

H₂受容体拮抗剤

日本薬局方 ニザチジンカプセル

ニザチジンカプセル75mg「サワイ」

ニザチジンカプセル150mg「サワイ」

NIZATIDINE

日本標準商品分類番号

872325

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

	75mg	150mg
承認番号	22500AMX01914000	22500AMX01915000
薬価収載	2014年6月	2014年6月
販売開始	2002年7月	2002年7月

【組成・性状】

・組成


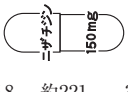
ニザチジンカプセル75mg「サワイ」：1カプセル中に日局ニザチジン75mgを含有する。

添加物として、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸Na、青色1号、黄色5号を含有する。

ニザチジンカプセル150mg「サワイ」：1カプセル中に日局ニザチジン150mgを含有する。

添加物として、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、カプセル本体に、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸Na、青色1号、黄色5号を含有する。

・製剤の性状

品名	剤形	外形 全長(mm)・重量(mg)・カプセル号数	性状
ニザチジンカプセル75mg「サワイ」	硬カプセル剤	 14.5 約170 4	頭部：淡青緑色不透明 胴部：白色不透明 内容物：白色～微黄白色の粉末又は塊を含む粉末
ニザチジンカプセル150mg「サワイ」	硬カプセル剤	 15.8 約221 3	頭部：淡青緑色不透明 胴部：白色不透明 内容物：白色～微黄色の粉末又は塊を含む粉末

【効能・効果】

	ニザチジンカプセル75mg「サワイ」	ニザチジンカプセル150mg「サワイ」
胃潰瘍、十二指腸潰瘍、逆流性食道炎	○	○
下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善 急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期	○	—

【用法・用量】

胃潰瘍、十二指腸潰瘍

通常、成人にはニザチジンとして1回150mgを1日2回(朝食後、就寝前)経口投与する。また1回300mgを1日1回(就寝前)経口投与することもできる。なお、年齢、症状により適宜増減する。

逆流性食道炎

通常、成人にはニザチジンとして1回150mgを1日2回(朝食後、就寝前)経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

下記疾患の胃粘膜病変(びらん、出血、発赤、浮腫)の改善

急性胃炎、慢性胃炎の急性増悪期

通常、成人にはニザチジンとして1回75mgを1日2回(朝食後、就寝前)経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

本剤は腎排泄が主であるため、腎機能障害患者に150mgを経口投与した場合、腎機能低下にともなう血漿中半減期の遅延と、血漿クリアランスの低下がみられた。(外国データ)

【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) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- 2) 肝障害のある患者〔本剤は主として肝臓で代謝されるので、血中濃度が上昇するおそれがある。〕
- 3) 腎障害のある患者〔血中濃度が持続するので、投与量を減ずるか投与間隔をあけて使用すること。〕(「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照)
- 4) 高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕

2. 重要な基本的注意

治療に当たっては経過を十分に観察し、病状に応じ治療上必要最小限の使用にとどめ、本剤で効果がみられない場合には他の治療に切りかえること。なお、血液像、肝機能、腎機能等に注意すること。

3. 相互作用

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
ゲフィチニブ	これらの薬剤の血中濃度が低下するおそれがある。	これらの薬剤の溶解性がpHに依存することから、胃内pHが持続的に上昇した条件下において、これらの薬剤の吸収が低下し、作用が減弱するおそれがある。
合成抗菌剤 ブルイプロキサシン		
硫酸アタザナビル		

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、アナフィラキシー様症状**：ショック、アナフィラキシー様症状(蕁麻疹、血圧低下、気管支痙攣、咽頭浮腫、呼吸困難等)があらわ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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (2) **再生不良性貧血、汎血球減少症、無顆粒球症、血小板減少**：再生不良性貧血、汎血球減少症、無顆粒球症、血小板減少があらわれることがあるので、初期症状として全身倦怠感、発熱、出血傾向等がみられたら、その時点で血液検査を実施し、異常が認められた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (3) **肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTP上昇等の肝機能障害、黄疸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、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

2) 重大な副作用(類薬)

他のH₂受容体拮抗剤で、間質性腎炎、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、中毒性表皮壊死症(Lyell症候群)、房室ブロック等の心ブロック、不全収縮、横紋筋融解症が報告されている。

3) その他の副作用

以下の副作用が認められた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、痒痒感
血液 ^{注)}	貧血、白血球減少、好酸球増多、血小板減少、顆粒球減少
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、肝機能異常、黄疸
消化器	便秘、下痢、口渇、嘔気、腹部膨満感
精神神経系	頭痛、めまい、しびれ、せん妄、失見当識
その他 ^{注)}	女性型乳房、発熱、顔面浮腫、乳汁分泌
外国において発現した副作用	可逆性錯乱状態、インポテンス

