

2022年5月改訂（第10版）

日本標準商品分類番号

872149

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

高血圧・排尿障害治療剤
プラゾシン塩酸塩錠
ミニプレス[®]錠 0.5mg
ミニプレス[®]錠 1mg
Minipress[®] Tablets 0.5mg・1mg

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	0.5mg：1錠中に日局 プラゾシン塩酸塩0.55mg（プラゾシンとして0.5mg）を含有する。 1mg：1錠中に日局 プラゾシン塩酸塩1.10mg（プラゾシンとして1.0mg）を含有する。
一般名	和名：プラゾシン塩酸塩（JAN） 洋名：Prazosin Hydrochloride（JAN、USAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：1981年 5月 1日 薬価基準収載年月日：1981年 9月 1日 販売開始年月日：1981年 9月 1日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：ファイザー株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ファイザー株式会社 製品情報センター 学術情報ダイヤル 0120-664-467 FAX 03-3379-3053 医療用製品情報 https://www.pfizermedicalinformation.jp

本 IF は 2022 年 4 月改訂の添付文書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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、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 を利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.....	2
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.....	4
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	4
III. 有効成分に関する項目	5
1. 物理化学的性質.....	5
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	6
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	6
IV. 製剤に関する項目	7
1. 剤形.....	7
2. 製剤の組成.....	8
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	8
4. 力価.....	8
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	8
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	9
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.....	9
11. 別途提供される資材類.....	10
12. その他.....	10
V. 治療に関する項目	11
1. 効能又は効果.....	11
2. 効能又は効果に関連する注意.....	11
3. 用法及び用量.....	11
4. 用法及び用量に関連する注意.....	11
5. 臨床成績.....	12
VI. 薬効薬理に関する項目	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
VII. 薬物動態に関する項目	16
1. 血中濃度の推移.....	16
2. 薬物速度論的パラメータ.....	17
3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	17
4. 吸収.....	17
5. 分布.....	17

6. 代謝	18
7. 排泄	19
8. トランスポーターに関する情報	19
9. 透析等による除去率	19
10. 特定の背景を有する患者	19
11. その他	20
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	21
1. 警告内容とその理由	21
2. 禁忌内容とその理由	21
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	21
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	21
5. 重要な基本的注意とその理由	21
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	21
7. 相互作用	22
8. 副作用	23
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	30
10. 過量投与	30
11. 適用上の注意	30
12. その他の注意	31
IX. 非臨床試験に関する項目	32
1. 薬理試験	32
2. 毒性試験	33
X. 管理的事項に関する項目	35
1. 規制区分	35
2. 有効期間	35
3. 包装状態での貯法	35
4. 取扱い上の注意	35
5. 患者向け資材	35
6. 同一成分・同効薬	35
7. 国際誕生年月日	35
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	36
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	36
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	36
11. 再審査期間	36
12. 投薬期間制限に関する情報	36
13. 各種コード	36
14. 保険給付上の注意	37
XI. 文献	38
1. 引用文献	38
2. その他の参考文献	39
XII. 参考資料	40
1. 主な外国での発売状況	40
2. 海外における臨床支援情報	41
XIII. 備考	44
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	44
2. その他の関連資料	44

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

プラゾシンは1965年米国ファイザー社において開発された、交感神経の α_1 受容体を選択的に遮断することにより血圧を下降させる初めての薬剤である。その構造上の特徴は、キナゾリン核を母核とすることである。

本剤は高血圧症に対して国内では1971年より基礎実験、1973年より臨床試験が開始され、頻脈を来たさず、長期連用しても耐性の発現がないこと、血漿レニン活性を上昇させないなどの特徴を有する降圧剤として有用性及び安全性が認められ、1981年に発売に至った。

一方、プラゾシンが尿道平滑筋、前立腺及び前立腺被膜にとくに豊富に存在する α_1 受容体を遮断することにより、尿道を弛緩させ尿道抵抗を減少させることが明らかになり、1982年より臨床試験が開始され、1989年効能・効果に“前立腺肥大症に伴う排尿障害”が追加となった。市販後、本態性高血圧症、腎性高血圧症については6,532例の、前立腺肥大症に伴う排尿障害については1,024例の使用成績調査を実施し再審査申請を行った結果、各々1989年1月、1994年9月に薬事法第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審査結果を得た。

2. 製品の治療学的特性

本態性高血圧症、腎性高血圧症

- (1) 単独投与で良好な血圧コントロールが得られ、各種の降圧薬と併用できる。
(「V-5. (7) その他」の項参照)
- (2) 様々な合併症を持つ高血圧患者に投与できる。
(「V-5. (7) その他」の項参照)
- (3) コレステロールの代謝に悪い影響を与えない。
(「V-5. (7) その他」の項参照)
- (4) 安静時でも運動時でも正常な血行動態を保つ。
(「VI-2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照)
- (5) 重大な副作用として失神・意識喪失(0.11%)、狭心症(頻度不明)の報告がある。
(「VIII-8. 副作用」の項参照)

前立腺肥大症に伴う排尿障害

- (1) α_1 受容体を遮断し、尿道抵抗を減少させる。
(「VI-2. (1) 作用部位・作用機序」の項参照)
- (2) 排尿困難、夜間頻尿、残尿感などの自覚症状を改善する。とくに、夜間頻尿は投与1週目で有意の改善を示す。
(「V-5. (7) その他」の項参照)
- (3) ウロダイナミクス(尿流動態)を改善する。
最大尿流量率、残尿量、尿道内圧などの他覚所見を有意に改善し、排尿効率を高める。
(「V-5. (7) その他」の項参照)
- (4) 重大な副作用として失神・意識喪失(0.11%)、狭心症(頻度不明)の報告がある。
(「VIII-8. 副作用」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

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	(「I-6. RMP の概要」の項参照)
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

ミニプレス錠 0.5mg・1mg

(2) 洋名

Minipress Tablets 0.5mg・1mg

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

プラゾシン塩酸塩 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

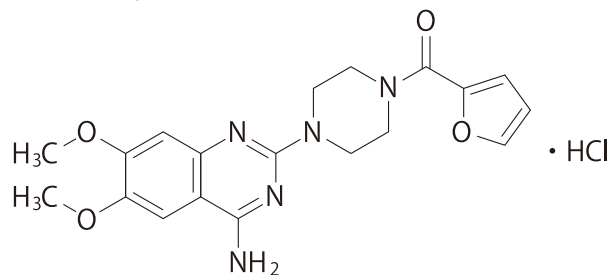
Prazosin Hydrochloride (JAN、USAN)

prazosin (INN)

(3) ステム (stem)

-azosin : antihypertensive substances, prazosin derivatives

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{19}H_{21}N_5O_4 \cdot HCl$

分子量 : 419.86

5. 化学名（命名法）又は本質

1-(4-Amino-6,7-dimethoxy-quinazolin-2-yl)-4-(2-furoyl)piperazine monohydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

慣用名、別名、略号：なし

記号番号（治験番号）：CP-12、299-1

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。
光によって徐々に微黄白色になる。

(2) 溶解性

溶 液	溶 解 性
メ タ ノ ー ル	溶 け に く い
エ タ ノ ー ル (9 9 . 5)	極 め て 溶 け に く い
水	ほ と ん ど 溶 け な い

(3) 吸湿性

各種相対湿度層（32～90%、37℃）に11日間放置したときの吸湿増量を測定した結果、ほとんど吸湿性はなく臨界相対湿度は約80%であった。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約270℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

pKa=6.2

(6) 分配係数

n-オクタノール／水：0.09

ヘキサノール／水：0.27

(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

各種条件下における安定性

		保存条件	保存期間	保存形態	結果		
					外観	残存率 (%)	
長期 保存 試験	固体状態	室温	27ヵ月	ガラスびん	規格内	99.2~100.5	
	溶液状態	4.62mg/mL 水性溶液* 室温	12ヵ月	しゃ光アンプル	規格内	97.4~99.4	
苛酷 試験	固体 状態	熱	100℃	48時間	しゃ光アンプル	規格内	99.3~100.0
			50℃	6ヵ月	しゃ光びん	規格内	98.6~100.4
	湿度	25℃ RH62%	6ヵ月	開栓秤量びん	規格内	97.7~100.9	
		25℃ RH82%	6ヵ月	開栓秤量びん	規格内	98.9~101.4	
	光	キセノンランプ照射下	24時間	透明びん	規格内	99.4~101.3	
	溶液 状態	光	4.62mg/mL 水性溶液* 室温	20時間	無色透明アンプル	5時間で 微黄色	92.6~94.0
キセノンランプ照射下	15時間以上 で淡黄色		89.4~90.5				

