

耐適恩錠 20公絲 Nexium® Tablets 20 mg (Esomeprazole) 耐適恩錠 40公絲 Nexium® Tablets 40 mg (Esomeprazole)

衛署藥輸字第023225號

衛署藥輸字第023221號

組成 各藥錠含有20 mg或40 mg的esomeprazole (以magnesium trisylate化合物形式存在)。

耐胃酸： 20 mg：為淡粉紅色、橢圓形、兩面凸出之膜衣錠。一面刻有「N」，另一面刻有20 mg之字樣。 40 mg：為淡紅色、橢圓形、兩面凸出之膜衣錠。一面刻有「N」，另一面刻有40 mg之字樣。

胃食道逆流性疾疾病 壓酸性逆流性食道炎之治療。 胃食道逆流性疾疾病之症狀治療。

特殊之抗菌劑併用，以根除幽門螺旋桿菌 (Helicobacter pylori)，及治療由幽門螺旋桿菌 (Helicobacter pylori) 引發之十二指腸潰瘍。

需要持續使用非類固醇消炎藥(NSAID)之病患 NSAID治療相關之胃潰瘍的治療

預防消化性潰瘍再出血之治療。 Zollinger Ellison Syndrome (ZES)之治療、劑量及給藥法

本藥品須醫師處方使用。 本藥錠應整粒以液體吞服，不可嚼破或壓碎本錠劑。

對於有吞嚥困難的病人，可將藥錠置入半杯非碳酸的水中，且不可使用他種液體。因為藥錠的膜衣層可能因此溶解，同時攪拌直到藥錠崩散，並立即或在30分鐘之內將水連同小藥球喝下。再將杯水加入杯中沖洗並喝下。小藥球不可咬碎或壓碎。

對於無法吞嚥的病人，本錠劑可用非碳酸飲料沖泡，並且經由胃管給藥。重要的處方小心測試適用之注射劑和置管的適宜性，製備與使用說明書參閱【使用、處理及棄置(適用說明書)】。

成人及12歲以上之青少年 胃食道逆流性食道炎(GERD)

壓酸性逆流性食道炎之治療：40 mg每天1次，為期4週。對食道炎尚未痊癒或有症狀之患者，建議於再服4週療程。

胃食道逆流性疾疾病之症狀治療：對食道炎發之患者20 mg每天1次；若4週後仍有症狀時，則應進一步檢查患者。一旦症狀獲得緩解後，可以每天1次20 mg之療法來做臨時的症狀控制，就成人而言，如需要時，可以給予20 mg每天1次之療法。

對於使用非類固醇消炎藥(NSAID)治療而有誘發胃潰瘍和十二指腸潰瘍危險之病患，不建議以有需要時才服藥的方式作為後續的症狀控制。

成人 與適當之抗菌劑併用，以根除幽門螺旋桿菌 (Helicobacter pylori)，以及治療由幽門螺旋桿菌 (Helicobacter pylori) 引發之十二指腸潰瘍：20 mg Nexium + 1 g amoxicillin + 500 mg clarithromycin；每天2次，共計7天。預防消化性潰瘍再出血之治療，40 mg每天1次，為期4週。

需要持續使用非類固醇消炎藥(NSAID)之病患 NSAID治療相關之胃潰瘍的治療：一脫劑量為20 mg每天1次，為期4-8週。

Zollinger Ellison Syndrome (ZES)之治療 建議起始劑量為服用Nexium 40mg每日2次，然後再依病情調整劑量。並視臨床表徵決定是否繼續治療。根據臨床試驗結果顯示，每日服用80至160mg esomeprazole，大部分病人之胃酸可獲得控制。如每日服用劑量達80mg以上，需分為每日2次給藥。

12歲以下之孩童 1至11歲孩童之用法用量請參閱「耐適恩膠丸劑的附屬」。 肝功不良

對腎功能不良之患者，並不須調整劑量。對腎臟功能嚴重不足之患者，因經驗有限，治療此類病人仍屬特別謹慎。(請參閱【藥動學性質】)。

肝功不良 對肝功輕度及中度不良之患者，並不須調整劑量。肝功能嚴重不良的病人，Nexium的最高使用劑量不應超過20 mg。(請參閱【藥動學性質】)。

老年病患 老年病患並不須調整劑量。

禁忌 已知對esomeprazole、benzimidazole取代物或配方中其他成份有過敏反應之患者。Esomeprazole不可與nelfinavir併用 (請參閱【與其他藥物之交互作用及其他形式之交互作用】)。

