液を加えるとき、淡赤色の沈殿を生じる。

### (3) 液体クロマトグラフィー

定量法で得た試料溶液及び標準溶液のクロマトグラムについて、内標準物質ピークに対するクロニンピークの相対保持時間を求め、比較するとき、それらは等しい。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

本品内容物の試料溶液及び標準溶液につき、液体クロマトグラフィーにより試験を行い、定量する。

## 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. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

## 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

各種高血圧症（本態性高血圧症，腎性高血圧症）

### 2. 用法及び用量

カタプレス錠 75  $\mu$ 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  $\mu$ 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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ（2009 年 4 月以降承認品目）

該当しない

#### (2) 臨床効果

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。本態性高血圧症及び腎性高血圧症を対象として国内総計 1,106 例で臨床試験が実施され，有効率解析例数は 1,021 例であった。

その臨床試験成績は次のとおりであった。

| 投与対象    | 有効例数 / 効果判定例数 | 有効率（有効以上） |
|---------|---------------|-----------|
| 本態性高血圧症 | 666/912       | 73. 0%    |
| 腎性高血圧症  | 70/109        | 64. 2%    |
| 計       | 736/1,021     | 72. 1%    |

#### (3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験：用量反応探索試験

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

本態性高血圧症を対象として、グアンファシン及びグアナベンズを対照薬として二重盲検試験を行ない、降圧効果において両剤と同程度の成績が得られている<sup>1), 2)</sup>。

1) 村上元孝ほか：医学のあゆみ. 1982；121：1080.

2) 五島雄一郎ほか：Geriat Med. 1982；20：2123.

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

該当資料なし

## 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

酢酸グアナベンズ等の中枢性降圧剤

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

延髄の血管運動中枢

脳幹部の  $\alpha_2$  受容体を選択的に作用して、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<sup>3)</sup>、イヌ<sup>3)</sup>）。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 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<sup>4)</sup>。

##### 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<sup>5), 6)</sup>。

##### 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<sup>6)</sup>。  
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<sup>7)</sup>。

#### (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

0.2 ～ 2.0ng/mL (0.3mg 単回経口投与時, 高血圧症患者<sup>8)</sup>)

## (2) 最高血中濃度到達時間

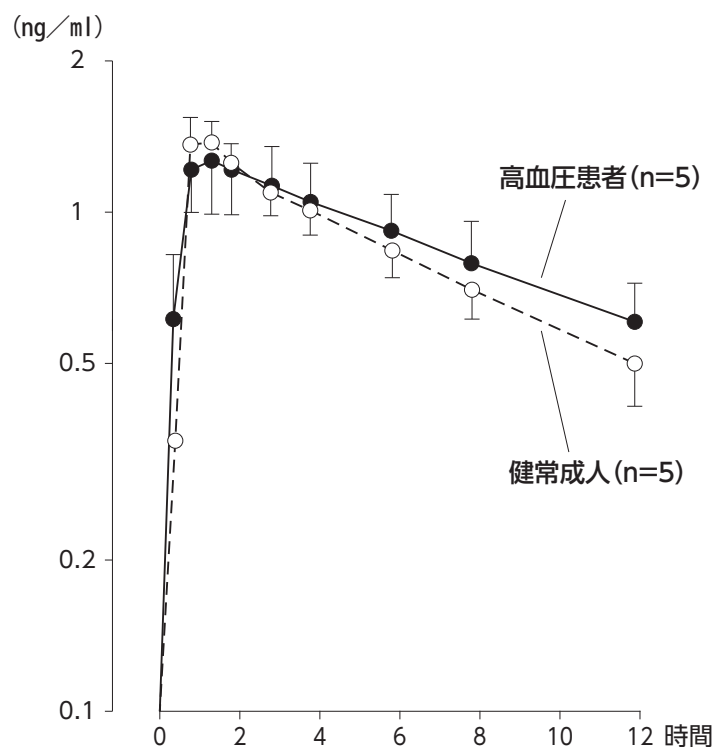
約 90 分 (0.3mg 単回経口投与時, 高血圧症患者<sup>8)</sup>)

