



# 十全藥品

衛署藥製字第 057782 號  
G-11818 號  
本藥須由醫師處方使用

## “十全”潰之癒腸溶膜衣錠 20 毫克

E-ulcer Enteric E.C. Tablets 20mg "S.C."

### 【成分】

Each tablet contains: Sodium Rabeprazole 20mg

### 【適應症】

胃潰瘍、十二指腸潰瘍、合併抗生素治療與幽門螺旋桿菌 (*Helicobacter pylori*) 相關的消化性潰瘍、胃食道逆流疾病之治療。

### 【用法、用量】

依文獻記載  
本藥須由醫師處方使用。

#### ●成人 / 老年人：

活動期的十二指腸潰瘍及活動期的良性胃潰瘍：建議劑量為 10mg 或 20mg，每日早上服用一次。

大部分病人其活動期的十二指腸潰瘍在四星期內癒合；但是少數患者可能需要再增加四星期治療時間以達到癒合效果。大部份病人其活動期的良性胃潰瘍會在六星期內癒合；但是少數患者可能需要再增加六星期治療時間以達到癒合效果。

有腐蝕症狀或潰瘍性的胃食道逆流疾病 (GERD)：建議劑量為 10mg 或 20mg，每日一次持續四至八週。

胃食道逆流疾病之長期治療 (GERD Maintenance)：長期治療之維持劑量可依病人反應使用本品 20mg 或 10mg，每日一次。

中至重度胃食道逆流疾病之症狀治療 (symptomatic GERD)：未患有食道炎的病人 10mg，每日一次。若症狀控制於四星期內未達效果，病人需更進一步診療。

消化性潰瘍患者之幽門螺旋桿菌 (*Helicobacter pylori*) 根除：病人可採用根除療法。建議給與下列合併藥物七日：

本品 20mg 併用 Clarithromycin 500mg 與 Amoxicillin 1g，每日二次。一日服用一次時，本品應在每日早上服前服用。儘管一日中的給藥時間以及食物之攝取均不會對本品的活性產生任何影響，但此種療法可提高患者對治療的服從性。

須提醒患者本品不宜嚼碎或壓碎，應整顆吞服。

#### ●肝腎功能障礙患者：

對於有肝或腎功能障礙的患者，不需要特別調整劑量。

(對於有嚴重肝功能障礙患者的治療，參考 “使用時注意事項”。)

#### ●兒童：因尚未有此年齡群的安全使用經驗，故不建議兒童使用。

### 【禁忌】

已知對 sodium rabeprazole 過敏，對取代基 benzimidazoles 或是對本處方中任何賦形劑過敏者及懷孕與授乳期時。

### 【警告】

低血鎂：

1. 曾有通報案件顯示，當長期使用 PPI 類成分藥品（至少使用 3 個月，大部分在使用 1 年以上），可能出現罕見低血鎂之不良反應，可能無症狀或嚴重之不良反應症狀，包括手足抽搐、心律不整、癲癇發作等。大部分出現低血鎂之病人需要補充鎂離子予以治療，並停止使用 PPI 類成分藥品。

2. 對於使用 PPI 類成分藥品之病人，如將長期使用、併用 digoxin 或其他可能造成低血鎂之藥品（如利尿劑）時，醫療人員宜於用藥前及用藥後定期監測病人血中鎂濃度。

### 【上市後經驗】

代謝和營養方面異常—低血鎂。

### 【使用時注意事項】

依文獻記載  
(一) 由觀察研究發現，PPI 類藥品高劑量或長時間使用時，可能會增加臀部、脊椎或手腕等部位骨折之風險，惟因果關係尚未確立。

(二) 當處方該類藥品時，應考量病人情況，使用較低有效劑量或較短治療時程。

(三) 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。

如用 sodium rabeprazole 作症狀治療，會妨礙診斷出胃或食道惡性腫瘤的存在；因此在開始使用本品之前應先確認無罹患惡性腫瘤的可能性。長期使用（特別是使用超過一年）的患者應接受定期的檢查。

