

alacepril (JP)

アラセプリル

ACE阻害剤

214

【基本電子添文】 セタプリル錠2024年10月改訂

【製品】 規制等：[処方] 《セタプリル錠12.5・25mg
1988.03.29承認》

アラセプリル [局] 錠12.5・25・50mg（長生堂－日本ジェネ
リック 日医工 日新）

アラセプリル [局] 錠25mg（沢井）

セタプリル [局] Cetapril錠25mg（住友ファーマ）

【組成】 [錠剤]：1錠中12.5mg, 25mg, 50mg

【効能・効果】 本態性高血圧症，腎性高血圧症

【用法・用量】 アラセプリルとして1日25～75mg，1～2回に分
服（増減）。重症例でも1日最大量100mgまで

用法関連注意：腎機能障害のある患者及び腎疾患の既往歴の
ある患者（重篤な腎機能障害のある患者を除く）に投与する場
合には，少量かつ1日1回投与より開始し，増量を必要とする場
合は，患者の状態を十分に観察しながら徐々に行う（特定背景
関連注意②⑥，薬物動態⑥参照）

【禁忌】 ①本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 ②
サクビト rilルバルサルタンナトリウム水和物を投与中又は投
与中止から36時間以内の患者（相互作用①参照） ③血管浮
腫の既往歴のある患者（アンギオテンシン変換酵素阻害剤等
の薬剤による血管浮腫，遺伝性血管浮腫，後天性血管浮腫，
特発性血管浮腫等）[高度の呼吸困難を伴う血管浮腫を発現
することがある]（重大な副作用⑧参照） ④デキストラン
硫酸固定化セルロース，トリプトファン固定化ポリビニルア
ルコール，フェニルアラニン固定化ポリビニルアルコール，
又はデキストラン硫酸及びL-トリプトファン固定化セルロース
を用いた吸着器によるアフエレーシスを施行中の患者（相互
作用①参照） ⑤アクリロニトリルメタリルスルホン酸ナト
リウム膜（AN69）を用いた血液透析施行中の患者（相互作用
①参照） ⑥妊婦又は妊娠している可能性のある女性（特定
背景関連注意④参照） ⑦アリスキレンフマル酸塩を投与中
の糖尿病患者（ただし，他の降圧治療を行ってもなお血圧の
コントロールが著しく不良の患者を除く）（相互作用①参
照）

【重要な基本的注意】 ①降圧作用に基づくめまい，ふらつきが
現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
機械を操作する際には注意させる ②手術前24時間は投与しな
いことが望ましい **【特定背景関連注意】** ①合併症・既往歴等
のある患者 ④両側性腎動脈狭窄のある患者又は片腎で腎動脈
狭窄のある患者：治療上やむを得ないと判断される場合を除
き，使用は避ける。腎血流量の減少や糸球体過剰の低下によ
り急速に腎機能を悪化させるおそれがある ⑥高カリウム血症
の患者：治療上やむを得ないと判断される場合を除き，使用
は避ける。高カリウム血症を増悪させるおそれがある。また，腎