## (3) 臨床試験で確認された血中濃度

## 1) 単回投与

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 (0.3mg 単回経口投与時, 高血圧患者<sup>8)</sup>)。

また, 健康成人にクロニジン塩酸塩 0.15mg を経口投与した場合, 1.5 時間で最高血中濃度約 0.6ng/mL に達する (0.15mg 単回経口投与時, 健康成人<sup>9)</sup>)。



正常血圧の被験者 5 例及び高血圧の被験者 5 例におけるクロニジン塩酸塩 300  $\mu$ g 単回経口投与時の血漿中クロニジン濃度 (平均  $\pm$  SEM) — ng/mL の単位で表示<sup>8)</sup>

## (4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(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) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

$0.66 \pm 0.006 \text{ hr}^{-1}$  (0.2mg/ 日・分 4, 経口投与時, 高血圧症患者<sup>10)</sup>)

(3) バイオアベイラビリティ

75.2% (0.3mg 経口投与時, 健康成人<sup>11)</sup>)

(4) 消失速度定数

$0.084 \pm 0.009 \text{ hr}^{-1}$  (0.3mg 静脈内注射時, 健康成人<sup>11)</sup>)

(5) クリアランス

Total クリアランス:  $3.05 \pm 0.54 \text{ mL} \cdot \text{min}^{-1} \cdot \text{kg}^{-1}$   
(0.3mg 静脈内注射時, 健康成人<sup>11)</sup>)

腎クリアランス :  $1.82 \pm 0.34 \text{ mL} \cdot \text{min}^{-1} \cdot \text{kg}^{-1}$   
(0.3mg 経口投与時, 健康成人<sup>11)</sup>)

(6) 分布容積

$2.09 \pm 0.19 \text{ L /kg}$  (0.3mg 静脈内注射時, 健康成人<sup>11)</sup>)

(7) 血漿蛋白結合率

約 30% (*in vitro* 4  $\mu\text{g/mL}$ , 健康成人血清<sup>12)</sup>)

## 3. 吸 収

吸収部位: 胃腸管

#### 4. 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<sup>13)</sup>）。

(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

胎盤を通過することが報告されている（妊婦，高血圧症患者<sup>14)</sup>）。

(3) 乳汁への移行性

血中濃度の約 2 倍の濃度が乳汁中で確認されたとの報告がある（妊婦，高血圧患者<sup>14)</sup>）。

(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

代謝部位：肝臓

代謝経路：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（外国人でのデータ<sup>15)</sup>）。

(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

初回通過効果はほとんど受けない<sup>16)</sup>。

(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

腎臓及び肝臓<sup>13)</sup>

### (2) 排 泄 率

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（外国人<sup>13)</sup>）。

### (3) 排泄速度

健康成人にクロニジン塩酸塩を 0.39mg 又は 1.44mg 経口投与したとき、24 時間後までに、約 45%、また 96 時間後までに約 65% が尿中に排泄される（外国人<sup>13)</sup>）。

## 7. 透析等による除去率

### (1) 腹膜透析

該当資料なし

### (2) 血液透析

最大 5% が除去される<sup>17)</sup>。

### (3) 直接血液灌流

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

（理由）：

発疹や瘙痒等があらわれることがあるが、その機序については不明である。ただし、确实視はできないが、発熱、不快感、紅斑性発疹等の毛細血管拡張症に特徴づけられる膠原病が示唆された例がある。皮膚生検では著明な弾性線維化と血管周囲の浸潤像がみられた<sup>18)</sup>。

