

注射用抗アルドステロン剤

水分・電解質代謝改善剤

劇薬・処方せん医薬品*

カンレノ酸カリウム 静注用100mg「サワイ」

*カンレノ酸カリウム 静注用200mg「サワイ」

POTASSIUM CANRENOATE

注射用カンレノ酸カリウム

日本標準商品分類番号

8 7 2 1 3 3

	*100mg	200mg
* 承認番号	22300AMX00663000	22300AMX00448000
薬価収載	2011年11月	2011年11月
販売開始	2011年11月	1990年10月

** 貯法：室温保存
光により徐々に着色することがあるので、外箱開封後の保存には注意すること
使用期限：外箱等に表示

※注意-医師等の処方せんにより使用すること

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 無尿又は腎不全の患者〔腎機能を更に悪化させるおそれがある。また、腎からのカリウム排泄が低下しているため、高カリウム血症を誘発又は増悪させるおそれがある。〕
- 2) 腎機能の進行性悪化状態の患者〔腎からのカリウム排泄が低下しているため、高カリウム血症を誘発又は増悪させるおそれがある。〕
- 3) 高カリウム血症の患者〔高カリウム血症を増悪させるおそれがある。〕
- 4) エプレレノン又はタクロリムスを投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕
- 5) アジソン病の患者〔アジソン病ではアルドステロン分泌低下により、カリウム排泄障害を来しているため、高カリウム血症となるおそれがある。〕
- 6) 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- 7) てんかん等の痙攣性素因のある患者〔動物試験で、痙攣誘発及び異常脳波が報告されている。〕

【効能・効果に関連する使用上の注意】

本剤の適用対象は、経口抗アルドステロン薬の服用が困難で、高アルドステロン症によると考えられる症状であり、投与に際しては、特に適応、症状を考慮し、他の治療法によって十分に治療効果が期待できない場合にのみ本剤の投与を考慮すること。

【用法・用量】

カンレノ酸カリウムとして、通常成人1回100～200mgを1日1～2回、日局ブドウ糖注射液、生理食塩液又は注射用水10～20mLに溶解して、ゆっくりと静脈内注射する。

なお、症状により適宜増減するが、1日投与量として600mgを超えないこと。また、投与期間は原則として2週間を超えないこと。〔注射液調製法〕

1. 1バイアルあたりカンレノ酸カリウム静注用100mg「サワイ」は10mL、カンレノ酸カリウム静注用200mg「サワイ」は20mLの溶解液に溶解する。
2. はじめに溶解液2～3mLで本剤を溶解し、これを残りの溶解液に混合希釈して調製する。
3. 溶解後は速やかに使用すること〔「適用上の注意」の項参照〕。

【用法・用量に関連する使用上の注意】

本剤は、経口抗アルドステロン薬の服用が可能になった場合及び所期の効果が認められない場合には速やかに投与を中止すること。なお、本剤の投与期間は、原則として2週間までとし、漫然と長期にわたって投与しないよう留意すること。

【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) 心疾患のある高齢者、重篤な冠硬化症又は脳動脈硬化症のある患者〔急激な利尿があらわれた場合、急速な血漿量減少、血液濃縮を来し、血栓塞栓症を誘発するおそれがある。〕
- 2) 肝機能障害のある患者〔ショックがあらわれやすい。また、高カリウム血症が発現するおそれがある。〕
- 3) 腎機能障害のある患者〔高カリウム血症等の電解質異常を起しやす。〕
- 4) 減塩療法時〔水分・電解質が欠乏し、脱水症状や低ナトリウム血症等があらわれやすくなる。〕

2. 重要な基本的注意

- 1) 高カリウム血症等の電解質異常があらわれることがあるので、定期的に検査を行うこと。
- 2) 肝機能障害のある症例ではショックがあらわれやすいので、観察を十分に行い、悪心、悪寒・冷汗、発疹、呼吸困難、チ