機能障害，コントロール不良の糖尿病等により血清カリウム値
が高くなりやすい患者では，血清カリウム値に注意する ③重
症の高血圧症患者：投与は少量より開始し，増量する場合は，
患者の状態を十分に観察しながら徐々に行う。初回投与後一過
性の急激な血圧低下を起こす場合がある ④厳重な減塩療法中
の患者：投与は少量より開始し，増量する場合は，患者の状態
を十分に観察しながら徐々に行う。初回投与後一過性の急激な
血圧低下を起こす場合がある（相互作用②参照） ②腎機能障害
患者 ④重篤な腎機能障害のある患者：血清クレアチニン値が
3mg/dLを超える場合には，投与量を減らすか又は投与間隔を
延ばすなど慎重に投与する。活性代謝物の血中濃度が上昇し，
過度の血圧低下，腎機能の悪化が起こるおそれがある（薬物動
態⑥参照） ⑥腎機能障害のある患者及び腎疾患の既往歴のある
患者（重篤な腎機能障害のある患者を除く）：投与は少量かつ1
日1回投与より開始し，増量を必要とする場合は，患者の状態
を十分に観察しながら徐々に行う。活性代謝物の血中濃度が上
昇するおそれがある（用法関連注意，薬物動態⑥参照） ③血液
透析中の患者：投与は少量より開始し，増量する場合は，患者
の状態を十分に観察しながら徐々に行う。初回投与後一過性の
急激な血圧低下を起こす場合がある（相互作用②参照） ③生殖
能を有する者 妊娠する可能性のある女性：妊娠していること
が把握されずアンギオテンシン変換酵素阻害剤又はアンギオテ
ンシンⅡ受容体拮抗剤を使用し，胎児・新生児への影響（腎不
全，頭蓋・肺・腎の形成不全，死亡等）が認められた例が報告
されている。本剤の投与に先立ち，代替薬の有無等も考慮して
本剤投与の必要性を慎重に検討し，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。また，投与が必要な
場合には次の注意事項に留意する（特定背景関連注意④参照）
④投与開始前に妊娠していないことを確認する。投与中も，妊
娠していないことを定期的に確認する。投与中に妊娠が判明し
た場合には，直ちに中止する ⑤次の事項について，投与開始
時に患者に説明する。また，投与中にも必要に応じ説明する ⑦
妊娠中に本剤を使用した場合，胎児・新生児に影響を及ぼすリ
スクがある ④妊娠が判明した又は疑われる場合は，速やかに
担当医に相談する ⑤妊娠を計画する場合は，担当医に相談す
る ④妊婦：妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与
しない。また，投与中に妊娠が判明した場合には，直ちに中止
する。妊娠中期及び末期にアンギオテンシン変換酵素阻害剤又
はアンギオテンシンⅡ受容体拮抗剤を投与された患者で羊水過
少症，胎児・新生児の死亡，新生児の低血圧，腎不全，高カリ
ウム血症，頭蓋の形成不全及び羊水過少症によると推測される
四肢の拘縮，頭蓋顔面の変形，肺の低形成等が現れたとの報告
がある。また，海外で実施されたレトロスペクティブな疫学調
査で，妊娠初期にアンギオテンシン変換酵素阻害剤を投与され
た患者群において，胎児奇形の相対リスクは降圧剤が投与され
ていない患者群に比べ高かったとの報告がある（禁忌⑥，特定
背景関連注意③参照） ⑤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。動物実験
（ラット）で乳汁中へ移行することが認められている ⑥小児
等：小児等を対象とした臨床試験は実施していない ⑦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。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

【相互作用】 ①併用禁忌

薬剤名	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
サクビトリルバルサルタンナトリウム水和物（エンレスト） （禁忌②参照）	血管浮腫が現れるおそれがある。サクビトリルバルサルタンナトリウム水和物が投与されている場合は、少なくとも本剤投与開始36時間前に中止する。また、本剤投与終了後にサクビトリルバルサルタンナトリウム水和物を投与する場合は、本剤の最終投与から36時間後までは投与しない	併用により相加的にブラジキニンの分解が抑制される可能性がある
デキストラン硫酸固定化セルロース、トリプトファン固定化ポリビニルアルコール、フェニルアラニン固定化ポリビニルアルコール、又はデキストラン硫酸及びL-トリプトファン固定化セルロースを用いた吸着器によるアフェレーシスの施行（リボソーバー、リボソーバーLA-15、セレソープ、イムソーバTR、イムソーバ、レオカーナ） （禁忌④参照）	ショックを起こすことがある	陰性に荷電したこれらの吸着材により血中キニン系の代謝が亢進し、本剤によりブラジキニンの代謝が妨げられ蓄積すると考えられている
アクリロニトリルメタリルスルホン酸ナトリウム膜を用いた透析（AN69） （禁忌⑤参照）	アナフィラキシーを発現することがある	多価イオン体であるAN69により血中キニン系の代謝が亢進し、本剤によりブラジキニンの代謝が妨げられ蓄積すると考えられている
アリスキレンフマル酸塩（ラジレス）（糖尿病患者に使用する場合。ただし、他の降圧治療を行ってもなお血圧のコントロールが著しく不良の患者を除く） （禁忌⑦参照）	非致死性脳卒中、腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧のリスク増加が報告されている	レニン-アンギオテンシン系阻害作用が増強される可能性がある

