

△タガメット錠 [内], ▼注射液 [注]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】シメチジン (U) Cimetidine 【分類】H2受容体拮抗剤

【単位】△200mg/錠, ▼200mg/A

【常用量】内服・注射：800mg/日

【用法】■内服：分2（朝と眼前）もしくは分4（毎食後と眠前） ■注射：分4

【透析患者への投与方法】1回200mg1日1回 [Ccr 4mL/min以下] (1) 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に腎不全では発症しやすいとされており要注意 (5)

【その他の報告】25%に減量 (3) 50%に減量し1日2回投与 (4,10) 50%に減量 (6) 透析患者の二次性副甲状腺機能亢進症による異所性石灰化に有効という報告 (整形外科 46: 1549-1554,1995) 透析患者の関節周囲の石灰沈着症に有効 (整・災害 41: 87-91,1998) 透析患者の高Ca血症に有効 (Ann Intern Med 93: 573-574,1980) という報告があるがメカニズムは不明 (5) 150mgを12hr毎に静注もしくは200mgを1日1回経口 [HD日はHD後] (17) 腎不全患者では腎外CLが62%低下する (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinetics 32: 30-57,1997)

【PD】25%に減量 (3) 150mgを12hr毎に静注もしくは200mgを1日1回経口 (17)

【CRRT】25%に減量 (3) 150mgを8hr毎に静注もしくは200mgを1日2回経管投与 (17)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 50mL/min以上：1回200mg1日4回, Ccr 30~49mL/min：1回200mg1日3回, Ccr 5~29mL/min：1回200mg1日2回, Ccr 4mL/min以下：1回200mg1日1回 (1)

【その他の報告】Ccr>50mL/min：常用量, Ccr 10~50mL/min：75%に減量, Ccr<10mL/min：50%に減量 (10)

GFR>50mL/min：減量の必要なし, GFR 10~50mL/min：50%に減量, GFR<10mL/min：25%に減量 (3,12)

GFR>50mL/min：300mgを8hr毎に静注もしくは400mgを1日2回経口, GFR 10~50mL/min：150mgを8hr毎に静注もしくは200mgを1日2回経口, GFR 10mL/min未満：150mgを12hr毎に静注もしくは200mgを1日1回経口 [高齢者には投与を避ける] (17)

【特徴】H2拮抗薬はヒスタミンによる胃酸分泌だけでなく、生理的胃酸分泌刺激物質の作用にも遮断効果を及ぼしうることから、胃液の基礎分泌、夜間分泌、摂食時の分泌、胃の拡張による分泌などに対して幅広い抑制効果を示す。

【主な副作用・毒性】過敏症, 肝障害, 汎血球減少, 血球減少, 精神神経症状 (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, 低血圧など。

【モニターすべき項目】ビタミン B12 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

【吸収】90%以上 (11)

【F】70% (10,14) 60~70%、速やかに吸収される (U) 60% (13)

【tmax】2hr (1) 45min~1.5hr (U) 0.5~1.5hr, 食物との同時摂取で延長 (13) 【Cmax】400mg単回投与後2~3μg/mL (13)

【代謝】肝で経口投与量の30~40%が代謝される (1,U) 腎不全患者では腎外クリアランスが62%低下する (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinetics 32: 30-57, 1997)

【排泄】尿中未変化体排泄率70% [iv, 24hrまで] (1) 40~70% (4,10) 62% (13) 70% (14) 50~70% (12) 48% [po] (U) 75% [iv] (U)

【CL】655mL/min [iv], 腎CL375mL/min (1) 600mL/min, 12mL/min/kg (15) 8.3mL/min/kg (13) 【非腎CL/総CL】30% (10)

【t1/2】2.0hr (U,10,13,14) 1.5~2hr (12) 【腎不全患者のt1/2】5hr (10,12) Ccr 20~50mL/min：2.9hr, Ccr 20mL/min未満：3.7hr, 無尿：5hr (U) Ccr 5mL/min未満：5hr (1)

【蛋白結合率】18~26.3% (1) 15~20% (U) 20% (10) 19% (13) 13~25% (12)

【Vd】1.39L/kg (1) 1.3L/kg (10) 0.9~1.1L/kg (6) 2.1L/kg (3) 乳汁・脳脊髄液に移行する (U) 1.8L/kg (14) 1~3L/kg (15) 1.0L/kg (13) 0.8~1.3L/kg (12)

【MW】252.34

【透析性】71% (4) 濃度低下率71% (1) 【透析CL】41~75mL/min (8) 【透析時t1/2】2.5hr (8) 【PDクリアランス】2.7~4.2mL/min (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinetics 32: 30-57,1997)

【TDMのポイント】50%塩酸阻止濃度0.4~0.5μg/mL [食刺激] (1) 0.5~0.9μg/mLで80%以上の酸分泌を抑制する (13) 有効治療域0.25~1μg/mL (14) ペンタガストリン刺激による酸分泌を50%抑制する濃度は0.5μg/mL (U) 正常腎機能者ではTDMの対象にはならない。腎不全患者では意識障害や痙攣、汎血球減少症が起こりやすいが、血中濃度と副作用の関係は確立していない (PDR) 50%塩酸阻止血漿濃度500ng/mL, 0.8~4.0 μg/mLを有効治療域とする報告もある

【O/W係数】2.5 (11) 1.5 [1-オクタノール/水系, pH7] (1)

【相互作用】CYP3A4・2D6を強く阻害, 他のCYPも全て阻害 (8) 制酸剤との併用でbioavailabilityが35%低下する。ワルファリン、テオフィリン、フェニトイン、ベンゾジアゼピン系マイナートランキライザー、三環系抗うつ剤、プロプラノロール、ニフェジピン、イミプラミン、プロカインアミド、モルヒネなどの血中濃度を高めることがある。ワルファリン、テオフィリン、フェニトイン、リドカインとの併用は慎重投与 (1) カチオン性薬剤の腎クリアランスを低下させるが、OCT2ではなくMATE阻害によるものと考えられる (Ito S, et al: J Pharmacol Exp Ther 2012 PMID: 22072731)

【最大効果発現時間】1~2hr

【効果持続時間】4~5hr ; 夜間は6~8hr

【更新日】20240424

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。