*水・メタノール混液（6：4）中で徐々に分解し、外観は淡黄色に変色し、薄層クロマトグラフ法により分解物Ⅰ（脱フロ酸体）、分解物Ⅱ（フロ酸）が認められた。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

- (1) 第3級アミンの呈色反応
- (2) メトキシル基の呈色反応
- (3) 塩化物の沈殿反応
- (4) 紫外吸収スペクトル

定量法

電位差滴定法







IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

素錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	外形			識別コード	色調等
	上面	下面	側面		
ミニプレス錠 0.5mg				PT432	白色 割線入り 素錠
	直径 6.4mm		厚さ 2.4mm		
ミニプレス錠 1mg				PT433	淡橙色 割線入り 素錠
	直径 7.2mm		厚さ 2.8mm		

(3) 識別コード

錠 0.5mg : PT432、錠 1mg : PT433

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(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	ミニプレス錠 0.5mg	ミニプレス錠 1mg
有効成分	1錠中 日局 プラゾシン塩酸塩 0.55mg (プラゾシンとして 0.5mg)	1錠中 日局 プラゾシン塩酸塩 1.10mg (プラゾシンとして 1.0mg)
添加剤	無水リン酸水素カルシウム、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム	無水リン酸水素カルシウム、結晶セルロース、トウモロコシデンプン、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、黄色5号

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

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

原薬の固体状態での長期保存試験及び熱、湿度、光などの苛酷試験により分解物の生成は認められない（TLC法及びHPLC法による）。

6. 製剤の各種条件下における安定性

ミニプレス錠0.5mg、1mgの各種条件下における安定性

	保存条件	保存期間	保存形態	結 果		
				外 観	残存率 (%)	
長期保存試験	室温	42ヵ月	ブリスターパック	規格内	96～102	
苛 酷 試 験	熱	50℃	3ヵ月	ブリスターパック	規格内	95～102
	湿度	37℃ RH75%	3ヵ月	無包装	規格内	94～102
	光	直射日光	8時間/日、4週間	ブリスターパック	規格内	97～100
		キセノン ランプ照射	20時間	ブリスターパック	規格内	98～101

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

試験法：日局溶出試験法第一法

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

〈ミニプレス錠 0.5mg〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

500錠 [瓶、乾燥剤入り]

〈ミニプレス錠 1mg〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

500錠 [瓶、乾燥剤入り]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル (PVC)

瓶：ポリエチレン (HDPE：High Density Polyethylene)

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

- 本態性高血圧症、腎性高血圧症
- 前立腺肥大症に伴う排尿障害

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

〈前立腺肥大症に伴う排尿障害〉

本剤による治療は原因療法ではなく、対症療法であることに留意し、本剤投与により期待する効果が得られない場合には手術療法等、他の適切な処置を考慮すること。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

〈本態性高血圧症、腎性高血圧症〉

プラゾシンとして通常、成人1日1～1.5mg（1回0.5mg 1日2～3回）より投与を始め、効果が不十分な場合は1～2週間の間隔をおいて1.5～6mgまで漸増し、1日2～3回に分割経口投与する。まれに1日15mgまで漸増することもある。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈前立腺肥大症に伴う排尿障害〉

プラゾシンとして通常、成人1日1～1.5mg（1回0.5mg 1日2～3回）より投与を始め、効果が不十分な場合は1～2週間の間隔をおいて1.5～6mgまで漸増し、1日2～3回に分割経口投与する。

なお、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

「V-5. (3) 用量反応探索試験」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

忍容性試験

健康成人 6 名を対象にプラゾシン錠 2mg を単回経口投与したとき、血圧は 30 分後より 6 時間後まで有意な下降を示した。心拍数は 1 時間後から 6 時間まで有意の増加を示した¹⁾。

注) 本剤の承認用法・用量は本態性高血圧症、腎性高血圧症には 1~15mg 日 2~3 回に分割投与、前立腺肥大症に伴う排尿障害には 1~6mg 日 2~3 回に分割投与である。

(3) 用量反応探索試験

前立腺肥大症に伴う排尿障害を主訴とする患者 14 例にプラゾシン錠 1mg 又は 2mg を単回投与した結果、1mg の単回投与では尿道内圧曲線の有意な変動は認められなかったが、2mg の単回投与では投与後早期に尿道前立腺部の最大内圧の有意な低下等が認められた²⁾。

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

①本態性高血圧症、腎性高血圧症

本態性高血圧症 218 例を対象に、エカラジン錠を対照とした 12 週間の二重盲検群間比較試験を実施した。初期の 2 週間は用量固定期としてプラゾシン錠 6mg/日、分 3、エカラジン錠 60mg/日、分 3 投与を実施しその後 10 週間の用量可変期にはプラゾシン錠 3~12mg/日、分 3、エカラジン錠 30~120mg/日、分 3 の投与を行った結果、プラゾシン錠の有用性が認められた³⁾。

②前立腺肥大症に伴う排尿障害

前立腺肥大症に伴う排尿障害患者 177 例を対象にプラゾシン錠 (1.5~3mg/日、分 3) の有用性をパラプロスト (6 カプセル/日、分 3) を対照とした 3 週間の二重盲検群間比較試験により検討した結果、プラゾシン錠の有用性が認められた⁴⁾。

2) 安全性試験

該当しない

(5) 患者・病態別試験

該当しない

(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

該当しない

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

1) 本態性高血圧症、腎性高血圧症⁵⁾

単独投与時、利尿降圧剤併用投与時ともに大部分の症例が投与開始後 1～2 週間は初期投与量を固定して投与され、以降は症例ごとに血圧の変動に応じ 1～2 週間の間隔において、多くは漸増しながら投与量の調節が行われた。血圧降下は徐々に始まり、4 週目以降には収縮期血圧、拡張期血圧ともにすぐれた降圧効果が得られ、投与開始後 8～10 週時までにはほぼ投与量の調節が終わり、安定した降圧効果が維持された。また 6 ヶ月以上の長期投与においても良好な降圧効果が持続し、長期療法に耐え得る有用な薬剤と評価されている。

プラゾシン単独投与及び利尿降圧剤又はその他の降圧剤併用時の臨床効果は下表に示すとおりである。

高血圧症に対する臨床効果

投与方法 \ 効果判定	改善以上	軽度改善以上
単 独 投 与	51.1% (204/399)	73.2% (292/399)
併 用 投 与	55.7% (123/221)	79.6% (176/221)
計	52.7% (327/620)	75.5% (468/620)

2) 前立腺肥大症に伴う排尿障害^{2)、4)、6)～8)}

1 日 1～1.5mg より投与を始め、以降 1～2 週間の間隔を置いて、1.5～6mg まで増量する漸増法にて投与を行った結果、3～4 週の投与により自覚症状及びウロダイナミクス検査（残尿量、最大尿流量率、尿道内圧等）で投与前に比べ有意の改善が得られた。

一般臨床試験及び二重盲検比較試験の結果、本剤の臨床的有用性が認められた。

開発時の一般臨床試験及び二重盲検比較試験の臨床効果は以下の通りである。

試験方法 \ 効果判定	中等度改善以上	軽度改善以上
一般臨床試験	54.1% (40/ 74)	87.8% (65/ 74)
二重盲検比較試験	62.3% (48/ 77)	84.4% (65/ 77)
計	58.3% (88/151)	86.1% (130/151)

3) その他

①本態性高血圧症患者にプラゾシンを 12 週間から 1 年間投与した報告によれば、高比重リポ蛋白（HDL）コレステロールの増加とともにコレステロール比（HDL コレステロール/VLDL コレステロール+LDL コレステロール）の上昇が認められている^{9)、10)}。

②慢性閉塞性肺疾患を合併した高血圧症患者にプラゾシンを投与した報告によれば FEV_{1.0} などの呼吸機能に改善が認められている¹¹⁾。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