【組成・性状】

品名	カンレノ酸カリウム静注用100mg「サワイ」	カンレノ酸カリウム静注用200mg「サワイ」
有効成分・含量	1バイアル中 日局カンレノ酸カリウム 100mg	1バイアル中 日局カンレノ酸カリウム 200mg
添加物	トロメタモール 5mg	L-リシン塩酸塩 4mg pH調節剤
剤形・性状	微黄色～淡黄色の塊の凍結乾燥品 用時溶解して用いる注射液	
pH	9～10 (1バイアル/10mL 5%ブドウ糖注射液、生理食塩液又は注射用水)	9～10 (1バイアル/20mL 5%ブドウ糖注射液、生理食塩液又は注射用水)
浸透圧比	約1.2 (1バイアル/10mL 5%ブドウ糖注射液又は生理食塩液) 約0.2 (1バイアル/10mL 注射用水)	約1.2 (1バイアル/20mL 5%ブドウ糖注射液又は生理食塩液) 約0.2 (1バイアル/20mL 注射用水)

(浸透圧比：生理食塩液に対する比)

【効能・効果】

経口抗アルドステロン薬の服用困難な下記症状(高アルドステロン症によると考えられる)の改善

原発性アルドステロン症

心性浮腫(うっ血性心不全)、肝性浮腫

開心術及び開腹術時における水分・電解質代謝異常

アノーゼ、血圧低下等があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、輸液、副腎皮質ホルモン製剤、昇圧剤の投与等適切な処置を行うこと。

3. 相互作用

1) 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
エブレノン (セララ) タクロリムス (プログラフ)	高カリウム血症が発現することがある。	機序：これらの薬剤と本剤の相加・相乗作用による血清カリウム値の上昇。

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
降圧剤 ACE阻害剤 カルシウム拮抗剤 β遮断剤 等 利尿剤 チアジド系利尿剤 ループ利尿剤	降圧作用又は利尿作用を増強するおそれがあるので、これらの薬剤の用量を調節するなど注意する。	機序：降圧剤又は利尿剤と本剤との相加・相乗作用。
カリウム補給 カリウム保持性利尿剤 スピロラクトン トリアムテレン ACE阻害剤 カプトプリル エナラプリル リシノプリル 等 アンジオテンシン II受容体拮抗剤 ロサルタンカリウム カンデサルタン シレキセチル バルサルタン 等 アリスキレン シクロスボリン ドロスピレノン	高カリウム血症を誘発することがあるので、血清カリウム値を観察するなど十分注意する。	機序：これらの薬剤と本剤の相加・相乗作用による血清カリウム値の上昇。 危険因子：腎障害患者、高齢者
リチウム製剤 炭酸リチウム	利尿剤又はACE阻害剤との併用により、リチウム中毒を起こすことが報告されているので、血中リチウム濃度に注意すること。	ナトリウムイオン不足はリチウムイオンの貯留を促進するといわれているため、ナトリウム排泄を促進することにより起こると考えられる。
非ステロイド性消炎鎮痛剤 インドメタシン等	カリウム保持性利尿剤との併用により、腎機能障害患者における重度の高カリウム血症の発現が報告されている。	プロスタグランジン産生が抑制されることによって、カリウム貯留作用による血清カリウム値の上昇が起こると考えられる。 危険因子：腎機能障害
乳酸ナトリウム	乳酸ナトリウムのアルカリ化作用の減弱を来すことがある。	本剤により高カリウム性アシドーシスが惹起され、乳酸ナトリウムのアルカリ化作用と拮抗する可能性がある。
塩化アンモニウム コレステラミン	類薬スピロラクトンとの併用により代謝性アシドーシスを来すとの報告がある。	これらの薬剤と本剤の相加・相乗作用が起こるおそれがある。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) **ショック**：ショックがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、悪心、悪寒・冷汗、発疹、呼吸困難、チアノーゼ、血圧低下等があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、輸液、副腎皮質ホルモン製剤、昇圧剤の投与等適切な処置を行うこと。
- (2) **電解質異常(高カリウム血症、低ナトリウム血症、高ナトリウム血症、低クロール血症、高クロール血症等)**：高カリウム血症、低ナトリウム血症、低クロール血症、高ナトリウム血症、高クロール血症等の電解質異常があらわれることがあるので、異常が認められた場合には、減量又は休薬等の適切な処置を行うこと。
また、電解質異常に伴い、**不整脈**等があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	発疹等
血液 ^{注1)}	白血球増加、貧血、白血球減少
腎臓 ^{注2)}	BUN上昇、血清クレアチニン値上昇
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇
消化器	嘔気、嘔吐、下痢、口渇、食欲不振
精神神経系	頭痛、妄想等 ^{注1)}
内分泌	女性型乳房、男性で性欲減退、女性で多毛、声の低音化、月経異常、乳房痛等
投与部位 ^{注3)}	注射部位の疼痛
その他	発熱、全身倦怠感、心悸亢進、胸部不快感、顔面潮紅