### 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

#### (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

(理由)：

- (1)～(4) 一般的に、降圧剤投与による急激な降圧は、血流量の減少を伴ない、重要臓器の機能の低下を来す恐れがあるため、緊急を要する場合以外は、目標レベルの血圧値まで、徐々に降圧する必要がある<sup>19～21)</sup>。
- (5) 徐脈のある患者への投与では、徐脈を助長させるおそれがある<sup>20)</sup>。
- (6) 発熱時には、ときに循環器系（血圧・心機能など）において、著明な変化をおこすことがあるため。
- (7) 高齢者では動脈硬化を伴う場合が多く、過度な降圧では臓器循環の減少を伴うことや、副作用を伴いやすいため、長時間かけて緩徐に降圧する。

## 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

### 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。

(理由及び処置方法)：

- (2) 軽～中等症高血圧を対象に、本剤投与中止後の血圧再上昇を観察した試験では、中止後の血圧が、クロニジン塩酸塩投与前値にまで復する例（リバウンド現象）は認められたが、クロニジン塩酸塩投与前値を越えて上昇する例（オーバーシュート現象）は認められなかった<sup>22)</sup>。  
重症高血圧（Ps200mmHg, Pd120mmHg 以上）を対象に、本剤投与中止の試験を行ったところ、クロニジン塩酸塩の投与量が1日1.2mg未満の場合には中止後に伴う症状は殆んど観察されなかった。1日1.2mg以上の場合、本剤中止後、交感神経活性の亢進した症状が観察された。しかし、血圧値はいずれの場合も投与前値を有意に越えることはなかった<sup>23)</sup>。

## 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) |                                                                                            |                                                                                                                                      |
|-------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 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<br>アルコール  | 鎮痛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。                                                                                                             |
| $\beta$ 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、 $\beta$ 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。 $\beta$ 遮断剤の併用時は、 $\beta$ 受容体が遮断されているため、ノルエピネフリンの $\alpha$ 受容体刺激作用が増強され、血圧が急激に上昇する。 |

## 8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。主な副作用は口渴 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。

(2) 重大な副作用と初期症状

- 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。

(3) 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<br>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・<br>レイノー様症状            |             |
| 消化器                                   | 口渇             | 悪心、食欲不振、下痢、<br>便秘、心窩部膨満感、<br>胸焼け | 腹痛          |
| 泌尿・生殖器                                |                | 陰萎                               |             |
| 過敏症 <sup>注)</sup>                     |                | 発疹、掻痒                            |             |
| その他                                   |                | 鼻閉、血管神経性浮腫                       | 眼の感想、血糖値の上昇 |

注) 発現した場合には、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

調査症例 8,206 例中副作用が報告されたのは 33.04%であった。副作用は消化器系 20.28%，精神神経系 11.36%，循環器系 0.55%，過敏症 0.11%，その他 0.15%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。

副作用一覧表（国内調査数 8,074 例）

※ 外国報告例

| 副作用の種類                   | 発現件数<br>(%)   | 副作用の種類                                          | 発現件数<br>(%) |
|--------------------------|---------------|-------------------------------------------------|-------------|
|                          | 件      %      |                                                 | 件      %    |
| 1) 精神・神経系                |               | 悪 心 ・ 嘔 気                                       | 19 (0.24)   |
| 鎮静（ねむけ等）                 | 492 (6.09)    | 食欲不振・胃腸障害                                       | 12 (0.15)   |
| め ま い ・ 眩 暈              | 320 (3.96)    | 心 窩 部 膨 満 感                                     | 7 (0.09)    |
| 倦 怠 ・ 脱 力 感              | 81 (1.00)     | 下                      痢                        | 8 (0.10)    |
| 不 眠 ・ 不 安 感              | 12 (0.15)     | 胸                      や                      け | 4 (0.05)    |
| 幻覚・見当識障害                 | ※             | 4) 泌尿・生殖器                                       |             |
| 2) 循 環 器                 |               | 陰                      萎                        | ※           |
| 起 立 性 低 血 圧              | 30 (0.37)     | 3) 消 化 器                                        |             |
| 蒼                      白 | 13 (0.16)     | 発                      疹                        | 9 (0.11)    |
| レ イ ノ ー 様 症 状            | ※             | 6) そ の 他                                        |             |
| 3) 消 化 器                 |               | 鼻                      閉                        | 12 (0.15)   |
| 口 内 乾 燥 感                | 1,537 (19.04) | 血 管 神 經 性 浮 腫                                   | ※           |
| 便                      秘 | 40 (6.50)     | 血 糖 値 の 上 昇                                     | ※           |