α受容体遮断剤（フェントラミン、フェノキシベンザミン^注）

キナゾリン誘導体（ブナゾシン塩酸塩、ドキサゾシンメシル酸塩）

注）未承認薬である

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

	本態性高血圧症、腎性高血圧症適用時 ^{12)、13)}	前立腺肥大症に伴う排尿障害適用時 ^{14)、15)}
作用部位	血管平滑筋にある交感神経α ₁ 受容体	後部尿道、前立腺及び膀胱三角部平滑筋に分布する交感神経α ₁ 受容体
作用機序	末梢血管にあるα ₁ 受容体を選択的に遮断することにより、末梢血管を拡張させ、全末梢抵抗を減少させる。	α ₁ 受容体を選択的に遮断することにより後部尿道・前立腺・膀胱三角部平滑筋を弛緩させ、尿道抵抗を減少させる。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 本態性高血圧症、腎性高血圧症

①降圧作用^{9)、12)、16)~18)}

プラゾシンは高血圧自然発症ラット、腎性高血圧ラット、DOCA 高血圧ラットのいずれにおいても優れた降圧作用が認められている¹⁶⁾。

プラゾシンの降圧作用はα受容体を遮断することにより末梢血管を拡張させ、その抵抗を減少させることによるが、従来のα遮断薬と異なり、シナプス後α受容体を選択的に遮断し、シナプス前α受容体にはほとんど作用しない。このためシナプス前α受容体を介するノルアドレナリン放出の負のフィードバック機構を抑制せず、過剰のノルアドレナリン放出をおこさないことが *in vitro* におけるウサギ肺動脈の試験で認められている¹²⁾。シナプス後α受容体に対するプラゾシンの選択的な作用は本態性高血圧症患者に反射性頻脈をほとんどきたさないこと、レニン活性に及ぼす影響が少ないこと、長期連用による耐性発現がみられないことなどの特性に関連するものと考えられている^{9)、18)}。

	動物	投与経路	結果
単回投与による効果	高血圧自然発症ラット (SHR)	経口	血圧を30mmHg下降させるのに要する量で比較すると、プラゾシンの降圧作用はヒドララジンの6倍、エカラジンの23倍、α-メチルドパの280倍強力であった。
	腎性高血圧ラット	経口	血圧を30mmHg下降させるのに要する用量で比較すると、プラゾシンの降圧作用はヒドララジンの8倍、α-メチルドパの315倍強力であった。
	DOCA高血圧ラット	経口	0.1~1.0mg/kgの投与で用量依存的に血圧下降（17~37mmHg）を示した。
	腎性高血圧イヌ	経口	0.005~1.25mg/kgの投与で用量依存的に血圧下降（3~50mmHg）を示した。

連続投与による効果	高血圧自然発症ラット (SHR)	経口	0.5mg/kg/日、80日間投与。耐性は認められなかった。
	正常血圧イヌ	経口	10mg/kg/日、14日間投与。耐性は認められなかった。
	腎性高血圧イヌ	経口	0.1～0.625mg/kg、10日間投与。耐性は認められなかった。ヒドララジン2.5mg/kgでは耐性が認められた。

②血中レニン活性¹⁹⁾

動物	投与経路	結果
腎性高血圧イヌ (無麻酔)	経口/静注	プラゾシンは血中レニン活性に対し何ら影響をおよぼさなかった。

③循環動態

本態性高血圧症患者にプラゾシンを1～13ヵ月経口投与した試験では、収縮期血圧、拡張期血圧ともに有意の下降をみたが、心拍数には変化がなく、心拍出量は不変もしくは軽度上昇を示した。プラゾシンは心筋収縮性、心筋酸素消費量、心仕事量に変化を与えず、心機能への影響は少ないと考えられる。また長期投与の場合も運動負荷時の循環動態の反応性に影響を与えていない^{18)、20)、21)}。

④腎機能

腎機能が正常な本態性高血圧症患者に対して、プラゾシン投与前後の糸球体濾過量などを測定し、降圧後の腎機能の変動を検討したが、有意の変動を認めず、降圧効果に伴う腎血流量の低下はないものと推測される。またBUN、クレアチニン、PSPにも有意の変動はみられていない²²⁾。

2) 前立腺、尿道及び膀胱平滑筋に対する作用¹⁴⁾

プラゾシンはウサギ摘出前立腺、尿道及び膀胱三角部平滑筋標本でのノルアドレナリン収縮を用量依存的に抑制し、その作用はフェントラミンの約2.5～3.1倍である。プラゾシンは麻酔イヌの下腹部神経刺激による尿道内圧の上昇を著明に抑制し、その作用はフェントラミンの約10倍であった。

また、プラゾシンはラット排尿反射による膀胱収縮を抑制し、膀胱容量増加が示唆される。

(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

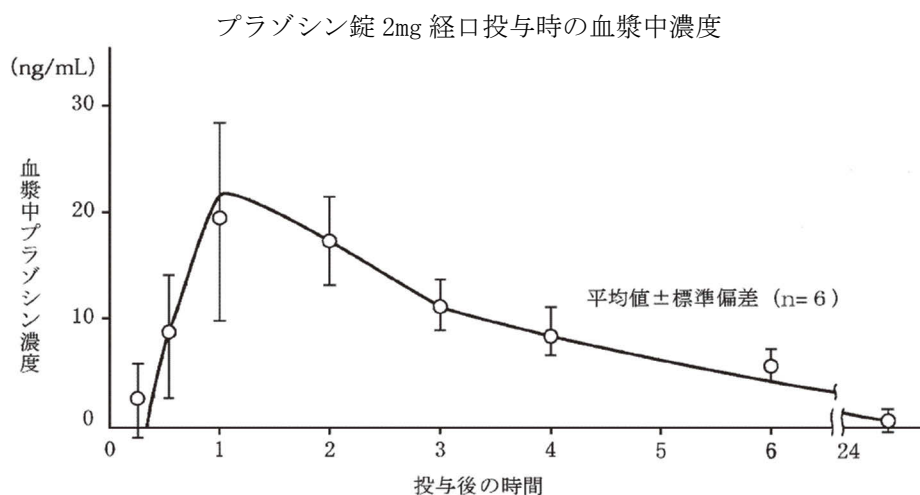
(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

健康成人単回投与¹⁾

健康成人男子 6 名にプラゾシン錠 2mg を空腹時に単回経口投与した結果、投与約 1.2 時間後に最高血漿中濃度約 21.1ng/mL を示し、その半減期は約 2 時間であった。



C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	AUC (hr·ng/mL)	ke (hr ⁻¹)
21.10 ± 5.66	1.163 ± 0.429	78.84 ± 15.63	0.3533 ± 0.0593

n=6、平均値 ± 標準偏差

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

<参考>外国人のデータ

健康成人 18 名にプラゾシン錠 2mg をクロスオーバー法により空腹時又は食後に単回経口投与したときの血中濃度・時間曲線下面積 (AUC) に有意差は認められず、本剤の吸収に及ぼす食事の影響は少ないものと考えられる²³⁾。

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¹⁾

3.731±1.744/hr (2mg 単回投与時、平均値±標準偏差)

(3) 消失速度定数¹⁾

0.3533±0.0593/hr (2mg 単回投与時、平均値±標準偏差)

(4) クリアランス¹⁾

平均 26.2L/hr (19.2~35.1L/hr、2mg 単回投与時)

(5) 分布容積¹⁾

平均 75.3L (52.8~96.6L、2mg 単回投与時)

(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

吸収部位：腸管

バイオアベイラビリティ

<参考>外国人のデータ²⁴⁾

健常男子6名にプラゾシン1mgを経口及び静注した結果、12時間までの経口投与時の生物学的利用率は56.9%であった。

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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性²⁵⁾

妊娠中よりプラゾシンを服用していた2症例における乳汁中移行率は各々、平均21.3% (16.2~36.8%、産褥0~6日4mg投与時)、平均6.1% (4.8~7.1%、産褥2~8日2mg投与時)であった。

(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¹⁾

健常成人6名にプラゾシン2mg (錠剤) を経口投与したときの血中濃度の分布容積は平均75.3L (52.8~96.6L) であり、各組織への移行性は高いと推測される。

