

◎ガスターD錠 [内], ◎ガスター注射液 [注]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】ファモチジン (U) famotidine 【分類】H2受容体拮抗剤

【単位】◎10mg・◎20mg/D錠, ◎10mg・▼20mg/A

【常用量】■内服：炎症20mg/日, 潰瘍40mg/日 ■注射：1回20mg

【用法】■内服：分1～2 ■注射：静注, 筋注 1日1～2回

【透析患者への投与方法】■内服：透析後20mg, または1日1回10mg (1) ■注射：透析後10mgまたは1日1回5mg (1)

【その他の報告】過量投与による見当識障害, 意識障害, 痙攣などの精神神経症状や顆粒球減少症が腎不全では発症しやすいため減量 (5)

経口20mgを58～136hr毎 (4) 経口20mgを24hr毎 (3)

10mg寝る前か20mgを週3回経口, 10mg静注を24hr毎 (17)

経口20mg/日も適用できるかも知れないが, 一部では精神症状に関連することがある (Redmond AM, et al: Am J Med Sci 2005 PMID: 16020993)

【PD】経口10mg/日, 注射5mg/日 (1) 5～10mg/日経口寝る前, 10mg/日静注 (17)

【CRRT】10～20mg/日 (17) 10mgを12hr毎に静注 (17)

【保存期CKD患者への投与方法】■経口剤：Ccr 60mL/min以上：減量の必要なし, Ccr 31～59mL/min：20mg/日, Ccr 30mL/min以下：10mg/日もしくは20mgを2～3日に1回 (1)

【その他の報告】GFR>50mL/min：20mg/日を寝る前か10mgを1日2回, GFR 10～50mL/min：10～20mg/日を寝る前, GFR 10mL/min未満：5～10mg/日を寝る前 (17)

■注射：Ccr>60mL/min：20mgを12hr毎, Ccr 31～59mL/min：20mgを24hr毎もしくは10mgを12hr毎, Ccr 30mL/min以下：10mgを2日に1回もしくは5mgを1日1回 (1)

GFR>50mL/min：常用量の50～75%に減量, GFR 10～50mL/min：常用量の10～50%に減量, GFR<10mL/min：常用量の10%に減量 (12)

Ccr>50mL/min：常用量, Ccr 10～50mL/min：75%に減量, Ccr<10mL/min：50%に減量 (10)

GFR 10～50mL/min：50%に減量, GFR<10mL/min：20mgを24hr毎 (3)

CCr 60mL/min/1.48m²超：常用量, CCr 30～60mL/min/1.48m²：50%に減量, CCr 30mL/min/1.48m²未満：25%に減量 (Takabatake T, et al: Eur J Clin Pharmacol 28: 327-31, 1985 PMID: 2861096)

【特徴】選択的H2受容体拮抗剤。シメチジンにみられる薬物代謝酵素阻害を認めず, 肝血流減少作用も認められない。

【主な副作用・毒性】ショック, アナフィラキシー, SJS, TEN, QT延長, 過敏症, 肝機能障害, 血球減少, 神経症状 [錯乱・幻覚・鬱状態], 痙攣, 精力減退, 女性化乳房, プロラクチン上昇, 頻脈, 徐脈, 低血圧, 筋肉痛など

【安全性に関する情報】炭酸Caを投与している透析患者でH2受容体拮抗剤を投与すると血清Caの低下と血清リン値の上昇をきたしやすい (Clin Nephrol 50: 198-9, 1998) ESRD患者に平均24mg/日に平均5.5日間投与した時の精神症状発現率8% (Redmond AM, et al: Am J Med Sci 330: 8-10, 2005 PMID: 16020993) 腎障害患者に減量しないと中枢毒性を発現する (Odeh M, et al: J Clin Gastroenterol 27: 253-4, 1998 PMID: 9802455) 腎障害患者や中枢外科術後患者では中枢毒性に注意 (Yoshimoto K, et al: Clin Pharmacol Ther 55: 693-700, 1994 PMID: 8004885) 腎機能に応じて減量しないと毒性の発現頻度が上昇 (Manlucu J, et al: Nephrol Dial Transplant 20: 2376-84, 2005 PMID: 16091377)

【モニターすべき項目】VB12濃度 (重症の胃底部胃炎に長期投与することによりVB12の腸吸収に必要で胃粘膜から分泌される内因子の分泌障害が起こるかもしれない), CBC, 肝機能, 腎機能

【吸収】40% (11) 速やかに吸収されるが吸収は不完全 (U) ka=1.235/hr (1)