醫療及注意之事項 醫療及注意之事項 (如嚴重無故地顯著減輕、反覆嘔吐、吞嚥困難、吐血或黑糞)及懷疑(或已存在)胃潰瘍時，應先確認其非惡性腫瘤。因以Nexium治療會減輕其症狀，並延誤其診斷。

病患在長期治療時(特別是治療時間超過一年) 需要接受規格的監測。 視需要治療的病人若有特別的症狀改變時，應與醫師聯繫。在esomeprazole用於視需要治療中時，因為esomeprazole的血漿濃度波動而可能引起與其他藥物的交互作用，應加以考慮。(請參閱【與其他藥物之交互作用及其他形式之交互作用】)。

當esomeprazole用於根除幽門螺旋桿菌 (Helicobacter pylori)時，應考慮與二合療法中所有組成成份的藥物相互作用。Clarithromycin是CYP3A4的強效抑制劑，因此二合療法使用於正在服用其他由CYP3A4代謝的藥物(例如cisapride)的病人時，應考慮clarithromycin的禁忌症及藥物相互作用。

本藥品含有蔗糖。患有果糖不耐症、葡萄糖-半乳糖吸收不良症或蔗糖與麥芽糖酶不足等等的稀有遺傳性疾病的病人，不可使用此藥物。

使用质子幫浦抑制劑治療可能使發生腸胃道感染的風險增加。例如沙門桿菌 (Salmonella) 及桿曲菌 (Campylobacter)。(請參閱【藥效學性質】)。

不建議同時投予 esomeprazole 和 atazanavir (參閱【與其他藥物之交互作用及其他形式之交互作用】部份)。如同時投予 atazanavir 和質子幫浦抑制劑的合併使用是不可避免的，則建議給予密切的臨床監視，並將連同ritonavir 100 mg併用的 atazanavir劑量增加至400 mg，而esomeprazole 的劑量不超過20 mg。

在健康受試者中進行的研究結果表明，clopidogrel (起始劑量300 mg/維持劑量每天75 mg)和esomeprazole (每天40 mg口服)之間的藥效學-藥效學交互作用導致clopidogrel 活性代謝產物的暴露量平均減少40%。也導致對(ADP誘導之)血小板凝集的最大抑制作用平均減少14%。根據這些數據，應避免同時使用esomeprazole和clopidogrel (請參見【與其他藥物之交互作用及其他形式之交互作用】)。

干預實驗室檢驗 CgA濃度升高可能會干擾神經內分泌腫瘤的調查。為了避免這種干擾，應在測量CgA前至少五天暫時停止esomeprazole治療。

由觀察研究發現，PPI類藥品高劑量長期使用時，可能會增加喉嚨、喉嚨或手部等部位骨折之風險，惟因果關係尚未確立。當處方該類藥物時，應考慮病人情況，使用較低有效劑量或較短治療時程。

PPI類藥品使用於具有骨質疏鬆風險之患者時，宜監控病患骨質狀況，並適當補充 Vitamin D與Calcium。

低血鈣 曾有通報案件顯示，當長期使用PPI類成藥藥品(至少使用3個月；大部分在使用1年以上)，可能出現罕見低血鈣之不良反應。可能包括肌肉痙攣或之不良反應症狀，包括手足抽搦、心律不整、癱瘓發作等。大部分出現低血鈣之病人需要補充鈣離子予以治療，並停止使用PPI類成藥藥品。

對於用戶體成分之病人，如長期使用、併用digoxin或其他可能造成低血鈣之藥品(如利尿劑)時，醫藥人員宜於用藥前及用藥後定期測病人血中鈣濃度。

esomeprazole和其質子幫浦抑制劑治療時，因抑制胃酸分泌，可能會使受胃酸pH值影響的藥物的吸收減少或增加。相同的，在esomeprazole治療時，併用其他會減少胃酸內酸之藥物，會使如metoclozamide, itraconazole 及ertotinib類的藥物吸收降低。而digoxin的吸收會增加。健康受試者併用omeprazole (每天20 mg) 和digoxin治療，會使digoxin的生體可用量增加10%(包含在內之增加30%)。Digoxin 中藥的報導很少。然而，對老年患者使用高劑量esomeprazole時應謹慎。還要加強digoxin的藥物血中濃度監測。