須提醒患者本品不宜嚼碎或壓碎，應整顆吞服。

因尚未有在兒童的安全使用經驗，故不建議兒童使用。

在伴有輕到中度肝功能障礙患者與正常年齡與性別相符的控制組研究中，沒有證據顯示有意義的藥物相關安全問題。但因為沒有重度肝功能障礙患者使用本品的臨床資料，故建議醫師在初次處方本品於此類患者時務必謹慎。

### 【藥物交互作用】

依文獻記載  
Sodium rabeprazole 如同其他質子幫浦抑制劑類的化合物，經由 cytochrome P450 (CYP450) 肝臟藥物代謝系統被代謝。在健康對象的研究顯示，sodium rabeprazole 與其他在 CYP450 系統被代謝的藥物，包括 warfarin、phenytoin、theophylline 或 diazepam 並沒有具臨床意義的交互作用。Sodium rabeprazole 能產生顯著持久的胃酸分泌抑制作用。本品與其他化合物的交互作用可能取決於 pH 值，故此類交互作用程度已被研究中。正常實驗對象中，併用 sodium rabeprazole 會降低 ketoconazole 血中濃度 33% 及增加 digoxin 波谷值 (trough level) 血中濃度 22%。因此當以上二種藥物與本品併用時，個別患者可能需要做監測以決定是否有調整劑量的必要。為了根除上部胃腸道幽門螺旋桿菌而併用時，rabeprazole 不會對 amoxicillin 或 clarithromycin 的血中濃度有負面的影響。

在一個被設計來定義制酸劑與本品合併使用交互作用的臨床試驗，證實與液體劑型的制酸劑沒有交互作用。本品與食物沒有臨床相關的交互作用。在人類肝臟微粒體的胞外研究中指出，sodium rabeprazole 是被 CYP450(CYP2C19 與 CYP3A4) 異構素代謝。在這些研究中，在已被預期的人體血漿濃度情況下 rabeprazole 不會誘導或抑制 CYP3A4；而儘管在胞外研究中也許不能完全預測在胞內的情形，但研究結果顯示在 rabeprazole 與 cyclosporin 之間並無交互作用。

### 【用於懷孕及授乳期】

#### ●懷孕：

並沒有在人類懷孕期使用 rabeprazole 的安全性資料。在老鼠及兔子的生殖研究中，顯示沒有因 sodium rabeprazole 導致繁殖功能受損或胎兒損傷的證據，然而在老鼠研究中曾發生少量本品經胎盤傳遞至胎兒的情形，故本品禁用在懷孕期婦女。

#### ●授乳：

目前尚未知 sodium rabeprazole 是否會在人體乳汁中分泌，並沒有以授乳期婦女為對象進行的研究報告。但 sodium rabeprazole 會在老鼠乳腺中被分泌出來，因此本品不建議在授乳期中使用。

### 【對駕駛及使用機械能力的影響】

根據藥效學的性質和副作用資料，本品不會影響駕駛及使用機械等能力。但若因嗜睡而造成注意力不集中，則建議避免駕駛和操作複雜機械。

### 【不良反應】

#### 水腫 (edema)

本品在臨床試驗中具有廣泛良好的耐受性。在正常情況下被觀察到的不良反應大部份是輕 / 中度及短暫的。臨床試驗中最常見的副作用（發生率 ≥ 5%）是：頭痛、腹瀉及噁心。其他副作用（發生率 < 5% 且 ≥ 2%）為：鼻炎、腹部疼痛、無力、脹氣、咽炎、嘔吐、無特異性疼痛 / 背痛、暈眩、類感冒症狀、感染、咳嗽、便秘及失眠。極少發生的副作用（發生率 ≤ 1%）為：發疹、肌痛、胸痛、口乾、消化不良、神經過敏、嗜睡、支氣管炎、鼻竇炎、惡寒、噯氣、腿部痙攣、泌尿道感染、關節痛及發燒。