- (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

本剤に対し過敏症の既往歴のある患者には、本剤を投与しないこと。

(2. 禁忌内容とその理由 (15 ページ) 参照)

## 9. 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。

## 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）でわずかに胎児への移行が報告されている。〕

(2) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には、授乳を中止させること。

〔動物実験（ウサギ）で母乳中へ移行することが報告されている。〕

## 11. 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。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

特に一定の傾向を示す変動は認められていない。

## 13. 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 $\alpha 1$ 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。

（理由）：

国内において、本剤の過量投与例は報告されていないが、海外において本剤の過量投与により、意識低下、縮腫、筋緊張低下あるいは反射減弱、痙攣、低血圧、高血圧、徐脈、伝導異常、不整脈、呼吸抑制、無呼吸、低体温などがみられたとの文献報告がある<sup>30)</sup>。

#### 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

該当しない

#### 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

1) 一般症状、中枢神経系に及ぼす影響

鎮静作用（マウス<sup>24)</sup>、イヌ<sup>24)</sup>、ネコ<sup>24)</sup>）があらわれることが認められている。

2) 呼吸・循環器系に及ぼす影響

① 徐脈作用（イヌ<sup>25)</sup>、ウサギ<sup>25)</sup>）があらわれることが認められている。② 心筋中のカテコラミン含有量に対する著しい影響は認められていない（ラット<sup>25)</sup>、ウサギ<sup>26)</sup>）。

3) 消化器系に及ぼす影響

レセルピンによる潰瘍形成に対する抑制作用が認められている（ラット<sup>25)</sup>）。

4) 自律神経系及び平滑筋に及ぼす影響

種々の交感神経興奮作用（イヌの瞬膜収縮、初期の血圧上昇等）が認められている<sup>25)</sup>。

5) 腎機能に及ぼす影響

利尿作用（尿量及びNa<sup>+</sup>排泄の増加）が認められている（ラット<sup>25)</sup>）。

(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

LD<sub>50</sub> (mg/kg)<sup>25)</sup>

| 投与経路<br>動物 | 経口    | 皮下    | 静脈内  |
|------------|-------|-------|------|
| マウス        | 328.0 | 165.0 | 17.6 |
| ラット        | 270.0 | 113.0 | 29.0 |

(2) 反復投与毒性試験

- 1) ラットに 0.05, 0.5 及び 5mg/kg/ 日を 3 カ月間皮下投与した。0.5mg/kg 以上で角膜乾燥が散見され、体重抑制及び赤血球減少が対照に比し有意であった。剖検で、5mg/kg 群に空回腸の重積が観察された。従って、無毒性量は 0.05mg/kg、毒性量は 0.5mg/kg である<sup>27)</sup>。
- 2) ラットに 0.075 から 1.25mg/kg/ 日を 26 週間（混餌）経口投与した。軽度に体重抑制がみられたが、血液検査、尿所見に変化はなかった。臓器重量は、0.6mg/kg 以上で胸腺に低下がみられた。病理組織学的所見では、0.6mg/kg 以上で甲状腺濾胞の増殖及び濾胞上皮の剥離がみられた<sup>28)</sup>。

(3) 生殖発生毒性試験

妊娠ラットに 0.1, 0.3 及び 0.6mg/kg、妊娠ウサギに 0.06 及び 0.6mg/kg を経口投与して胎児に及ぼす影響を試験したが、薬物に起因すると考えられる催奇形作用は認められなかった<sup>28)</sup>。

