

▼アシノン錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】ニザチジン (U) Nizatidine 【分類】H2受容体拮抗薬

【単位】▼75mg・▼150mg/錠

【常用量】■胃潰瘍・十二指腸潰瘍・逆流性食道炎：300mg/日 ■急性胃炎・慢性胃炎の急性増悪期：150mg/日

【用法】分1～2

【透析患者への投与方法】透析後に150mg、または隔日150mg (1) 過量投与により見当識障害、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 (U)

【その他の報告】25%に減量 (3) 150mgを48～72hr毎 (17)

【PD】150mgを48～72hr毎 (17)

【CRRT】静注製剤を選択 (17)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr>50mL/min：150～300mg/日、Ccr 10～50mL/min：75mgを1日2回、Ccr<10mL/min：75mgを1日1回 (5)

【その他の報告】減量するか投与間隔をあけて投与 (1)

Ccr 20～50mL/min：150mg/日、Ccr<20mL/min：隔日150mg (11)

GFR>50mL/min：75～100%量、GFR 10～50mL/min：150mgを1～2日毎量、GFR<10mL/min：150mgを2～3日毎 (12)

Ccr>50mL/min：常用量、Ccr 10～50mL/min：50%に減量、Ccr<10mL/min：25%に減量 (10)

GFR 10～50mL/min：50%に減量、GFR<10mL/min：25%に減量 (3)

Ccr 20～49mL/min：150mg24hr毎、Ccr 20mL/min未満：150mg48hr毎 (京)

GFR>50mL/min：150～300mgを1日1回、GFR 10～50mL/min：150mgを24～48hr毎、GFR 10mL/min未満：150mgを48～72hr毎 (17)

Ccr 20～50mL/min/1.73m²：150mg/日、Ccr 20mL/min/1.73m²未満：150mgを1日おき (Aronoff GR, et al: Clin Pharmacol Ther 43: 688-95, 1988 PMID: 2897890)

【特徴】チアゾール環の誘導体のH2ブロッカー。CYP酵素に影響を及ぼさず、抗アンドロゲン作用・血清プロラクチン上昇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、発疹、便秘、下痢、肝機能障害、血球減少、頭痛、めまい、しびれ、せん妄、失見当識、女性型乳房、発熱、顔面浮腫、乳汁分泌など

【安全性に関する情報】高齢者で血球減少を発現しやすい経口があるため慎重に観察 (1) 胃癌の症状を遮蔽する可能性 (1)

【モニターすべき項目】ビタミンB12濃度 (長期投与で重症の胃底部の胃炎患者では、内因子の分泌が障害される可能性がある)、CBC

【吸収】90%で速やか (U) 70%以上 (11) 制酸剤の同時服用で吸収が10%減少する (11)

【F】98% (1) 初回通過効果はほとんど受けない (U) 90% (Callaghan JT, et al: Scand J Gastroenterol 136:S9-S17, 1987 PMID: 2892261 [preceding]) 初回通過効果は10% (1) 通常は100%であるが、腎不全時には75%に低下 (Aronoff GR, et al: Clin Pharmacol Ther 43: 688-95, 1988 PMID: 2897890)

【tmax】30min～3hr (U) 1.1±0.5hr (1) 1～2hr (11)

【代謝】一部がN-デスメチル体、スルホキシド体、N-オキシド体に代謝 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率90% (12) 65% [po, 24hr まで] (1) 60% [po] (U) 65% (11) 75% [iv, 16hr まで] (Callaghan JT, et al: Scand J Gastroenterol 136:S9-S17, 1987 PMID: 2892261 [preceding]) 腎から90%排泄され、尿管分泌される (11) N-デスメチル体として7%、S-オキシド体として2.5%尿中に回収 (1)

【CL】500mL/min (11) 50L/hr (1) CL/F=30～40L/hr (Callaghan JT, et al: J Clin Pharmacol 27: 618-24, 1987 PMID: 2888796)

【t1/2】2.5～3.5hr (U) 1.22±0.13hr (1) 約1.5hr (11) 1.3～1.6hr (12) Ccr 10mL/min未満：5.3hr (1) 【透析患者のt1/2】20hr以上 (U) 3.5～11hr (11,12)

【蛋白結合率】35% (U) 28～35% (12) 24～45% (1) 30%は主にα1酸性糖蛋白に結合、他の30%は血球 (11) 30% (Aronoff GR, et al: Clin Pharmacol Ther 43: 688-95, 1988 PMID: 2897890)

【Vd】約50L/man (U) 1L/kg (11) 0.8～1.3L/kg (12) 1.3±0.1L/kg (Aronoff GR, et al: Clin Pharmacol Ther 43: 688-95, 1988 PMID: 2897890) 【分布】母乳、脳脊髄液にも分布 (すべてのH2拮抗薬) (U)

【MW】331.46

【透析性】比較的透析されやすいがVdがやや大きく、効率的には除去されないと思われる (5) 除去率10% (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない。腎不全患者で意識障害や痙攣、汎血球減少症が起りやすいものの血中濃度と副作用の関係は確立していない (PDR) これらの症状が発生した場合には客観的データとして血中濃度を測定する場合がある (5) 50%HCl 阻止血漿濃度 (ペントガストリン刺激酸分泌) 295ng/mL (U) 50%HCl 阻止血漿濃度 60ng/mL [基礎酸分泌]、75ng/mL [蛋白食刺激酸分泌] (1) 【O/W係数】0.3 (11) 0.20 [1-オクタノール/buffer, pH7] (1) 【pKa】2.1, 6.7 (1)

【相互作用】ゲフィチニブ、プルリフロキサシン、アタザナビルなど胃内pH上昇による吸収の低下に注意 (1) MATE2Kの選択的阻害剤であり、メトホルミンのVd上昇、半減期延長、血糖降下作用の増大に関連するが、メトホルミンの腎CLへの影響は認めない (Morrissey KM, et al: Clin Pharmacokinet 2015 PMID: 26507723)

【肝障害患者への投与】肝代謝されるため血中濃度が上昇するおそれがあり慎重投与 (1) 【妊婦・授乳婦への投与】妊婦には有益性投与、授乳を避ける (1) 【小児への投与】安全性未確立 (1)

【効果発現時間】30min 以内 (1)

【効果持続時間】通常 8hr 以内、夜間は 12hr 以内（U）

【更新日】20230515

※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。