曾有報告指出，omeprazole與一些白蛋白抑制劑之交互作用。但由於這些交互作用的臨床重要性及其後效的機制，在esomeprazole治療期間提高胃酸pH值可能會改變蛋白質抑制劑的活性。其他可能的交互作用機制是透過CYP 2C19。在atazanavir和nelfinavir的臨床試驗中，曾有與esomeprazole併服時血清濃度降低的報告，所以不建議同時給藥。

健康自願受試者併用omeprazole (40 mg每天一次) 與 atazanavir 300 mg/ritonavir 100 mg，會使atazanavir 的暴露量大幅減少(AUC、C_{max} 及C_{min} 均減少75%)。即使將atazanavir 的劑量增加至400 mg仍無法補償esomeprazole對atazanavir的暴露量所造成的影響。

相較於服用atazanavir 300 mg/ritonavir 100 mg每天一次而未併服esomeprazole 20 mg 每天一次，健康自願受試者併用omeprazole (20 mg 每天一次) 與 atazanavir 400 mg/ritonavir 100 mg，會使atazanavir 的暴露量減少約30%。與esomeprazole (40 mg 每天一次) 併服，則使nelfinavir 的平均AUC、C_{max} 及C_{min} 減少36-39%，並使具有藥理活性的代謝物M8的平均AUC、C_{max} 及C_{min} 減少75-92%。就saquinavir (與ritonavir併用) 而言，曾經在併用omeprazole (40 mg 每天一次) 期間，saquinavir的血清濃度升高(80-100%)的報告。Omeprazole 20 mg 每天一次治療對atazanavir (與ritonavir併用) 和amprenavir (與ritonavir併用) 的暴露量沒有影響。Esomeprazole 20 mg 每天一次治療對amprenavir (與ritonavir併用) 的暴露量沒有影響。Omeprazole 40 mg 每天一次治療對lopinavir (與ritonavir併用) 的暴露量沒有影響。由於esomeprazole與esomeprazole的藥效學與藥動學性質類似，故不建議同時投予esomeprazole和atazanavir，禁止同時併用esomeprazole和nelfinavir。

由CYP2C19代謝的藥物 Esomeprazole會抑制CYP2C19的活性。因此esomeprazole與其他由CYP2C19代謝的藥物合用時(例如diazepam, citalopram, imipramine, clomipramine, phenytoin等)這些藥物的血清濃度可能上升。

在健康自願受試者中，當esomeprazole與esomeprazole併用時，特別需要考慮此藥物相互作用。併用esomeprazole 30 mg，會使CYP2C19代謝diazepam之清除率降低45%。

當esomeprazole 40 mg，會使健康自願受試者中phenytoin之最低濃度升高13%。因此建議當esomeprazole服用及併用時，應監測血中phenytoin之濃度。Omeprazole (40 mg 每天一次) 會使voriconazole (CYP2C19的受質) 的C_{max} 和AUC分別增加15%及41%。

臨床試驗的結果顯示，以warfarin治療之病人若併用40 mg esomeprazole後，其凝血時間可能比之前短內，然而上市後，有些獨立個案指出同時併用時會造成INR臨床上升顯著地增加。故建議於併用esomeprazole和warfarin或其他coumarine衍生物治療初期及結束時應予以監測。

Omeprazole(Esomeprazole)是CYP2C19抑制劑。在一項交叉研究中，健康受試者使用omeprazole 40 mg造成clostazolol的C_{max}和AUC分別增加18%和26%，其中一個活性代謝物的C_{max}和AUC分別增加32%和36%。

在健康自願受試者中，同時使用40 mg的esomeprazole造成cisapride的血漿濃度時間曲線下面積(AUC)有32%增加，藥峰半衰期(t_{1/2}) 延長1%。在對其藥效學濃度沒有顯著增加。在cisapride單獨使用後造成的QTc間期程度延長，不因與esomeprazole同時使用而更加延長。(請參閱【使用上需特別注意及注意事項】)。

曾有併用esomeprazole和tacrolimus會增加tacrolimus之血清濃度的報告。研究顯示esomeprazole對amoxicillin或quinidone之藥動學，在臨床上升無顯著之影響。