②併用注意

薬剤名	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
カリウム保持性利尿剤 ・スピロノラクトン ・トリウムテン等 カリウム補給剤 ・塩化カリウム等	血清カリウム値が上昇することがある	本剤によりアンギオテンシンⅡが低下してアルドステロンの分泌減少をきたし、カリウム排泄量が少なくなる。特に腎機能障害のある患者では注意する
アリスキレンフマル酸塩	腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧を起こすおそれがあるため、腎機能、血清カリウム値及び血圧を十分に観察する。なお、eGFRが60mL/min/1.73m ² 未満の腎機能障害のある患者へのアリスキレンとの併用については、治療上やむを得ないと判断される場合を除き避ける	併用によりレニン-アンギオテンシン系阻害作用が増強される可能性がある
アンギオテンシンⅡ受容体拮抗剤	腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧を起こすおそれがあるため、腎機能、血清カリウム値及び血圧を十分に観察する	

カリジノゲナーゼ製剤	本剤との併用により過度の血圧低下が引き起こされる可能性がある	カリジノゲナーゼによるキニン産生作用とアンギオテンシン変換酵素阻害剤のキニン分解抑制作用により、キニン系が亢進し、血管平滑筋の弛緩が増強されると考えられる
利尿降圧剤 ・チアジド系利尿剤（ヒドロクロロチアジド等） ・ループ利尿剤等 減塩療法 血液透析の治療（特定背景関連注意①④②③参照）	本剤を初めて併用する場合、降圧作用が増強するおそれがあるので、減量するなど慎重に投与する	利尿降圧剤の投与中や減塩療法、血液透析の治療中には血漿レニン活性が上昇しており、本剤の投与により急激な血圧低下をきたす。特に最近利尿降圧剤投与を開始した患者では注意する
リチウム	他のアンギオテンシン変換酵素阻害剤（カプトプリル、エナラプリル、リシノプリル）との併用により、リチウム中毒が報告されているので、本剤においても血中のリチウム濃度に注意する	リチウムとナトリウムは近位尿細管で競合的に再吸収されており、本剤によるナトリウム排泄作用によりリチウムの再吸収が促進される
アロプリノール	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。患者の状態を注意深く観察し、発熱を伴う発疹等の過敏症状が発現した場合には直ちに両剤を中止する	機序は不明である。特に腎機能障害のある患者では注意する
非ステロイド性消炎鎮痛剤 ・インドメタシン等	本剤の降圧作用が減弱することがある	非ステロイド性消炎鎮痛剤のプロスタグランジン合成阻害作用により、本剤のプロスタグランジンを介した降圧作用が減弱される
	腎機能が低下している患者では、更に腎機能が悪化するおそれがある	プロスタグランジン合成阻害作用により、腎血流量が低下するためと考えられる

【副作用】 次の副作用が現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中止するなど適切な処置を行う（発現頻度は使用成績調査を含む）

①重大な副作用 ④血管浮腫（0.1%未満）：呼吸困難を伴う顔面、舌、声門、喉頭の腫脹を症状とする血管浮腫が現れることがある（禁忌③参照） ⑥無顆粒球症（0.1%未満）、汎血球減少（頻度不明） ⑦天疱瘡様症状（0.1%未満） ⑧高カリウム血症（0.1%未満） ⑨急性腎障害（頻度不明）

②その他の副作用

分類	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
腎臓		BUN、クレアチニンの上昇、蛋白尿	
血液		白血球減少、貧血、血小板減少、好酸球増多	
過敏症	発疹	掻痒感	
循環器		起立性低血圧、胸部不快感、動悸	
呼吸器	咳嗽	咽喉頭異物感、喀痰増加	
精神神経系	めまい、ふらつき感	頭痛、頭重、眠気、浮遊感、四肢	

		しびれ感、口内しびれ感	
消化器	悪心	下痢、食欲不振、胃部不快感、胸やけ、口渇、口内炎	
味覚※1		味覚異常	
肝臓	ALTの上昇	AST、 γ -GTP、ALPの上昇	黄疸
その他	全身倦怠感	浮腫、顔面のほてり、血清カリウム値の上昇、抗核抗体の陽性例	低血糖※2

※1：このような場合には、減量又は中止するなど適切な処置を行う（通常、味覚異常は可逆的である）。※2：（その他の注意参照）

【臨床検査結果に及ぼす影響】尿中ケトン（アセトン）が偽陽性を呈することがある 【その他の注意】臨床使用に基づく情報：インスリン又は経口血糖降下剤の投与中にアンギオテンシン変換酵素阻害剤を投与することにより、低血糖が起こりやすいとの報告がある（その他の副作用参照） 【保存等】室温保存。有効期間：3年