(4) その他の特殊毒性

1) 抗原性

モルモット ASA 反応、モルモット PCA 反応、ラット PCA 反応、赤血球凝集反応はいずれも陰性であり、抗原性は認められなかった<sup>29)</sup>。



## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規 制 区 分

製 剤：処方箋医薬品（注意 - 医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：劇薬

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3 年

### 3. 貯法・保存条件

貯法：気密容器

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱いについて

本剤は処方箋医薬品に指定されている。

注意-医師等の処方箋により使用すること。

#### (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包 装

カタプレス錠 75  $\mu$ g : 100 錠 (10 錠× 10) PTP

カタプレス錠 150  $\mu$ g : 100 錠 (10 錠× 10) PTP

### 7. 容器の材質

PTP（ポリ塩化ビニルフィルム／アルミ箔）

### 8. 同一成分・同効薬

#### (1) 同一成分

なし

#### (2) 同効薬

酢酸グアナベンズ他

## 9. 国際誕生年月日

該当資料なし

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

(田辺製薬株式会社)

|                   | 製造販売承認年月日       | 製造販売承認番号     |
|-------------------|-----------------|--------------|
| カタプレス錠 75 $\mu$ g | 1976 年 7 月 27 日 | 51AM 輪第 87 号 |
| カタプレス錠            | 1969 年 5 月 15 日 | 44AM 輪第 81 号 |

(日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社)

|                    | 製造販売承認年月日        | 製造販売承認番号         |
|--------------------|------------------|------------------|
| カタプレス錠 75          | 1980 年 10 月 30 日 | 55AM 輪第 217 号    |
| カタプレス錠             | 1980 年 10 月 30 日 | 55AM 輪第 218 号    |
| カタプレス錠 75 $\mu$ g  | 2006 年 8 月 4 日   | 21800AMX10658000 |
| カタプレス錠 150 $\mu$ g | 2006 年 8 月 4 日   | 21800AMX10657000 |

\* 「カタプレス錠 75 $\mu$ g」は、旧製品「カタプレス錠 75」より販売名変更

\* 「カタプレス錠 150 $\mu$ g」は、旧製品「カタプレス錠」より販売名変更

## 11. 薬価基準収載年月日

カタプレス錠 75 $\mu$ g : 2006 年 12 月 8 日

カタプレス錠 150 $\mu$ g : 2006 年 12 月 8 日

## 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

該当資料なし

## 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

厚生労働省告示第 107 号 (平成 18 年 3 月 6 日付) による投与期間の制限には該当しない。

## 16. 各種コード

| 販売名                | HOT 番号        | 厚生労働省薬価基準収載<br>医薬品コード | レセプト<br>電算コード |
|--------------------|---------------|-----------------------|---------------|
| カタプレス錠 75 $\mu$ g  | 1028652030101 | 2149001F1034          | 620004467     |
| カタプレス錠 150 $\mu$ g | 1028669030101 | 2149001F2065          | 620004468     |