短期研究顯示，同時併用esomeprazole與naproxen或rofecoxib，在臨床上升無顯著之藥物交互作用。

在健康受試者中進行的研究結果表明，clopidogrel (起始劑量300 mg/維持劑量每天75 mg)和esomeprazole (每天40 mg口服)的活性代謝產物-藥效學交互作用導致clopidogrel 活性代謝產物的暴露量平均減少40%，也導致對(ADP誘導之)血小板凝集的最大抑制作用平均減少14%。

然而，不能確認交互作用到什麼程度才有臨床重要性。一個前瞻性隨機(但不完全)研究(在超過3760名使用clopidogrel和ASA治療的患者中比較受質與esomeprazole 20mg)和大型前瞻性隨機臨床試驗研究(超過47,000名患者)所進行的藥物相互作用分析，沒有發現任何證據顯示給予clopidogrel和PPIs (包括esomeprazole)時，心血管不良的風險會增加。

關於同時投予clopidogrel和PPI時，心血管不良事件的風險有沒有增加，一些觀察性研究得到的結果不一致。

在一項對健康受試者進行的研究中，在同時投予clopidogrel和固定劑量藥物(esomeprazole 20 mg + ASA 81 mg)時，與單獨使用clopidogrel相比，clopidogrel的活性代謝產物的暴露量減少約40%。然而，在clopidogrel和clopidogrel+替拉法韋(esomeprazole + ASA)組的受試者，對(ADP誘導之)血小板凝集的最大抑制作用相同，可能是由於同時投予低劑量ASA所致。

未確定的疑慮 與質子幫浦抑制劑併用時，有報告指出有些病人的methotrexate及/或其代謝物濃度升高。在投予高劑量methotrexate時，可能需考慮暫時停用esomeprazole。

其他藥物對esomeprazole藥動學之影響 Esomeprazole由CYP2C19及CYP3A4所代謝。Esomeprazole與CYP3A4抑制劑併用時(如clarithromycin 500 mg b.i.d.)，會使esomeprazole之血中濃度(AUC)增加1倍；Esomeprazole與同時是CYP2C19抑制劑又是CYP3A4抑制劑的藥品併服時，如voriconazole，可能會使esomeprazole之暴露量增加一倍以上。CYP2C19及CYP3A4抑制劑voriconazole會使esomeprazole AUC增加280%。在以上二種情況下通常無須調整esomeprazole之劑量。然而，對於肝功能嚴重不良的患者以及有長期治療需求時，應考慮調整劑量。



會誘導 CYP2C19或CYP3A4或兩者 (如flupicin和聖約翰草) 的藥物, 可能會使esomeprazole的代謝率增加, 導致esomeprazole的血清濃度下降。

懷孕及授乳
Nexium用於孕婦之臨床資料尚不足。然由流行病學研究指出, 其消旋混合物esomeprazole用於大量孕婦之資料顯示並無顯微胎兒毒性。Esomeprazole在動物實驗中, 其對胎兒胎兒發育方面, 並未顯示其有直接或間接之不良影響。在動物實驗中, 使用消旋混合物, 對懷孕、生產及產後之發展, 並無直接或間接之不良影響。因此, 此藥之效力給予孕婦, 應是合理的。

目前並不知道esomeprazole是否會由人乳乳汁中排出; 亦未對哺乳中婦女進行研究。因此, 在哺乳期間不應使用Nexium。

對心臟或操作機器能力之影響
尚未發現有任何不良影響。

不良反應
在esomeprazole臨床試驗中, 以及上市後, 下列藥物不良反應已被確認或認為有相關性, 但其中任何一項均與劑量無相關性。

這些不良反應依發生之頻率分列如下:
極罕見 <1/100; 罕見 <1/100 且 <1/10; 少見 <1/1000 且 <1/100; 罕見 <1/10000 且 <1/10000; 罕見 <1/10000; 未知 (不能從現有的數據估計)。

血液及泌尿系統障礙
罕見: 白血球減少, 血小板減少。

極罕見: 顆粒性白血球缺乏症、全血球減少。

免疫系統障礙
罕見: 過敏反應, 如發燒、血管性水腫及過敏性反應(aphylactic reaction/ shock)