(6) 血漿蛋白結合率²⁶⁾

97% (限外濾過法)

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

主に肝臓²⁷⁾

<参考>外国人のデータ

Hobbs らはプラゾシンを経口投与したヒト血漿について薄層クロマトグラフィーによる分析を行った結果、血中に代謝物を認めなかったと報告している²⁶⁾。

Taylor らはプラゾシンを経口投与したヒトの尿について薄層クロマトグラフィーによる分析を行った結果、主代謝物は6-O-demethylprazosin, 7-O-demethylprazosin とこれらの抱合体であると報告している²⁸⁾。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

(1) 排泄部位

主に糞便中²⁷⁾

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

健常成人 6 名にプラゾシン錠 2mg を経口投与したときの尿中未変化体排泄率は投与量の 2.4% で、大部分はラットやイヌと同様に胆汁中に排泄されるものと考えられる¹⁾。

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

(1) 腹膜透析

除去されない²⁹⁾

(2) 血液透析

除去されない²⁹⁾

(3) 直接血液灌流

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

<参考>外国人のデータ

腎機能障害患者単回投与³⁰⁾

腎機能障害を伴う高血圧症患者*12 例及び腎機能正常の高血圧症患者 5 例にミニプレス 1mg 又は 2mg 又は 5mg を単回経口投与した結果、腎機能障害を伴う高血圧症患者の薬物動態については、1mg 又は 2mg の投与のため血漿中濃度は低かったが、 $t_{1/2}$ 、 Ke 、 AUC は腎機能正常の高血圧症患者のものと有意差を認めなかった。また、ミニプレス 3~8mg/日 (低用量) あるいは 9~20mg/日 (高用量) を連続経口投与した結果、高用量投与時の消失速度定数 (Ke) は腎機能障害を伴う高血圧症患者で有意に大きかったが、他のパラメータ及び低用量投与時の薬物動態は腎機能正常の高血圧症患者のものと有意差を認めなかった。

*血清クレアチニン 1.6~8.5mg/dL が 7 例、透析を受けている末期腎不全患者が 5 例。

対 象	$t_{1/2}$ (hr)	AUC (ng·hr/mL)	Ke (hr ⁻¹)
単回投与			
腎機能正常高血圧症患者	3.7±2.2	39.1±12.6	0.29±0.2
腎障害を伴う高血圧症患者	4.8±0.9	27.2±3.0	0.12±0.03

連続投与（低用量：3～8mg/日）			
腎機能正常高血圧症患者	2.5±0.6	51.5±12.7	0.33±0.08
腎障害を伴う高血圧症患者	2.6±0.3	35.0±7.4	0.29±0.03
連続投与（高用量：9～20mg/日）			
腎機能正常高血圧症患者	5.8±1.2	281±91	0.13±0.02
腎障害を伴う高血圧症患者	3.7±0.07	177±112	0.18±0.01*
		Mean±S. E.	* : P<0.05

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

「V-2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

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 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座位で血圧測定を行い、体位変換による血圧変化を考慮し、座位にて血圧をコントロールすること。

8.2 本剤の投与初期又は用量の急増時などに、ときに急激な血圧低下によると考えられる失神・意識喪失を起こすことがある。

一般に本症状は、本剤投与後短時間で起こり、めまい、脱力感、発汗、動悸等の前駆症状を伴うのでその際は仰臥位をとらせるなどの適切な措置を講ずる。また、必要に応じて対症療法を行うこと。 [11.1.1 参照]

8.3 本剤の投与初期又は用量の急増時等に、起立性低血圧に基づくめまい等があらわ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従事する場合には注意させること。

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

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

主として肝臓で代謝されるため血中濃度が上昇するおそれがある。

(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。

(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。ヒト母乳中へ移行することが報告されている²⁵⁾。

(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

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。一般に過度の降圧は脳梗塞等が起こるおそれがある。

7. 相互作用

(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）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
利尿剤、他の降圧剤 ニフェジピン等	相互に作用を増強することがあるので、減量するなど注意すること。	相互に作用を増強することがある。
ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤 バルデナフィル塩酸塩水和物 タダラフィル シルデナフィルクエン酸塩	併用によりめまい等の自覚症状を伴う症候性低血圧を来したとの報告がある。	血管拡張作用による降圧作用を有するため、本剤の降圧作用を増強することがある。

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^{31,32)}。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 失神・意識喪失（0.11%^{注1)}）

一過性の血圧低下に伴う失神・意識喪失があらわれることがある。 [8.2 参照]

11.1.2 狭心症（頻度不明）

注1) 使用成績調査を含む

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用				
	1%以上 ^{注1)}	0.1~1%未満 ^{注1)}	0.1%未満 ^{注1)}	頻度不明
肝臓			ALT、ASTの上昇、肝機能異常	
循環器		動悸・心悸亢進、頻脈、起立性めまい、起立性低血圧、低血圧、ほてり	潮紅	徐脈
精神・神経系	めまい、頭痛・頭重	眠気、眩暈	不眠、耳鳴、四肢のしびれ	抑うつ、幻覚、神経過敏（症）
消化器		食欲不振、下痢、便秘、腹痛、口渇、悪心・嘔吐		膵炎
泌尿・生殖器			頻尿、陰萎、尿失禁	持続勃起、女性化乳房
過敏症		発疹	蕁麻疹、瘙痒感	扁平苔癬、血管炎
呼吸器		鼻閉	息苦しさ	呼吸困難、鼻出血、鼻充血
眼		かすみ目		強膜変色、眼痛、術中虹彩緊張低下症候群（IFIS）
その他		浮腫、胸痛、倦怠感、脱力感	発汗、疲労	脱毛、発熱、疼痛、関節痛、異常感覚、抗核因子試験陽性

注1) 使用成績調査を含む

◆項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

1) 本態性高血圧症、腎性高血圧症

開発時及び承認後6年間の調査（再審査終了時）において、7,293例中672例（9.21%）に副作用又は臨床検査値異常が認められた³¹⁾。

	開発時	承認後	合計
調査症例数	761例	6,532例	7,293例
発現症例数（%）	144例（18.92%）	528例（8.08%）	672例（9.21%）
発現件数	215件	688件	903件

