rasidone 肌肉注射劑沒有發生過量使用的經驗。
rasidone膠囊過量的經驗有限，被證實最大攝取劑量是12,800毫克。此案例
錐體外徑症狀(extrapyramidal symptoms)及QT 間隔是446 毫秒 (沒有心臟的後
注)。 一般使用過量最常見的症狀有錐體外徑症狀(extrapyramidal symptoms)，
垂，顫抖，及焦慮。
以過量時，應考慮涉及多種藥物的可能性。Ziprasidone沒有特定的解毒劑。
生過量時，應確定並維持呼吸道的暢通，確保充分的換氣與和足夠的氧氣。
藥過量後，遲鈍、癲癇發作或頭頸部張力障礙反應的可能性也許會產生催吐
導致吸入的危險。應立即開始監測心血管功能，包括持續的心電圖監測以偵
可能發生的心律不整。鑒於ziprasidone 的高蛋白質結合率，血液透析不大可
對過量的治療有幫助。應當持續密切監視患者的狀況，直到患者復原爲止。

理特性

效學特性

體結合研究

prasidone對多巴胺第二型(D_2)受體有高親和力，對血清素2_A型($5HT_{2A}$)受體的
和力也很高。Ziprasidone也會作用在血清素$5HT_{2C}$、$5HT_{1D}$及$5HT_{1A}$受體，它對
些受體的親和力等於或大於它對D_2受體的親和力。Ziprasidone 對神經元的血
素及正腎上腺素運輸蛋白(transporter)具有中度親和力。Ziprasidone對組織胺
H_1)及α_1受體也有中度親和力。在這兩個受體上的拮抗作用分別與嗜睡及姿勢
低血壓有關。毒蕈鹼M_1受體上的拮抗作用與記憶力減退有關，但Ziprasidone
於M_1受體的親和力幾乎沒有。

受體功能研究

額外的臨床前研究探索了Ziprasidone在親合力中至強度受體上的致效或結抗作

用，Ziprasidone已被證實在血清素2_A型($5HT_{2A}$)及多巴胺第二型(D_2)受體上是
拮抗劑。它的抗精神病作用被認爲部分是由這兩種拮抗作用組合所產生的。
ziprasidone在$5HT_{2C}$和$5HT_{1D}$受體上也是強效拮抗劑，而在$5HT_{1A}$受體上是強效
致效劑，並且會抑制神經元回收正腎上腺素和血清素。Ziprasidone的血清素激
性及神經元回收特質與抗抑鬱活性有關。此外，$5HT_{1A}$致效作用與抗焦慮作用
有關。在$5HT_{2C}$受體上的強力拮抗作用與抗精神病活性有關。

人體正子射出電腦斷層造影(PET)研究

正子射出電腦斷層造影(PET)顯示，在給予ziprasidone 40毫克的口服劑量之後
12小時，超過80% 的$5HT_{2A}$受體與超過50% 的D_2受體被阻斷了。