## 17. 保険給付上の注意

該当しない

## XI. 文 献

### 1. 引用文献

- 1) 村上元孝ほか：医学のあゆみ. 1982；121：1080.
- 2) 五島雄一郎ほか：Geriat Med. 1982；20：2123.
- 3) Kobinger W.：Chest. 1983；83：296.
- 4) 大島研三ほか：総合臨牀. 1970；19：1237.
- 5) Cohen IM. *et al.*：Clin Pharmacol Ther. 1979；26：572.
- 6) Morgan T.：Chest. 1983；83：383.
- 7) 浜本肇ほか：臨牀と研究. 1977；54：308.
- 8) Wing LMH. *et al.*：Eur J Clin Pharmacol. 1977；12：463.
- 9) Arndts D. *et al.*：Arzneim-Forsch/Drug Res. 1979；29：532.
- 10) Manhem MD. *et al.*：Clin Pharmacol Ther. 1982；31：445.
- 11) Davies DS. *et al.*：Clin Pharmacol Ther. 1977；21：593.
- 12) Heckner RM.：Pharmatherapeutica. 1979；2：177.
- 13) Rehbinder D. *et al.*：Arzneim-Forsch/Drug Res. 1969；19：169.
- 14) Hartikainen-Sorri *et al.*：Obstet Gynecol. 1987；69：598.
- 15) Darda S. *et al.*：Arzneim-Forsch/Drug Res. 1978；28：255.
- 16) Mac Gregor TR. *et al.*：Arzneimittelforschung. 1985；35：440.
- 17) Hulter HN. *et al.*：J Lab Clin Med. 1979；94：223.
- 18) Witman G. *et al.*：RI Med J. 1981；64：147.
- 19) 高須照夫ほか：基礎と臨床. 1975；9：357.
- 20) Byrd BF. *et al.*：Arch Intern Med. 1988；148：729.
- 21) McGreger BF. *et al.*：New Z Med. 1967；66：864.
- 22) Whitsett TL. *et al.*：JAMA. 1976；25：2717.
- 23) Hoobler SW. *et al.*：Mayo Clin Proc. 1977；52：395.
- 24) Gogol'ak G. *et al.*：Arzneim-Forsch/Drug Res. 1966；16：1050.
- 25) Hoefke W. *et al.*：Arzneim-Forsch/Drug Res. 1966；16：1038.
- 26) 上羽康之ほか：臨牀と研究. 1976；53：2508.
- 27) アレキサンダー・カストほか：医薬品研究. 1987；18：366.
- 28) 島本暉朗ほか：現代の臨床. 1968；2：46.
- 29) 山田恭史ほか：医薬品研究. 1996；27：1.
- 30) Anderson RJ. *et al.*：Ann Emerg Med. 1981；10：107.

### 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・効果、用法・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・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  $\mu$ 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  $\mu$ 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。

|       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
|-------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 国 名   | 米国                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| 販 売 名 | Catapres <sup>®</sup> Tablets of 0.1, 0.2 and 0.3 mg                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
| 剤 形   | 錠剤                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| 含 量   | クロニジン塩酸塩 0.1, 0.2, 0.3mg                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| 効能・効果 | カタプレス錠は高血圧症の治療を適応とする。本剤は単独または他の降圧剤と併用で投与する。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| 用法・用量 | <p>成人</p> <p>カタプレス<sup>®</sup>錠（クロニジン塩酸塩，USP）の用量は，患者の血圧反応に応じて調節すること。以下は本剤投与時の一般的な指針である。</p> <p>初回投与量</p> <p>0.1mg 錠を 1 日 2 回投与する（朝および就寝時）。高齢者では，低用量からの投与開始が有効な場合がある。</p> <p>維持投与量</p> <p>望ましい効果が発揮されるまで，必要に応じて，1 週間ごとに 0.1mg/ 日ずつ増量する。経口 1 日用量の大部分を就寝時に服用することで，用量の調節による一過性の影響（口内乾燥および傾眠状態）を最小限に抑えられる場合がある。最も一般的に使用されている治療用量は，0.2mg ～ 0.6mg/ 日の分割投与である。複数の試験において，最大の効果が発揮される 1 日用量は 2.4mg であることが示唆されているが，このような高用量はほとんど使用されていない。</p> <p>腎機能障害</p> <p>腎機能障害を有する患者には，低用量からの投与開始が有効な場合がある。患者の状態を慎重に観察すること。クロニジンは通常の血液透析ではほとんど除去されないため，透析後にクロニジンを追加投与する必要はない。</p> |

クロニジン塩酸塩の錠剤は，ドイツ，イギリス，フランス，イタリア，アメリカ等世界 43 カ国で発売されている。（2014 年 10 月現在）

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XIII. 備 考

### その他の関連資料

該当資料なし

**【資料請求先】**

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  
TEL：0120-689-610 (通話料無料)  
受付時間：9：00～17：00 (土・日・祝日・弊社休日を除く)