() : %

副作用の種類	開発時	承認後	合計	自律神経系障害	38 (4.99)	67 (1.03)	105 (1.44)
皮膚付属器官障害	4 (0.53)	10 (0.15)	14 (0.19)	口 渴	10 (1.31)	17 (0.26)	27 (0.37)
発 疹	2 (0.26)	2 (0.03)	4 (0.05)	発 汗	—	2 (0.03)	2 (0.03)
皮 疹	—	1 (0.02)	1 (0.01)	冷 汗	—	1 (0.02)	1 (0.01)
薬 疹	—	2 (0.03)	2 (0.03)	汗をかき易い	—	1 (0.02)	1 (0.01)
紅 斑	—	1 (0.02)	1 (0.01)	心 悸 亢 進	26 (3.42)	6 (0.09)	32 (0.44)
蕁 麻疹	—	1 (0.02)	1 (0.01)	動 悸	—	34 (0.52)	34 (0.47)
瘙 痒 感	2 (0.26)	3 (0.05)	5 (0.07)	頻 脈	2 (0.26)	8 (0.12)	10 (0.14)
中枢末梢神経系障害	83 (1091)	300 (4.59)	383 (5.25)	視覚障害	7 (0.92)	3 (0.05)	10 (0.14)
頭 痛	10 (1.31)	36 (0.55)	46 (0.63)	眼 球 突 出 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
後 頭 部 痛	—	2 (0.03)	2 (0.03)	か す み 目	6 (0.79)	2 (0.03)	8 (0.11)
前 頭 部 痛	—	1 (0.02)	1 (0.01)	目 が か す む	—	1 (0.02)	1 (0.01)
頭 部 ひ き つ れ 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)	目 が チ ラ チ ラ す る	1 (0.13)	—	1 (0.01)
頭 重 (感)	5 (0.66)	24 (0.37)	29 (0.40)	聴覚前庭障害	2 (0.26)	4 (0.06)	6 (0.08)
後 頭 部 頭 重 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)	耳 鳴	2 (0.26)	4 (0.06)	6 (0.08)
眩 暈	—	10 (0.15)	10 (0.14)	精神障害	10 (1.31)	21 (0.32)	31 (0.43)
め ま い	24 (3.15)	104 (1.59)	128 (1.76)	眠 気	5 (0.66)	12 (0.18)	17 (0.23)
眼 前 暗 黒 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)	催 眠 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
め ま い 感	—	12 (0.18)	12 (0.16)	ね む く な る	—	1 (0.02)	1 (0.01)
起 立 性 め ま い	38 (4.99)	15 (0.23)	53 (0.73)	嗜 眠 傾 向	—	1 (0.02)	1 (0.01)
起 立 時 の 眼 前 暗 黒	—	1 (0.02)	1 (0.01)	不 眠 (症)	5 (0.66)	1 (0.02)	6 (0.08)
一 過 性 脳 虚 血 発 作	—	1 (0.02)	1 (0.01)	悪 夢	—	1 (0.02)	1 (0.01)
ふ ら つ き	—	22 (0.34)	22 (0.30)	多 夢	—	1 (0.02)	1 (0.01)
ふ ら つ き 感	—	5 (0.08)	5 (0.07)	性 欲 減 退	—	1 (0.02)	1 (0.01)
ふ ら ふ ら (感)	—	15 (0.23)	15 (0.21)	あ く び	—	1 (0.02)	1 (0.01)
立 ち く ら み	—	58 (0.89)	58 (0.80)	老 人 性 痴 呆	—	1 (0.02)	1 (0.01)
起 立 性 眩 暈 症	—	1 (0.02)	1 (0.01)	頭 の ぼ や け	—	1 (0.02)	1 (0.01)
歩 行 時 の 浮 遊 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)	胃腸系障害	33 (4.34)	58 (0.89)	91 (1.25)
歩 行 不 安 定	—	1 (0.02)	1 (0.01)	嘔 気	—	16 (0.24)	16 (0.22)
労 作 時 ふ ら つ き	—	1 (0.02)	1 (0.01)	む か つ き	—	2 (0.03)	2 (0.03)
頭 が フ ェ ー と す る	—	1 (0.02)	1 (0.01)	悪 心	4 (0.53)	9 (0.14)	13 (0.21)
眼 瞼 が だ る い	—	1 (0.02)	1 (0.01)	嘔 吐	—	6 (0.09)	6 (0.08)
眼 瞼 下 垂	1 (0.13)	—	1 (0.01)	胃 炎	—	1 (0.02)	1 (0.01)
顔 面 の こ わ ば り	—	1 (0.02)	1 (0.01)	胃 部 不 快 感	15 (1.97)	3 (0.05)	18 (0.25)
肩 こ り	—	4 (0.06)	4 (0.05)	腹 部 不 快 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
全 身 の ふ る え	—	1 (0.02)	1 (0.01)	心 窩 部 不 快 感	—	2 (0.03)	2 (0.03)
手 指 振 戦	—	1 (0.02)	1 (0.01)	上 腹 部 痛	—	1 (0.02)	1 (0.01)
ふ る え	—	1 (0.02)	1 (0.01)	上 腹 部 鈍 痛	—	1 (0.02)	1 (0.01)
手 足 の し び れ	—	1 (0.02)	1 (0.01)	上 腹 部 不 快 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
手 足 の し び れ 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)	便 秘	2 (0.26)	6 (0.09)	8 (0.11)
四 肢 し び れ (感)	3 (0.39)	—	3 (0.04)	腹 満 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
頭 の し び れ	—	1 (0.02)	1 (0.01)	胃 部 膨 満 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
舌 し び れ	1 (0.13)	—	1 (0.01)	胃 腸 障 害	—	3 (0.05)	3 (0.04)
舌 尖 部 し び れ 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)	胃 腸 症 状	—	1 (0.02)	1 (0.01)
冷 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)	食 欲 不 振	5 (0.66)	4 (0.06)	9 (0.12)
陰 部 異 常 感	1 (0.13)	—	1 (0.01)	食 思 減 退	—	1 (0.02)	1 (0.01)
				口 腔 の か ゆ み 感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
				口 内 炎	1 (0.13)	1 (0.02)	2 (0.03)
				舌 が あ ふ れ る	1 (0.13)	—	1 (0.01)
				下 痢	5 (0.66)	10 (0.15)	15 (0.21)

() : %

副作用の種類	開発時	承認後	合計	一般的全身障害	22 (2.89)	64 (0.98)	86 (1.18)
肝臓胆管系障害	—	4 (0.06)	4 (0.05)	足がほてる	—	1 (0.02)	1 (0.01)
G O T 増加	—	1 (0.02)	1 (0.01)	顔面のほてり	1 (0.13)	2 (0.03)	3 (0.04)
G P T 増加	—	1 (0.02)	1 (0.01)	顔面紅潮	—	4 (0.06)	4 (0.05)
A l - P 上昇	—	1 (0.02)	1 (0.01)	熱感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
肝機能障害	—	1 (0.02)	1 (0.01)	顔面熱感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
肝機能悪化	—	1 (0.02)	1 (0.01)	身体熱感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
心臓血管系障害	4 (0.53)	49 (0.75)	53 (0.73)	眼部熱感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
失神	—	3 (0.05)	3 (0.04)	倦怠感(感)	4 (0.53)	12 (0.18)	16 (0.22)
失神発作	—	3 (0.05)	3 (0.04)	全身倦怠感(感)	—	6 (0.09)	6 (0.08)
意識消失	1 (0.13)	1 (0.02)	2 (0.03)	下肢倦怠感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
低血圧	—	3 (0.05)	3 (0.04)	気分が悪い	—	2 (0.03)	2 (0.03)
血圧低下	—	1 (0.02)	1 (0.01)	頭がボーッとして気分が悪い	—	1 (0.02)	1 (0.01)
降圧のしすぎ	3 (0.39)	—	3 (0.04)	気分不良	—	1 (0.02)	1 (0.01)
起立性低血圧	—	35 (0.54)	35 (0.48)	頭がボーッとする感じ	—	1 (0.02)	1 (0.01)
起立性低血圧発作	—	1 (0.02)	1 (0.01)	頭がモヤモヤ	—	1 (0.02)	1 (0.01)
虚脱感	—	1 (0.02)	1 (0.01)	気分不快	—	1 (0.02)	1 (0.01)
ショック	—	1 (0.02)	1 (0.01)	不快感	1 (0.03)	3 (0.05)	4 (0.05)
顔面蒼白	—	1 (0.02)	1 (0.01)	首すじの不快感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
心拍数心リズム障害	—	3 (0.05)	3 (0.04)	頭がボーッとする	—	1 (0.02)	1 (0.01)
不整脈	—	1 (0.02)	1 (0.01)	疲労感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
心室性期外収縮	—	2 (0.03)	2 (0.03)	易疲労感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
心臓外血管障害	—	2 (0.03)	2 (0.03)	易疲労性	—	1 (0.02)	1 (0.01)
発赤	—	1 (0.02)	1 (0.01)	脱力感(感)	4 (0.53)	10 (0.15)	14 (0.19)
眼瞼周囲の発赤	—	1 (0.02)	1 (0.01)	足のだるさ	—	1 (0.02)	1 (0.01)
呼吸系障害	6 (0.79)	6 (0.09)	12 (0.16)	体がおもい	—	1 (0.02)	1 (0.01)
鼻炎	—	1 (0.02)	1 (0.01)	両足脱力感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
鼻閉	4 (0.53)	5 (0.08)	9 (0.12)	頸部絞扼感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
息苦しい	2 (0.26)	—	2 (0.03)	後頸部痛	—	1 (0.02)	1 (0.01)
赤血球障害	—	2 (0.03)	2 (0.03)	顔面浮腫	—	3 (0.05)	3 (0.04)
脳貧血	—	2 (0.03)	2 (0.03)	顔面腫脹感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
泌尿系障害	6 (0.79)	7 (0.11)	13 (0.18)	浮腫(顔面・手足)	—	1 (0.02)	1 (0.01)
排尿障害	—	1 (0.02)	1 (0.01)	浮腫	7 (0.92)	3 (0.05)	10 (0.14)
尿失禁	1 (0.13)	2 (0.03)	3 (0.04)	頭ののぼせ感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
夜尿(症)	1 (0.13)	—	1 (0.01)	のぼせ感	1 (0.13)	—	1 (0.01)
頻尿	3 (0.39)	3 (0.05)	6 (0.08)	胸痛	—	1 (0.02)	1 (0.01)
尿の白濁	—	1 (0.02)	1 (0.01)	胸痛	—	2 (0.03)	2 (0.03)
尿量減少	1 (0.13)	—	1 (0.01)	胸部圧迫感	1 (0.13)	2 (0.03)	3 (0.04)
男性生殖障害	—	1 (0.02)	1 (0.01)	胸部不快感	—	2 (0.03)	2 (0.03)
陰萎	—	1 (0.02)	1 (0.01)	前屈時の胸部苦悶感	—	1 (0.02)	1 (0.01)
				腰痛	1 (0.13)	—	1 (0.01)
				体重減少	—	1 (0.02)	1 (0.01)
				体重増加	1 (0.13)	—	1 (0.01)
				関節がガクガクする	1 (0.13)	—	1 (0.01)
				その他	—	25 (0.38)	25 (0.34)
				あり：症状不明	—	25 (0.38)	25 (0.34)