藥動學特性

肌肉注射ziprasidone的生體可用率爲100%。肌肉注射給予單次劑量之後，通常
在給藥後60分鐘或早於60分鐘達到最高血清濃度，平均半衰期範圍 ($t_{1/2}$) 約2至
5小時。暴露量以與劑量有關的方式增加，且在肌肉注射給藥3天後觀察到少許
藥物蓄積作用。
靜脈注射給予ziprasidone的平均全身廓清率爲7.5毫升/分鐘/公斤，分佈體積約爲
1.5公升/公斤。Ziprasidone 廣泛地與血漿蛋白質結合(>99%)，它的結合似乎與
濃度無關。
肌肉注射ziprasidone mesylate後的代謝與排除尚未做系統地評估。肌肉注射
ziprasidone後的代謝物排泄模式應與口服給予無差異。
口服給藥之後，ziprasidone被廣泛代謝，只有少量以原型由尿液(<1%)或糞便
排除(<4%)。Ziprasidone主要經由三種代謝途徑排除，會形成四種主要的循環
代謝物，benzisothiazole piperazine (BITP) sulphoxide、BITP sulphone、ziprasidone
sulphoxide及S-methyl-dihydroziprasidone。約有20% 的劑量由尿液排除，約66%
由糞便排除。血清內未改變的ziprasidone約佔總藥物相關物質的44%。
活體外研究顯示，CYP3A4是催化ziprasidone 氧化代謝的主要P450細胞色素。
S-methyl-dihydroziprasidone 是由醛氧化酵及硫醇甲基轉移酵在兩個催化步驟中
產生的。
Ziprasidone、S-methyl-dihydroziprasidone及ziprasidone sulphoxide在活體外被測
試時，都顯示可能具有延長QTc作用的性質。S-methyl-dihydroziprasidone主要
經由糞便及CYP3A4催化的代謝作用排除。Sulphoxide 的排除是經由腎臟排泄，
及CYP3A4催化的第二期代謝。
在第一期臨床試驗中，CYP3A4抑制劑ketoconazole (400 毫克/天) 使ziprasidone
的血清濃度升高<40%。在ketoconazole治療期間內，S-methyl-dihydroziprasidone
的血清濃度根據ziprasidone的預期Tmax升高55%。未觀察到額外的QTc延長。
口服給藥後，在年輕與老年人，男性或女性受試者之間，ziprasidone 的藥動學
都沒有臨床上顯著的差異。
接受口服治療患者的ziprasidone血清濃度藥動學評估顯示，吸煙者與非吸煙者
之間沒有任何顯著的藥動學差異。
與腎功能正常的受試者相較，在中度至重度腎功能不全患者身上並未觀察到顯
著的口服ziprasidone藥動學差異，其代謝物的血清濃度有無升高仍未知。
由於ziprasidone肌肉注射劑中的賦形劑cyclodextrin由腎臟排泄，所以ziprasidone
用於腎功能不全患者須小心
輕度至中度肝功能不全 (Child-Pugh A或B) 患者口服用藥之後， ziprasidone的血
清濃度比正常受試者高30%，末端半衰期也大約延長了2小時。

臨床前的安全性資料

由口服給予ziprasidone的臨床前安全性資料顯示，根據安全性藥理學、基因毒性
及致癌性的傳統研究，ziprasidone對人體沒有特別的危險。大鼠及兔子的生殖
研究顯示，ziprasidone 沒有致畸性。
在引起母體毒性(如鎮靜、體重增長的減少)的劑量下，觀察到對生育力的不良
作用，以及死胎的數目增加，子代體重減輕及功能發展遲緩。
將母體的血漿濃度外插到類似於人體在治療劑量下的最高濃度時，有周產期死
亡率增加及子代功能發展遲緩的現象。
在注射給藥ziprasidone 研究中，沒有不良反應與本產品的臨床使用有關。

藥劑學特性

賦形劑

Sulphobutyl ether β-cyclodextrin sodium

配伍禁忌(主要的)

本品只能與注射用水混合(參閱使用與操作說明)。

保存期限

3年
本品經重新配製後，其化學與物理安定性可在25°C (室溫)下保持24小時，在
2-8°C下保持7天。基於微生物學觀點，建議藥品配製後立即用完或配製完成在
2-8°C下24小時內儘速用完。

儲存與處理

儲存溫度不可超過30°C。
將小瓶保存在原始包裝內，使用前勿拆封。
避免冷凍，以免稀釋劑安瓿受損。

包裝

20毫克以下小瓶裝，附等支數安瓿裝溶劑，1000支以下盒裝。

使用與操作說明

將供應的注射用水1.2 ml加入小瓶中，使濃度爲ziprasidone 20 毫克/毫升。充分
振搖藥瓶，直到完全溶解。只有無可見微粒的澄清溶液才可以使用。
每個小瓶中的藥液只可抽取一次，殘留的藥液應丟棄之。

版　本：CDS 199 (於 September 29, 2005修訂)
製造廠：Ben Venue Laboratroies Inc.
廠　址：300 Northfield Road, Bdeford, Ohio, 44146-0568, USA
包裝廠：Pfizer PGM
廠　址：Zone Industrielle de Poce-sur-Cisse, F-37401, Amboise Cedex, France
藥　商：輝瑞大藥廠股份有限公司
地　址：台北縣淡水鎮中正東路二段177號