代謝及營養方面障礙
少見: 過渴水腫

罕見: 低血鈉症

極罕見: 低血鈉症。嚴重的低血鈉症可能引起低血鈉症。低血鈉症也可能會引起低血鈉症

精神醫學方面障礙
少見: 不眠症

罕見: 不安、神經錯亂、沮喪

極罕見: 躁狂症、幻覺

神經系統障礙
常見: 頭痛

少見: 暈眩、感覺異常、困倦

罕見: 眩暈、頭暈

視力障礙
罕見: 視力模糊

聽力及內耳迷路障礙
少見: 眩暈

呼吸系統、胸腔及縱膈障礙
罕見: 支氣管哮喘

胃腸道障礙
常見: 腹瀉、便秘、腹瀉、腹瀉、噁心/嘔吐

少見: 口乾

罕見: 口腔炎、腸胃道念珠菌感染

極罕見: 經腸鏡診斷之大腸炎

肝臟障礙
少見: 肝酶增加

罕見: 伴隨黃疸或無黃疸的肝炎

極罕見: 肝衰竭、之前有肝臟疾病病人的肝衰竭

皮膚及皮下組織障礙
少見: 皮膚炎、瘙癢、紅疹、蕁麻疹

罕見: 光敏性

極罕見: 多形性紅斑、Stevens-Johnson症候群、毒表皮剝脫症 (TEN)

肌肉骨節、結締組織及骨質障礙
罕見: 關節痛、肌痛

極罕見: 肌肉無力

腎臟及泌尿道障礙
罕見: 腎質性腎炎

生活系統及乳房障礙
極罕見: 男性乳房症

一般障礙及投訴部位狀況
罕見: 倦怠、流汗增加

上市後經驗: 代謝和營養方面異常 - 低血鈉

藥物過量
至目前為止, 尚無故意服本藥過量之經驗。

在服用280 mg esomeprazole後相關之症狀為腸胃道方面之症狀及虛弱感。一次服用80 mg esomeprazole後, 並無任何狀況。

目前並無特定之拮抗劑。Esomeprazole與血漿蛋白廣泛地結合, 因此不容易用血液透析來排除。如果發生服藥過量時, 應採取症狀療法及一般之支持療法。

藥理性質
藥效學性質

藥效學分類: 質子幫浦抑制劑

ATC Code: A02B C05

Esomeprazole為omeprazole之S型光學異構物。經由作用於專一性目標之作用機轉, 降低胃酸分泌, 其為位於胃壁細胞內之氫離子之專一性抑制劑。Omeprazole的R及S型光學異構物二者有相似的藥物效力活性。

作用部位及機轉
Esomeprazole為一弱酸, 其在胃之壁細胞內之細胞內小管, 高度酸性環境下, 並轉化成活性型, 其可抑制氫離子: H⁺-K⁺-ATP酶。其對基礎之胃酸分泌及刺激下之胃酸分泌, 均有抑制效果。

對胃酸分泌之影響
Esomeprazole 20 mg或40 mg口服後, 可在1小時之內即開始發揮其藥效。

Esomeprazole 20 mg每天1次, 連續5天。在第5天服藥6-7小時後, 對以pentagastrin刺激所產生之胃酸分泌可減少至80%。

以esomeprazole 20 mg或40 mg口服每天1次, 5天後其胃內酸度維持在4以上之平均時間, 分別為13及17小時; 對症狀性GERD病人而言, 則分別為24小時以上。服用esomeprazole 20 mg者, 其胃內酸度維持在4以上之時間在8小時、12小時及16小時之比例, 分別為76%、54%及24%。服用esomeprazole 40 mg者, 則相對之比例分別為87%、92%及56%。

以血漿esomeprazole濃度與時間, 所形成之曲線下面積(AUC), 來代替血漿濃度, 已顯示其對胃酸分泌之抑制程度, 與劑量之間有相關性。

抑制胃酸之藥效
逆性胃酸過多患者以esomeprazole 40 mg治療4週後, 有78%之病人痊癒, 治療8週後則有93%。

幽門螺旋桿菌患者以esomeprazole 20 mg每天2次, 與適當之抗生素併用治療1週後, 可解除90%患者之幽門螺旋桿菌。就無併發症之十二指腸潰瘍患者而言, 在為期1週之併發治療之, 並無須以抗胃酸分泌藥物再治療, 即可有效使潰瘍癒合及症狀緩解。