2) 前立腺肥大症に伴う排尿障害

開発時及び承認後4年間の調査（再審査終了時）において、1,187例中30例（2.53%）に副作用又は臨床検査値異常が認められた³²⁾。

	開発時	承認後	合計
調査症例数	163例	1,024例	1,187例
発現症例数 (%)	3例 (1.84%)	27例 (2.64%)	30例 (2.53%)
発現件数	4件	33件	37件

副作用の種類	開発時	承認後	合計
中枢・末梢神経系障害	3 (1.84)	13 (1.27)	16 (1.35)
頭重 (感)	—	1 (0.10)	1 (0.08)
めまい	1 (0.61)	7 (0.68)	8 (0.67)
立ちくらみ	2 (1.23)	4 (0.39)	6 (0.51)
ふらつき (感)	—	1 (0.10)	1 (0.08)
自律神経系障害	1 (0.61)	1 (0.10)	2 (0.17)
かすみ目	1 (0.61)	—	1 (0.08)
寝汗	—	1 (0.10)	1 (0.08)
消化管障害	—	4 (0.39)	4 (0.34)
胃部不快感	—	1 (0.10)	1 (0.08)
嘔気	—	1 (0.10)	1 (0.08)
胸やけ	—	1 (0.10)	1 (0.08)
口渇	—	1 (0.10)	1 (0.08)
肝臓・胆管系障害	—	1 (0.10)	1 (0.08)
GOT上昇	—	1 (0.10)	1 (0.08)
代謝・栄養障害	—	1 (0.10)	1 (0.08)
LDH上昇	—	1 (0.10)	1 (0.08)
心・血管障害 (一般)	—	3 (0.29)	3 (0.25)
起立性低血圧	—	2 (0.20)	2 (0.17)
低血圧	—	1 (0.10)	1 (0.08)
血管 (心臓外) 障害	—	1 (0.10)	1 (0.08)
脳血栓症	—	1 (0.10)	1 (0.08)

() : %

呼吸器系障害	—	1 (0.10)	1 (0.08)
息切れ	—	1 (0.10)	1 (0.08)
赤血球障害	—	1 (0.10)	1 (0.08)
赤血球減少	—	1 (0.10)	1 (0.08)
ヘモグロビン減少	—	1 (0.10)	1 (0.08)
ヘマトクリット値減少	—	1 (0.10)	1 (0.08)
泌尿器系障害	—	1 (0.10)	1 (0.08)
尿失禁	—	1 (0.10)	1 (0.08)
一般的全身障害	—	4 (0.39)	4 (0.34)
脱力感	—	1 (0.10)	1 (0.08)
全身倦怠感	—	1 (0.10)	1 (0.08)
気分不快	—	2 (0.20)	2 (0.17)

◆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

1) 本態性高血圧症、腎性高血圧症

背景		発現頻度	
年齢	10～19 歳	—	(0/5)
	20～29 歳	11.32%	(6/53)
	30～39 歳	10.26%	(28/273)
	40～49 歳	9.75%	(105/1,077)
	50～59 歳	7.63%	(169/2,215)
	60～69 歳	8.20%	(140/1,707)
	70～79 歳	6.99%	(67/958)
	80 歳以上	4.20%	(6/143)
	不明	6.93%	(7/101)
性	男	6.88%	(252/3,663)
	女	9.75%	(273/2,800)
	不明	4.35%	(3/69)
併用薬	あり	8.42%	(428/5,082)
	なし	6.90%	(100/1,450)
合併症	あり	8.23%	(255/3,100)
	なし	7.95%	(273/3,432)
最終投与量	0.5mg/日以下	27.27%	(27/99)
	0.6～1.0mg/日	11.92%	(75/629)
	1.1～1.5mg/日	6.95%	(121/1,741)
	1.6～2.0mg/日	8.25%	(56/679)
	2.1～3.0mg/日	6.27%	(153/2,442)
	3.1～4.5mg/日	5.73%	(9/157)
	4.6～6.0mg/日	11.64%	(56/481)
	6.1～8.0mg/日	8.11%	(3/37)
	8.1～10.0mg/日	4.88%	(2/41)
	10.1mg/日以上	—	(0/14)
	不明	12.26%	(26/212)

承認後 6 年間の調査：6,532 症例よりファイザー（株）集計

2) 前立腺肥大症に伴う排尿障害

背景		発現頻度	
年齢	50歳未満	—	(0/20)
	50～59歳	2.82%	(4/142)
	60～69歳	2.67%	(10/374)
	70～79歳	2.30%	(9/392)
	80歳以上	4.17%	(4/96)
併用薬	あり	2.39%	(20/838)
	なし	7.23%	(6/83)
	未記載等	0.97%	(1/103)
合併症	あり	3.64%	(11/302)
	なし	2.22%	(16/721)
	未記載等	—	(0/1)
前立腺肥大の程度	軽度	3.03%	(17/561)
	中等度	2.40%	(8/333)
	高度	—	(0/11)
	未記載等	1.68%	(2/119)
最終投与量	1.5mg/日以下	3.14%	(25/797)
	1.5～3.0mg/日	0.51%	(1/196)
	3.1～6.0mg/日	—	(0/6)
	用量変更	5.56%	(1/18)
	未記載等	—	(0/7)

承認後4年間の調査：1,024症例よりファイザー（株）集計

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

13. 過量投与

13.1 症状

過量投与により低血圧を起こす可能性がある。

13.2 処置

本剤は蛋白結合率が高いため、透析による除去は有効ではない。

また、2歳の小児がプラゾシンを少なくとも50mg服用した事故では、深い眠気及び反射の低下を招いたが、血圧の低下はみられず、回復は順調であった。

その他、下表の報告もある³³⁾。

年齢、性	投与量	症状、徴候	処置	転帰
19歳、男性	200mg	頻脈	36時間臥床	回復
25歳、男性	150mg	持続勃起	亀頭陰茎海綿体シャント	回復
75歳、男性	80mg	嗜眠状態、低血圧	胃洗浄、活性炭、輸液	18時間後回復
72歳、男性	120mg	昏睡、低血圧、チェーンストークス型呼吸、呼吸不全、アシドーシス、肺水腫	ドパミン、アンジオテンシン、集中治療室に搬入後換気、膠質輸液、アトロピン	48時間後回復

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 腎及びその他の動脈狭窄症、脚部及びその他の動脈瘤等の血管障害のある高血圧患者で、本剤の投与により急性熱性多発性関節炎がみられた報告がある。

15.1.2 α_1 遮断薬を服用中又は過去に服用経験のある患者において、 α_1 遮断作用によると考えられる術中虹彩緊張低下症候群 (Intraoperative Floppy Iris Syndrome) があらわれるとの報告がある。

<解説>

15.1.2 本剤を服用中の患者が白内障等の眼科手術を受ける際には、手術前に眼科医へ本剤を服用している旨を伝えるよう指導すること。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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) 安全性薬理試験