【F】37～43% (10) 40～45% (U) 37% (1) 40～50% (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 21: 178-94, 1991 PMID: 1764869) 20～66% (Kroemer H: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 25: 458-63, 1987 PMID: 2888738)

【tmax】内服：2～3hr (U) 筋注：30min (1)

【代謝】肝；初回通過効果はほとんど受けない (U) 5～10%は主としてS-オキシド体に代謝 (1) S-オキシド体の活性はない [1/270] (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率65～70% (U) 80% (10) 65～80% (12) 70% (4) 57.8～96.4% [iv] (1) 70% [iv] (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 21: 178-94, 1991 PMID: 1764869)

【CL】412mL/min [iv] (1) 【腎CL】304mL/min [iv] (1) 310mL/min (Yeh KC, et al: Biopharm Drug Dispos 8: 549-60, 1987 PMID: 2892544) 15L/hrで尿管分泌が関与 (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 21: 178-94, 1991 PMID: 1764869) 【非腎CL/総CL】20% (10)

【t1/2】2～3hr (2) 2.6～9hr (4) 2.5～4hr(10,12) 2.5～3.5hr (U) 3.6hr (Kroemer H: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 25: 458-63, 1987 PMID: 2888738) 【ke】0.329/hr (1) 【透析患者のt1/2】13.7～22.5hr (2) 20hr以上 (U) 12hr (10) 20～24hr (12) 27hr (Gladziwa U, et al: Br J Clin Pharmacol 26: 315-21, 1988 PMID: 2902874)

【蛋白結合率】19.3% (1) 16% (10) 15～20% (U,12) 20% (11) 15～22% (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 21: 178-94, 1991 PMID: 1764869)

【Vd】67.8L/man (1) 1.4L/kg (1) 1.2L/kg (10) 0.8～1.3L/kg (腎機能の影響無し) 乳汁、脳脊髄液に移行する (U) 1.1～1.4L/kg (11) 0.8～1.4L/kg (12) 1.0～1.3L/kg (Echizen H: Clin Pharmacokinetics 21: 178-94, 1991 PMID: 1764869) 1.13L/kg (Kroemer H: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 25: 458-63, 1987 PMID: 2888738)

2888738) 透析患者で $1.3 \pm 0.7 \text{L/kg}$ (Gladziwa U, et al: Br J Clin Pharmacol 26: 315-21, 1988 PMID: 2902874)

【MW】 337.45

【透析性】 42% (1) 条件により異なる (Gladziwa U, et al: Br J Clin Pharmacol 26: 315-21, 1988 PMID: 2902874)

【TDM のポイント】 正常腎機能者では TDM の対象にはならないが、中毒症状との関連を確認するために血中濃度評価が有用な場合がある。50%HCl 阻止血漿濃度 13ng/mL 、75%HCl 阻止血漿濃度は 50ng/mL (1) 胃酸分泌 50%抑制血漿濃度 13ng/mL (U) 胃内 pH4.0 を越えるための血漿濃度は $17 \sim 25 \text{ng/mL}$ [Emax] (Echizen H, et al: Clin Pharmacol Ther 44: 690-8, 1988 PMID: 2904311)

【OW 係数】 0.15 [1-オクタノール水系, pH7] (1) 【pKa】 7.06 (1) 【薬物動態】

【相互作用】 イトラコナゾールカプセルの吸収率低下 (1) 胃内 pH 上昇による他剤の吸収変化に注意 (1) 強い制酸剤との同時投与で F が低下 (Barzaghi N, et al: J Clin Pharmacol 29: 670-2, 1989 PMID: 2569486) アルコールの吸収を増大させる可能性が指摘されたがその後否定 (Kendall MJ, et al: Br J Clin Pharmacol 37: 371-4, 1994 PMID: 8018458)

【肝障害患者における情報】 減量の必要はない (Morgan MY, et al: Postgrad Med J 62 Suppl 2: 29-37, 1986 PMID: 2890149, Morgan MY, et al: Aliment Pharmacol Ther 4: 83-96, 1990 PMID: 2104076, Vincon G, et al: Eur J Clin Pharmacol 43: 559-62, 1992 PMID: 1483496)

【小児における情報】 ラニチジンよりよい選択 (Madani S, et al: J Clin Pharmacol 54: 201-5, 2014 PMID: 24258773)

【効果発現時間】 内服 : 1hr 【最大効果発現時間】 内服 : 1~3hr, 筋注 : 30min

【効果持続時間】 内服 : 10~12hr

【更新日】 20201013

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。