在一項隨機、雙盲、安慰劑對照臨床試驗中, 經由內視鏡檢查確認為消化性潰瘍出血, 特徵為Forrest Ia, Ib, IIa或IIb (分別是9%、43%、38%及10%) 的患者隨機接受Nexium靜脈輸注2小時(0-375)或安慰劑(0-389)治療, 以內視鏡止血後, 患者接受esomeprazole 80 mg 靜脈輸注30分鐘, 隨後esomeprazole 8 mg/h 或安慰劑持續靜脈輸注2小時。在此期間2小時之後, 所有的患者均接受或靜脈輸注口服Nexium 40 mg, 服用27天以抑制胃酸分泌。三天內發生再出血的比例Nexium治療組是5.9%, 安慰劑組是10.3%。在治療後30天發生再出血的比例Nexium治療組是7.7%, 安慰劑組是13.6%。

與抑制胃酸有關之其他效應
以抗胃酸分泌藥物治療期間, 因胃酸分泌減少, 血中胃泌素濃度會升高。由於胃內酸度下降, 腸胃蛋白(CgA)也會增加。CgA濃度升高可能會干擾體內分泌腺體的檢查。文獻報告指出, 應在測量CgA的5至14天前暫時停止質子幫浦抑制劑治療。在這段期間如果CgA濃度未恢復正常, 應重複進行測量。CgA濃度的增加可能與血中泌素增加有關。此現象曾發生於長期使用esomeprazole治療的兒童及成人身上。這樣的發現被認為不具臨床意義。

以抗胃酸分泌藥物長期治療後, 據報告顯示胃酸濃度之發生率有一點增加。此係胃酸顯著抑制後之生理變化, 其為良性且被認為具可逆性。

使用任何一種方法(包括質子幫浦抑制劑)來減少胃內酸度, 會使平常存在於胃腸道的細菌數量增多。使用質子幫浦抑制劑治療可能發生菌叢過度繁殖的風險增加。增加沙門桿菌(Salmonella)及革蘭氏菌(Campylobacter), 在住院病人, 可能還有困難梭狀芽孢桿菌(Clostridium difficile)。在二個以ranitidine為比較對象之研究, 於治療有使用NSAID(包括具有COX-2選擇性之NSAID)之胃潰瘍病患, Nexium有較佳的綜合效果。

在兩個以安慰劑為比較對象之研究, 對於使用NSAID(包括具有COX-2選擇性之NSAID)之病患(年齡超過60歲或以前曾有潰瘍), Nexium有較佳的預防胃及十二指腸潰瘍的效果。

小兒患者
在一個以胃食道逆流性疾病的兒童患者(<17歲)長期使用質子幫浦抑制劑治療的研究中, 觀察到6%的兒童有輕微程度未知臨床意義的ECL細胞增生, 未發展為惡性胃炎或癌瘤。

藥效學性質
吸收及分布

Esomeprazole對酸不穩定, 以腸胃腸胃之劑型口服。在活體內轉化成P型光學異構物之量非常少。Esomeprazole之後效迅速, 治療後1-2小時即到達中最高濃度。在40 mg的esomeprazole單一劑量後的絕對生物利用度為64%, 並在重複一天一次的給藥後增加至89%。若20 mg的劑量則分別為50%及68%。健康受試者穩定期中的分布體積大約為0.22 L/kg體重, esomeprazole的血漿蛋白結合率為97%。

食物的攝取會延緩並降低esomeprazole的吸收, 雖然其對esomeprazole對胃內酸度的作用並無顯著的影響。

代謝及排泄
Esomeprazole完全由細胞色素P450系統(CYP)代謝。Esomeprazole大部分依賴多形性之CYP2C19代謝, 其負責形成esomeprazole之S型異構物及以甲基代謝物。其他部分則依賴另一特定之異構物CYP3A4, 負責形成esomeprazole之R型異構物。此為在血中主要之代謝物。

下列係由擁有正常功能之CYP2C19(廣泛代謝者)之個體, 所反映出藥動學參數。

全體血漿清除率在單劑量後為17 L/h。在重複給藥後為9 L/h, 在每天1次重複給藥後, 其清除率約為1/3小時。已有服用esomeprazole達到每次40mg每天2次之藥動學研究報告。血漿濃度-時間曲線下面積(AUC)隨著esomeprazole重複給藥而增加; 此種增加係劑量依賴性, 且導致在重複給藥後, 其AUC增加之程度對劑量增加, 呈現非線性之關係。此種劑量與劑量依賴性, 係因為首度代謝及全身清除率降低所致; 此可能因為esomeprazole及其磺胺代謝物抑制了CYP2C19酵素所致。在每天給藥1次下, esomeprazole在兩次給藥之間, 已完全由血漿中清除, 因此在體內無累積之傾向。