注)このような場合には投与を中止すること。
なお上記のほか、他のH₂受容体拮抗剤で痙攣があらわれたとの報告がある。

5. 高齢者への投与

- 血中濃度の持続**：高齢者では腎機能が低下していることが多いため血中濃度が持続するおそれがあるので、腎機能の程度に応じて(「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照)用量ならびに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。
- 血液系副作用**：高齢者に血小板減少、白血球減少、貧血等の血液系副作用の発現率が高い傾向が認められているので、用量ならびに投与間隔に留意し定期的に血液検査を行う等、患者の状態を観察し慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 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のみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、妊娠ウサギへの1500mg/kg投与群において、流産、胎児体重の低下及び生存胎児数の減少がみられている。〕
- 投薬中は授乳させないよう注意すること。〔動物実験(ラット)で乳汁中への移行及び新生児の発育障害がみられている。〕

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立されていない。

8. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)

9. その他の注意

本剤の投与で胃癌による症状を隠蔽することがあるので、悪性でないことを確認のうえ投与すること。

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

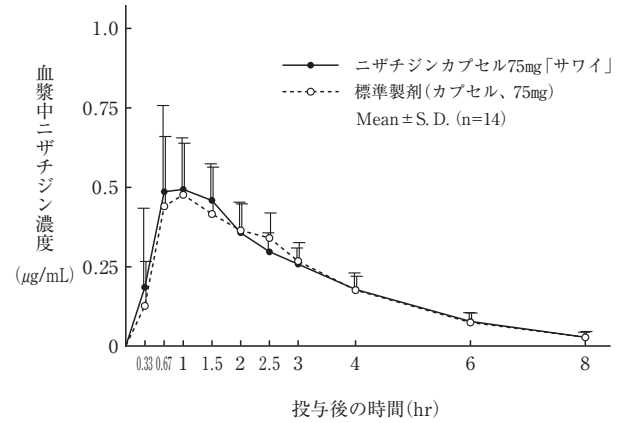
○ニザチジンカプセル75mg「サワイ」

ニザチジンカプセル75mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1カプセル(ニザチジンとして75mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ニザチジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

各製剤1カプセル投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)
ニザチジンカプセル75mg「サワイ」	0.63 \pm 0.18	1.1 \pm 0.4	1.6 \pm 0.2	1.63 \pm 0.24
標準製剤(カプセル、75mg)	0.57 \pm 0.15	1.0 \pm 0.4	1.6 \pm 0.2	1.59 \pm 0.22

(Mean \pm S.D.)



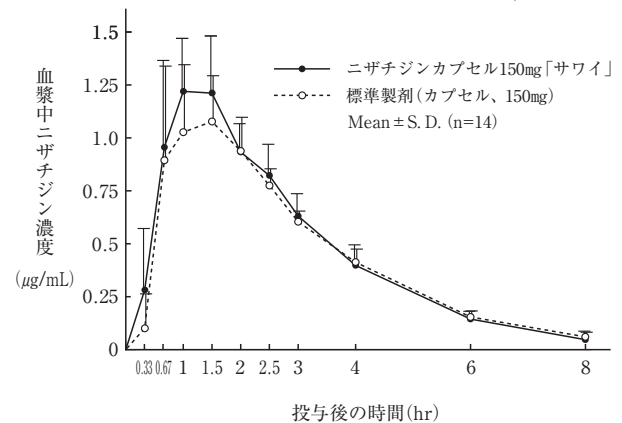
○ニザチジンカプセル150mg「サワイ」

ニザチジンカプセル150mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1カプセル(ニザチジンとして150mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ニザチジン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。²⁾

各製剤1カプセル投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)
ニザチジンカプセル150mg「サワイ」	1.40 \pm 0.29	1.2 \pm 0.5	1.4 \pm 0.2	3.81 \pm 0.46
標準製剤(カプセル、150mg)	1.24 \pm 0.25	1.1 \pm 0.4	1.5 \pm 0.1	3.60 \pm 0.43

(Mean \pm S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

- ニザチジンは、胃粘膜壁細胞のヒスタミンH₂受容体を選択的に遮断し、強力な胃酸分泌抑制作用を示す。
- 各種刺激による胃酸分泌及びペプシン分泌等を抑制する。
- 速やかに吸収され、1日1~2回投与で胃・十二指腸潰瘍、胃炎等に治療効果を示す。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ニザチジン(Nizatidine)

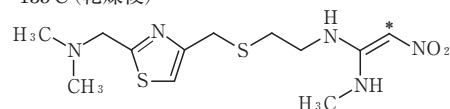
化学名：(1E*Z*)-*N*-[2-[(2-[(Dimethylamino)methyl]thiazol-4-yl)methyl]sulfanyl]ethyl]-*N'*-methyl-2-nitroethene-1,1-diamine

分子式：C₁₂H₂₁N₅O₂S₂

分子量：331.46

融点：130~135℃(乾燥後)

構造式：



及びC*位幾何異性体

性状：ニザチジンは白色～微黄白色の結晶性の粉末で、特異なにおいがある。メタノールにやや溶けやすく、水にやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくい。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

PTP包装及びバラ包装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。^{3)、4)}

**【包装】

ニザチジンカプセル75mg「サワイ」:

PTP: 100カプセル(10Cap×10)、700カプセル(14Cap×50)、
1,000カプセル(10Cap×100)

ニザチジンカプセル150mg「サワイ」:

PTP: 100カプセル(10Cap×10)、1,000カプセル(10Cap×100)

【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 [生物学的同等性試験]

3)、4) 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

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

K11 A171103