注1) 投与を中止すること。

注2) 減量又は休薬等の適切な処置を行うこと。

注3) 「適用上の注意」の項参照

5. 高齢者への投与

高齢者には、次の点に注意し、少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。

- 1) 高齢者では急激な利尿は血漿量の減少を来し、脱水、低血圧等による立ちくらみ、めまい、失神等を起こすことがある。
- 2) 特に心疾患等で浮腫のある高齢者では急激な利尿は急速な血漿量の減少と血液濃縮を来し、脳梗塞等の血栓塞栓症を誘発するおそれがある。
- 3) 高齢者では腎機能又は肝機能が低下していることが多いため、高カリウム血症があらわれやすい。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) **妊婦**：妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、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。
- 2) **授乳婦**：授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。〔類薬スピロラクトンでヒト乳汁中へのカンレノ酸の移行が認められている。〕

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. 適用上の注意

- 1) **投与経路**：本剤は静脈内注射にのみ使用すること。

【主要文献及び文献請求先】

* 主要文献

- 1)、2) 沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]
- ・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]
沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL: 0120-381-999 FAX: 06-6394-7355

- 2) **調製方法**: 本剤は用時調製すること。調製後、長時間放置すると沈殿が析出することがあるので、溶解後は速やかに使用すること。
- 3) **調製時**: pH等の変化により配合変化が起こりやすいので、他の薬剤との配合に際しては注意すること。
- 4) **投与时**: **静脈内投与により血管痛を起こすことがあるので、注射部位、注射方法等に十分注意し、注射速度をできるだけ遅くすること。また、注射に際しては血管外に漏出しないよう注意すること。**

9. その他の注意

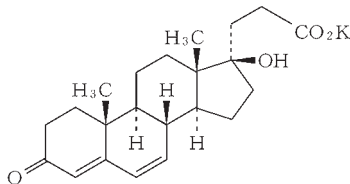
- 1) ラットに24ヶ月経口投与した癌原性試験で、肝臓、甲状腺、精巣、乳腺の腫瘍及び骨髄性白血病が、対照群に比し有意に増加したとの報告がある。
- 2) 類似化合物(スピロラクトン)をラットに大量投与した慢性毒性試験において、内分泌臓器の腫瘍及び肝臓の増殖性変化がみられたとの報告がある。
また、スピロラクトンを長期間服用した患者(男女とも)に乳癌が発生したとする症例報告がある。

【薬効薬理】

1. 生体内でラクトン環を形成して、カンレノンに変換することにより作用を現す。
2. 抗アルドステロン作用、抗デオキシコルチコステロン作用などのミネラルコルチコイド拮抗作用に基づき、遠位尿細管におけるナトリウムの再吸収を抑制することにより、スピロラクトンと同程度の利尿作用を示す。
3. 血圧、糸球体ろ過値及び腎血流量にほとんど影響を及ぼさない。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名: カンレノ酸カリウム (Potassium Canrenoate)
化学名: Monopotassium 17-hydroxy-3-oxo-17 α -pregna-4,6-diene-21-carboxylate
分子式: C₂₂H₂₉KO₄
分子量: 396.56
構造式:



性状: カンレノ酸カリウムは微黄白色～微黄褐色の結晶性の粉末である。水に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、クロロホルム又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

- ・安定性試験
- *100mg: バイアルに充てんしたものをを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。¹⁾
- 200mg: バイアルに充てんしたものをを用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。²⁾

【包装】

- *カンレノ酸カリウム静注用100mg「サワイ」: 10バイアル
- カンレノ酸カリウム静注用200mg「サワイ」: 10バイアル

製造販売元
沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K12 A120926