Esomeprazole之主代謝物對胃酸分泌並無影響。口服劑量中之esomeprazole, 有80%以其代謝物由尿中排除, 其餘則由糞便中排除, 只有低於1%之原藥可在尿液中被發現。

種族及種族
歐美白種人口口約有3%而在我國人口口可能有15%缺乏正常功能之CYP2C19酵素, 稱其為低度代謝者。此類患者代謝esomeprazole時, 主要以CYP3A4來催化。在低度代謝者以esomeprazole 40mg每天1次, 連續給藥後, 其血漿濃度-時間曲線下面積之平均值, 比具正常功能之CYP2C19(廣泛代謝者)者, 高1倍左右。最高血中濃度之平均值, 亦增加60%左右。

這些結果與esomeprazole的藥學學無關。Esomeprazole之代謝率在老年人中(71-80歲)並無顯著的變化。

在單一劑量40 mg的esomeprazole使用後, 女性的血漿濃度時間曲線下面積大約為男性的30%。重複的一天一次使用後則無性別差異存在。這些結果與esomeprazole的藥學學無關。

器官功能不良
在輕微到中度肝功能不良的病人中, esomeprazole的代謝可能不佳。

嚴重肝功能不良的病人(esomeprazole代謝率降低), 導致血漿濃度時間曲線下面積增加。因此此類病人的esomeprazole最高劑量不可超過20 mg。在一天一次的劑量下, esomeprazole及其主要代謝物沒有累積的情形發生。

本藥亦曾在肝功能不良之患者進行研究。因為腎臟負責esomeprazole之排泄, 但不負責esomeprazole之清除, 所以在腎功能不良之患者身上, 一般認為esomeprazole之代謝, 並不會有顯著的變化。

在成人上:

12至18歲之青少年

重複給予20mg或40mg之esomeprazole, 12至18歲之青少年其血漿濃度-時間曲線下面積(AUC)和藥物達最高血漿濃度所需時間(t_{max})在於相同劑量下與成人相似。

藥物相互作用
單體脂質甘油酯 40-55、羟甲基纖維素(hydrolyse)、羟甲基纖維素、氯化鎂(20mg & 40mg錠劑); 紅棕色、20mg錠劑; 黃色) [E] 72、硬脂酸鎂、甲氧基內酯異分子化合物(1)、微晶纖維素、合成氫化、聚乙稀之二醇、聚山梨醇酯80、聚乙稀基吡啶酮交連結構、聚山梨醇酯、糖質質素(蔗糖與玉米澱粉)、滑石粉、二氧化碳[171]、三乙基檸檬酸。

配伍禁忌
目前無已知之配伍禁忌。

假藥與仿製
請參閱外盒說明。

貯存時注意事項
貯存於低於30°C處

存放於原包裝之內以避免潮濕。

包裝
請參閱外盒說明。

使用、處理及棄置(適用時)說明
經胃管給藥

1. 把本錠劑放在適當的注射器中, 注入大約25 mL及空氣約5 mL。有些胃管需要50 mL水沖洗, 以免小藥粒堵塞胃管。

2. 立即根據注射器之刻度, 以螺旋旋鈕旋。

3. 將注射器的尖端朝上, 以檢查尖端未被堵塞。

4. 保持上述位置, 把注射器插入胃管。

5. 旋轉注射器, 並將其尖端朝下, 立即注入5-10 mL至胃管, 重複這個程序, 直到注射器內液體完全完畢。

6. 若有需要, 可在注射器內再注入大約25 mL及空氣約5 mL, 重複步驟以沖洗留在注射器內的沈澱物。有些胃管可能需要50 mL的水。

修改日期
2013年9月

本註册商標AstraZeneca集團之財產。

© AstraZeneca 2009 - 2013

製造廠: AstraZeneca AB

製造廠地址: SE-151 85 Sodertalje, Sweden

藥商: 臺灣阿斯特捷利康股份有限公司

地址: 台北市敦化南路二段207號21樓

電話: (02) 23782390