在少數個案中，觀察到厭食、胃炎、體重增加、憂鬱、搔癢、視覺或味覺障礙、口炎、多汗和白血球增多症等。

但是只有頭痛、腹瀉、腹部疼痛、無力、脹氣、發疹和口乾是與服用本品有關聯。

### 上市後報告：

有報告指出，使用本品治療的患者有紅斑及極少發生的起泡反應，通常在停藥後症狀即消失。

極少數的報告有血小板減少症，嗜中性白血球減少症及白血球減少等。

有報告指出本品會增加肝臟酵素。

### 【用藥過量】依文獻記載

目前沒有蓄意使用本品過量的研究資料。本品耐受劑量可達 80mg/day。尚未發現有專一性解毒劑。本品是高度蛋白結合藥物，因此不易透析出。若有過量的情形，治療上應使用根據症狀以及全面性的支持療法。

### 【藥效學性質】依文獻記載

ATC code : A02B C04

#### ●作用機轉：

sodium rabeprazole 屬於 benzimidazoles 上有取代基的抗胃酸分泌化合物類，沒有抗膽鹼或抗 H<sub>2</sub>組織胺的作用，但因專一性的抑制 H<sup>+</sup>/K<sup>+</sup>-ATPase 酶素（酸或質子幫浦）而有抑制胃酸分泌的作用。這種作用是與劑量相關，導致不管是否有刺激物的情形下，基底部份與被刺激的酸分泌作用仍被抑制。動物實驗指出在給與本品後，sodium rabeprazole 會在血漿及胃黏膜快速消失。弱鹼的 rabeprazole 在所有劑量下都能快速的被吸收且在酸性環境下的腔壁細胞中有高濃度。Rabeprazole 經由 protonation 轉化成活性的 sulpenamide 且隨後與在質子幫浦中已有的 cysteine 起反應。

#### ●抗胃酸分泌活性：

口服 20mg sodium rabeprazole 之後其抗分泌作用在 1 小時內產生，最大效果在服用後 2 ~ 4 小時產生。在服用 sodium rabeprazole 第一個劑量 23 小時以後，抑制基底及因食物刺激的胃酸分泌程度分別為 69% 及 82% 且持續時間可至 48 小時。Sodium rabeprazole 對酸分泌的抑制作用在重複的每日一次給藥劑量之後會輕微的上升，在 3 天以後會達到穩定狀態。停藥後，分泌作用會在 2 ~ 3 天後趨於正常。

#### ●血清胃素作用：

臨床研究中患者每日一次給與 10 或 20mg sodium rabeprazole，持續時間達 43 個月。因胃酸分泌被抑制造成的反射作用使血中胃泌素濃度在最初 2 ~ 8 星期中增加，但當治療持續後即趨於穩定。當停藥 1 ~ 2 星期後胃泌素值即回到治療前的濃度。從超過 500 名正在使用 rabeprazole 或競爭品藥物大於八週的患者胃腔中取出的胃切片樣本顯示，沒有偵測到在 ECL 細胞組織學、胃炎程度、萎縮性胃炎發生率、腸道組織增生或幽門桿菌感染分佈等處有任何改變。連續 36 個月，超過 250 位患者的持續治療研究中，在已有的結果中並沒有發現有意義的改變。

#### ●其他作用：

Sodium rabeprazole 尚未發現對中樞神經系統、心臟血管系統以及呼吸系統等造成全身性的副作用。Sodium rabeprazole，如以口服給予 20mg 兩星期，不會影響甲狀腺功能及碳水化合物代謝；亦不會影響副甲狀腺荷爾蒙、皮質醇、雌性激素、雄性激素、催乳激素、膽囊收縮素、內泌素、升糖素、瀘泡刺激素、黃體激素、腎活素、醛固酮或生長激素等荷爾蒙的功能。

### 【藥動學性質】依文獻記載

#### ●吸收：

本品是 sodium rabeprazole 的腸溶（抗胃酸）錠，原因是 rabeprazole 在酸中不穩定。因此 rabeprazole 的吸收只在錠劑離開胃部後才開始。吸收快速，在服用 20mg rabeprazole 大約 3.5 小時後可達最高血中濃度。劑量在 10mg ~ 40mg 之間時，rabeprazole 的最高血中濃度和 AUC 是呈線性關係。因有大部分進入 pre-systemic 代謝的關係，故在口服 20mg 後的絕對生物可用率（與靜脈注射相比）大約為 52%。此外，生物可用率並不會隨著重複的給與藥物而增加。在健康成人血漿中其半衰期大約 1 小時（範圍 0.7 ~ 1.5 小時），身體總清除率為 283 ± 98ml/min。不論是食物或是每日服藥時間都不會影響 sodium rabeprazole 的吸收。