【薬物動態】①血中濃度 ②単回投与 ③健康成人に25、50mg（各6例）、空腹時1回経口投与後の遊離型カプトプリル濃度

投与量	T _{max} (h)	C _{max} (ng/mL)	t _{1/2} (h)
25mg	1	86.1	1～2
50mg	0.5	150	1～2

④本態性高血圧症患者（7例）に非空腹時25mgを1回経口投与後のカプトプリル濃度（平均値 ± 標準誤差）

測定対象	T _{max} (h)	C _{max} (ng/mL)	t _{1/2} (h)
遊離型	3.4 ± 0.2	71.9 ± 11.0	2.6 ± 0.6
総濃度	3.9 ± 0.4	305.9 ± 66.2	7.2 ± 0.9

⑤健康成人（8例）に非空腹時100mgを1回経口投与後のデアセチルアラセプリル濃度（平均値 ± 標準偏差）

測定対象	T _{max} (h)	C _{max} (ng/mL)	t _{1/2} (h)
遊離型	2.4 ± 1.4	23.6 ± 14.0	3.7
総濃度	3.9 ± 2.9	64.3 ± 13.3	4.9

⑥効果発現時間：投与後約1時間（本態性高血圧症患者、非空腹時25mg 1回投与） ⑦吸収 吸収率（参考）：約67%（ラッ

ト） ⑧分布 血漿蛋白結合率：約61%（健康成人、空腹時50mg 投与1時間後） ⑨代謝 ⑩主な代謝産物：カプトプリル（活性あり）、デアセチルアラセプリル（活性あり） ⑪代謝経路：アラセプリルは体内で脱アセチル化され、デアセチルアラセプリルとなり、次いでフェニルアラニンを遊離し、カプトプリルに至る。デアセチルアラセプリルとカプトプリルは生体内で蛋白質等とジスルフィド結合を行う ⑫排泄 ⑬排泄経路：主として尿中 ⑭排泄率：投与後24時間までに60～70%が遊離型カプトプリル及びジスルフィド結合体として尿中排泄（健康成人） ⑮特定の背景を有する患者 腎機能障害患者：血清クレアチニン2.0～8.7mg/dL（平均4.4mg/dL）の患者（9例）及び健康成人（7例）に空腹時50mgを1回投与後の血漿中濃度（用法関連注意、特定背景関連注意②③④参照） ⑯血漿中カプトプリル濃度

パラメータ	遊離型（腎障害者）	遊離型（健康成人）	総濃度（腎障害者）	総濃度（健康成人）
T _{max} (h)	1.1 ± 0.2	1.0 ± 0.2	2.8 ± 0.4	1.6 ± 0.4
C _{max} (ng/mL)	239 ± 33	226 ± 53	1,433 ± 142	764 ± 73
t _{1/2} (h)	1.6 ± 0.2	1.5 ± 0.1	18.3 ± 3.8	5.0 ± 0.1
AUC (ng・h/mL)	763 ± 56	861 ± 47	21,006 ± 2,269	4,056 ± 395

⑭排泄率〔総カプトプリル尿中排泄率（%）（0～24時間）〕：腎障害者34.5 ± 3.4、健康成人59.2 ± 2.8 【臨床成績】有効性及び安全性に関する試験 国内臨床試験：二重盲検比較試験を含む総計617例の臨床成績（有効率）は、本態性高血圧症〔一般試験：71%（263/373）、二重盲検：55%（111/202）〕、腎性高血圧症〔一般試験：60%（25/42）〕 【薬効薬理】①作用機序：ラット *in vivo* 試験でACE（キニナーゼⅡ）を阻害することにより昇圧系（レニン・アンギオテンシン・アルドステロン系）を抑制、降圧系（カリクレイン・キニン・プロスタグランジン系）を亢進、降圧作用を発現。デアセチルアラセプリルは動脈血管壁へ良好に移行し、末梢交感神経系を抑制することから、本剤の降圧作用及びその持続性に関与していると考えられる ②降圧効果：本態性高血圧症患者を対象とした臨床薬理試験で、本剤はカプトプリルと同重量投与で同等の降圧効果を示し、かつ、より長い作用持続性を示した

【性状】アラセプリルは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、エタノールに（95）にやや溶けやすく、水に溶けにくい。水酸化ナトリウム試液に溶ける