一般薬理試験成績一覧表

実験項目	動物	投与経路	結果
1. 自発運動 (回転カゴ法)	マウス	経口	1mg/kg : 作用なし 10mg/kg : 40%減少
2. 協調運動 (回転棒法)	マウス	経口	ED ₅₀ =3,000~4,000mg/kg
3. 懸垂試験 (懸垂法)	マウス	経口	10、100mg/kg : 作用なし
4. 抗痙れん作用 (電撃痙れん)	マウス	経口	50、100mg/kg : 作用なし
5. 鎮痛作用 (熱板法)	マウス	経口	10、100mg/kg : 作用なし
6. 睡眠延長作用 (ヘキソバルビタール)	マウス	経口	1、10mg/kg : 作用なし
7. 体温 (直腸温)	ラット	経口	1mg/kg : 作用なし 10、20 mg/kg : 1.2℃下降
8. 脳波 (皮質自発脳波)	慢性植込みウサギ	経口	1mg/kg : 作用なし (2/3) 徐波成分の増加 (1/3) 5mg/kg : 徐波成分の増加
9. 呼吸・循環器系に対する作用 (1) 血圧 (2) 呼吸数 (3) 心拍数 (4) 心拍出量 (5) 全末梢抵抗 (6) 心電図 (7) 無麻酔血圧	イヌ イヌ イヌ イヌ イヌ イヌ 高血圧自然発症ラット	静注 静注 静注 静注 静注 静注 経口	0.01~0.5mg/kg : 下降 0.01~0.5mg/kg : 増加 0.01~0.5mg/kg : 増加 0.1~0.5mg/kg : 増加 0.1~0.5mg/kg : 減少 0.01~0.5mg/kg : 異常なし 0.1~1.0mg/kg : 下降
10. 摘出心房標本 (拍動数、心収縮力)	モルモット右心房	in vitro	10 ⁻⁶ 、10 ⁻⁵ g/mL : 作用なし 5×10 ⁻⁵ g/mL : 拍動数、心収縮力の軽度減少
11. 摘出腸管自動運動	ウサギ摘出腸管	in vitro	10 ⁻⁷ 、10 ⁻⁶ g/mL : 作用なし 10 ⁻⁵ g/mL : 25%抑制 5×10 ⁻⁵ g/mL : 55%抑制
12. 摘出子宮自動運動	非妊娠ラット摘出子宮 妊娠ラット摘出子宮	in vitro in vitro	10 ⁻⁶ 、10 ⁻⁵ g/mL : 作用なし 10 ⁻⁶ g/mL : 作用なし 10 ⁻⁵ g/mL : わずかな抑制傾向
13. 鎮痙作用	モルモット摘出回腸	in vitro	10 ⁻⁵ g/mL : 抗アセリチルコリン、抗セロトニン作用なし、軽度の抗ヒスタミン作用あり
14. 胃液分泌 (胃液分泌量、胃酸度)	ラット	経口 (5日間)	0.5、2.5mg/kg/日 : 作用なし
15. 小腸炭末輸送量	マウス	経口	0.1mg/kg : 作用なし 1、10mg/kg : 約10%抑制
16. 尿量及び尿中電解質排泄	ラット	経口 (35日間)	1、5mg/kg : 尿量、尿中電解質(Na ⁺ 、Cl ⁻)の減少又は減少傾向

(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

LD₅₀ : mg/kg

動物	投与経路	経口		皮下		静脈内*	
		雄	雌	雄	雌	雄	雌
	マウス	7,000	6,700	3,580	3,100	>20	>20
	ラット	2,000	1,950	3,750	3,800	>20	>20

*本薬は水に溶けにくく、20mg/kgは投与しうる最大量である。

(2) 反復投与毒性試験

1) 亜急性毒性³⁴⁾

ラットに40、80、160、320、640mg/kgを1日1回30日間経口投与した実験では、その最大無作用量は体重増加抑制もなく、その他特別な変化もみられない160mg/kg/日と推定された。

2) 慢性毒性³⁴⁾

ラットに5、20、40、80、160mg/kg/日を12ヵ月間経口投与した実験で、160mg/kg投与群の正常血圧ラットでは臨床化学的所見、臓器重量、剖検及び組織学的所見などで変化が認められたが、自然発症高血圧ラットでは精巣の変化を除いては殆ど対照群と差がなかった。最大無作用量は40mg/kg/日とみなされ、この用量はヒトの臨床最大投与量15mg/日(0.3mg/kg/日)の130倍に相当する。

(3) 遺伝毒性試験

変異原性試験

マウスに経口投与し、微生物を用いた宿主経路試験、マウス骨髄細胞による細胞遺伝学的試験及びマウスでの優性致死試験を行って、プラゾシンの突然変異誘発性を調べた。宿主経路試験では、復帰変異の発生頻度は増加せず、変異原性は認められなかった。細胞遺伝学的試験では、染色体異常の発生頻度は増加せず、変異原性は認められなかった。また、優性致死試験でも優性致死作用は認められなかった。プラゾシンには突然変異誘発性はないものと考えられた。

(社内資料)

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験³⁵⁾

ラットに 5、50、300mg/kg/日を経口投与した実験では、妊娠前及び妊娠初期投与の場合 300mg/kg で交尾率の低下、胎児の器官形成期投与の場合 50mg/kg 以上で胎児死亡率の増加、周産期及び授乳期投与の場合 50mg/kg 以上で出生児生存率の低下などがみられたが、催奇形成作用は認められていない。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

抗原性試験

プラゾシンの抗原性について、モルモットの全身性アナフィラキシー試験、マウス・ラットでの IgE 型抗体産生誘発試験、ウサギ抗血清を用いての沈降反応、赤血球凝集反応及びモルモットでの passive cutaneous anaphylaxis (PCA) により検討したが、いずれの場合も陰性であった。

(社内資料)

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)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：該当しない

2. 有効期間

有効期間：4年（最終年月を外箱等に記載）

プラゾシンの錠剤をブリスターパック包装し、42ヵ月間室温保存した結果、プラゾシン含有に変化が見られず、分解物の生成も認められなかった。また熱、湿度、光等の苛酷試験においても安定であった。従って、本剤は通常の市場流通条件下においては、少なくとも4年間は定められた規格に適合する品質を維持出来ると考えられる。

（「IV-6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分：なし

同 効 薬：(1) 降圧剤

ブナゾシン塩酸塩、ウラピジル、テラゾシン塩酸塩水和物、ドキサゾシンメシル酸塩

(2) 排尿障害治療剤

ウラピジル、テラゾシン塩酸塩水和物、タムスロシン塩酸塩、ナフトピジル

7. 国際誕生年月日

1973年3月

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

販売名	製造承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
ミニプレス錠 0.5mg	1981年5月1日	15600AMZ00569	1981年9月1日	1981年9月1日
ミニプレス錠 1mg	1981年5月1日	15600AMZ00570	1981年9月1日	1981年9月1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

1989年1月17日 前立腺肥大症に伴う排尿障害

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果通知日：

- (1) 本態性高血圧症、腎性高血圧症 1989年1月4日
 (2) 前立腺肥大症に伴う排尿障害 1994年9月8日

再審査結果：(1)、(2)ともに薬事法第14条第2号各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない。

11. 再審査期間

- (1) 本態性高血圧症、腎性高血圧症
承認を受けた日より起算して6年間
1981年5月1日～1987年4月30日（終了）
 (2) 前立腺肥大症に伴う排尿障害
承認を受けた日より起算して4年間
1989年1月17日～1993年1月16日（終了）

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

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
ミニプレス錠0.5mg	2149002F1128	2149002F1128	102877501	612140233
ミニプレス錠1mg	2149002F2159	2149002F2159	102881201	612140234