#### ●分佈：

Rabeprazole 與血漿蛋白結合率大約 97%。

#### ●代謝及排泄：

人體血漿中主要的代謝物是 thioether (M1) 與 carboxylic acid (M6)；而 sulphone (M2)、desmethyl-thioether (M4) 和 mercapturic acid conjugate (M5) 為較少量的次要代謝物。只有 desmethyl (M3) 代謝物有少量的抗胃酸分泌作用，但不存於血漿中。

使用經 <sup>14</sup>C 標記的單一劑量 sodium rabeprazole 20mg 發現，沒有未改變的原型藥物在尿中排出。大約有 90% 的藥物以兩種代謝物：mercapturic acid conjugate (M5) 及 carboxylic acid (M6)，以及兩種未知代謝物之型式在尿中排泄。剩餘的劑量由糞便中排出。

#### ●性別：

以身體質量及身高作調整之後，並沒有發現服用單一劑量 rabeprazole 20mg 在藥物動力學上有特異性的性別差異。

#### ●腎功能障礙：

在情況穩定、末期且需要接受持續血液透析（creatinine 清除率 ≤ 5ml/min/1.73 m<sup>2</sup>）的腎衰竭患者，其 rabeprazole 的排除狀況與健康受試者非常相近。這類患者的 AUC 及 Cmax 與健康受試者相比大約少 35%。在健康受試者 rabeprazole 的平均半衰期為 0.82 小時，在血液透析患者為 0.95 小時，而在透析後為 3.6 小時。需要持續接受血液透析的腎臟疾病患者，對本品的清除率大約為健康受試者的兩倍。

#### ●肝功能障礙：

對輕到中度的慢性肝功能缺損患者給與單一劑量 rabeprazole 20mg 之後，其 AUC 與健康受試者相比增為兩倍，半衰期增為 2 ~ 3 倍。但每日給與本品 20mg 連續七日後，AUC 僅增加 1.5 倍且 Cmax 僅增加 1.2 倍。在肝功能障礙患者 rabeprazole 之半衰期為 12.3 小時，健康受試者為 2.1 小時。此二組的藥物動力學上的反應（胃部 pH 值控制）在臨牀上是相當的。

#### ●老年人：

老年人 rabeprazole 的排除會稍微降低。每日給與本品 20mg 連續七日後，與年輕健康受試者相比，其 AUC 大約增為兩倍，Cmax 增加 60% 而半衰期大約增加 30%。並沒有證據顯示 rabeprazole 在體內蓄積。

#### ●CYP2C19 多型體：

每日給與本品 20mg 連續七日後，慢速 CYP2C19 代謝者之 AUC 和半衰期約為快速代謝者的 1.9 與 1.6 倍；但 Cmax 僅增加 40%。

### 【臨床前安全資料】依文獻記載

以人類為方向的臨床前作用所得資料，就算是在人體最大量的觀察結果與動物資料相比仍是微不足道的。致畸性的研究無法得到確定的結果。以老鼠淋巴細胞株之試驗結果為陽性，但在胞內小核及胞內與胞外的 DNA 修補試驗中為陰性。致癌性研究顯示對人體並沒有特別的危險。

### 【配伍禁忌】

無。

### 【貯存上注意事項】

請儲存在 25°C 以下。

### 【賦形劑】

Lactose, Polyvinyl Pyrrolidone, L-HPC, Sodium Starch Glycolate, Sodium Carbonate, Talc, Magnesium Stearate, Hydroxypropyl Methylcellulose, Polyethylene Glycol 6000, Plasdone, Hydroxypropylmethylcellulose Phthalate, Castor Oil, Acryl-EZE, Tartrazine Aluminum Lake.

### 【包裝】

2 ~ 1000 錠塑膠瓶裝、鋁箔盒裝。

**十全實業股份有限公司**

南投縣南投市南崗工業區仁和路 27 號

電話 : (049)2254221

傳真 : (049)2254617

服務專線 : (049)2254615

訂購專線 : 0800-491666