14. 保険給付上の注意

特になし

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 林正弘ほか：臨床薬理. 1978 ; 9 (4) : 385-394 [L19961114215]
- 2) 中村浩二ほか：西日本泌尿器科. 1986 ; 48 (2) : 423-427 [L19970523012]
- 3) 大島研三ほか：医学のあゆみ. 1979 ; 108 (3) : 186-201 [L19970523020]
- 4) 山口脩ほか：医学と薬学. 1988 ; 19 (2) : 411-429 [L19970523017]
- 5) 社内資料：高血圧症に対する臨床効果 [L20040217224]
- 6) 近藤厚生ほか：西日本泌尿器科. 1988 ; 50 (2) : 769-778 [L19970522044]
- 7) 青木光ほか：医学と薬学. 1988 ; 19 (2) : 431-440 [L19970523004]
- 8) 社内資料：一般臨床試験の成績に関する資料 [L20040217226]
- 9) 高島利一ほか：医学と薬学. 1983 ; 9 (3) : 873-880 [L19970522037]
- 10) 国府達郎ほか：循環器科. 1982 ; 12 (4) : 396-404 [L19970602015]
- 11) 西澤芳男：医学と薬学. 1982 ; 7 (7) : 1899-1909 [L19970523041]
- 12) Cambridge D, et al. : Med J Aust. 1977 ; 2 (Spec. Suppl.) : 2-6 (PMID : 21341) [L19970526007]
- 13) Cambridge D, et al. : Br J Pharmacol. 1977 ; 59 : 514-515 [L19970526003]
- 14) 社内資料：実験動物における尿道、前立腺および膀胱に対する Prazosin の作用 [L20040217227]
- 15) 国沢義隆ほか：日本泌尿器科学会雑誌. 1986 ; 77 (4) : 600-611 [L19970526022]
- 16) 大槻勲夫ほか：応用薬理. 1979 ; 17 (3) : 403-422 [L19970523008]
- 17) Constantine JW. : Int Cougr Ser. 1974 ; (331) : 16-39 [L19970526019]
- 18) 築山久一郎ほか：臨床成人病. 1978 ; 8 (2) : 227-233
- 19) Massingham R, et al. : Eur J Pharmacol. 1975 ; 30 : 121-124 (PMID : 1122933) [L19970526009]
- 20) 新谷富士雄ほか：臨床と研究. 1978 ; 55 (2) : 629-633
- 21) 後藤哲也ほか：臨床成人病. 1977 ; 7 (6) : 926-935
- 22) 篠田知璋：診療と新薬. 1978 ; 15 (12) : 3111-3118
- 23) Verbesselt R, et al. : Acta Ther. 1976 ; 2 (1) : 27-39 [L19961114212]
- 24) Bateman DN, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 1979 ; 16 : 177-181 (PMID : 499317) [L19970523045]
- 25) 竹田省ほか：産科と婦人科. 1989 ; 56 (12) : 2516-2520 [L19970210010]
- 26) Hobbs DC, et al. : J Clin Pharmacol. 1978 ; 18 : 402-406 (PMID : 690251) [L19970526005]
- 27) 斉藤博ほか：臨床成人病. 1985 ; 15 (5) : 634-636 [L19971022022]
- 28) Taylor JA, et al. : Xenobiotica. 1977 ; 7 (6) : 357-364 (PMID : 610052) [L19970523021]
- 29) Bennett WM, et al. : Ann Intern Med. 1980 ; 93 (2) : 286-325 (PMID : 7406382) [L19970522046]
- 30) Lowenthal DT, et al. : Clin Pharmacol Ther. 1980 ; 27 (6) : 779-783 (PMID : 7379445) [L19980722010]
- 31) 厚生省薬務局：医薬品副作用情報. 1989 ; (94) : 17-19 [L19970602011]
- 32) 厚生省薬務局：医薬品研究. 1995 ; 26 (1) : 37-43 [L19970602013]
- 33) Lip GYH, et al. : J Hum Hypertens. 1995 ; 9 (7) : 523-526 (PMID : 7562879) [L19971211084]
- 34) 野口晏弘ほか：応用薬理. 1979 ; 17 (1) : 39-56 [L19970523034]
- 35) 野口晏弘ほか：応用薬理. 1979 ; 17 (1) : 57-62 [L19970523042]

2. その他の参考文献

特になし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

外国における発売状況（2018年11月時点）

国名	米国	イギリス
会社名	Pfizer Inc.	Pfizer Ltd
販売名	Minipress Capsules	Hypovase Tablets 0.5mg Hypovase 1mg tablets
承認年月日	1992年1月29日	Hypovase Tablets 0.5mg:1988年10月19日 Hypovase 1mg tablets:1988年10月19日
剤形及び含量	1mg カプセル 2mg カプセル 5mg カプセル	500 μ g錠 1mg錠
効能又は効果	・高血圧症	・高血圧症 ・うっ血性心不全 ・レイノー症状、レイノー病 ・前立腺肥大症に伴う排尿障害
用法及び用量	1mg1日2～3回より投与を開始し、 6～15mg日に漸増 最高投与量40mg日	・高血圧症 500 μ g1日2～3回より投与を開始し漸増 一般的な維持投与量15mg日 最高投与量20mg日 ・うっ血性心不全 500 μ g1日2～4回より投与を開始し4～ 20mg日に漸増 ・レイノー症状、レイノー病 500 μ g1日2回より投与を開始し1～2mg1日 2回に漸増 ・前立腺肥大症に伴う排尿障害 500 μ g1日2回より投与を開始し2mg1日2 回に漸増 最高投与量4mg日

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、外国の承認状況とは異なる。国内の承認内容の範囲で本剤を使用すること。

【効能又は効果】

4. 効能又は効果

- 本態性高血圧症、腎性高血圧症
- 前立腺肥大症に伴う排尿障害

【用法及び用量】

6. 用法及び用量

〈本態性高血圧症、腎性高血圧症〉

プラゾシンとして通常、成人1日1～1.5mg（1回0.5mg 1日2～3回）より投与を始め、効果が不十分な場合は1～2週間の間隔をおいて1.5～6mgまで漸増し、1日2～3回に分割経口投与する。まれに1日15mgまで漸増することもある。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈前立腺肥大症に伴う排尿障害〉

プラゾシンとして通常、成人1日1～1.5mg（1回0.5mg 1日2～3回）より投与を始め、効果が不十分な場合は1～2週間の間隔をおいて1.5～6mgまで漸増し、1日2～3回に分割経口投与する。

なお、症状により適宜増減する。

2. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における特定の背景を有する患者に関する注意「9.5 妊婦」、「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、米国（米国添付文書）、オーストラリア分類とは異なる。

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。

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。ヒト母乳中へ移行することが報告されている²⁵⁾。

出典	記載内容
<p>米国の添付文書 (2016年7月)</p>	<p>Usage in Pregnancy: MINIPRESS has been shown to be associated with decreased litter size at birth, 1, 4, and 21 days of age in rats when given doses more than 225 times the usual maximum recommended human dose. No evidence of drug-related external, visceral, or skeletal fetal abnormalities were observed. No drug-related external, visceral, or skeletal abnormalities were observed in fetuses of pregnant rabbits and pregnant monkeys at doses more than 225 times and 12 times the usual maximum recommended human dose, respectively.</p> <p>The use of prazosin and a beta-blocker for the control of severe hypertension in 44 pregnant women revealed no drug-related fetal abnormalities or adverse effects. Therapy with prazosin was continued for as long as 14 weeks.¹</p> <p>Prazosin has also been used alone or in combination with other hypotensive agents in severe hypertension of pregnancy by other investigators. No fetal or neonatal abnormalities have been reported with the use of prazosin.²</p> <p>There are no adequate and well controlled studies which establish the safety of MINIPRESS in pregnant women. MINIPRESS should be used during pregnancy only if the potential benefit justifies the potential risk to the mother and fetus.</p> <p>Nursing Mothers: MINIPRESS has been shown to be excreted in small amounts in human milk. Caution should be exercised when MINIPRESS is administered to a nursing woman.</p>

	分類
<p>オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)</p>	<p>B2 (2019年11月)</p>

<参考：分類の概要>

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

(2) 小児に関する海外情報

本邦における「9.7 小児等」の項の記載は以下のとおりであり、米国の添付文書及び欧州連合(EU)のSmPCとは異なる。

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。
--

出典	記載内容
米国の添付文書 (2016年7月)	Usage in Children: Safety and effectiveness in children have not been established.
欧州のSmPC (2021年4月)	Paediatric population: Hypovase is not recommended for the treatment of children under the age of 12 years since safe conditions for its use have not been established.

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。

（掲載根拠：「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する Q&A について（その3）」令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課事務連絡）

(1) 粉碎

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

製造販売

ファイザー株式会社
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7

