

耐適恩注射劑40毫克

Nexium® Powder for solution for injection/infusion 40 mg (esomeprazole)

衛署藥字第024079號
本藥經由醫師使用

組成
每小瓶含有esomeprazole 40毫克 (以鈉鹽形式存在)。

劑型
注射劑輸注液用粉末
白色或米白色多晶塊狀或粉末狀

適應症
耐適恩注射劑用於不適合使用口服治療時之替代治療：

- 成人
 - 胃食道逆流性疾，於進食及/或有嚴重逆流症狀之病
 - NSAID治療相關之胃潰瘍的治療
 - 對於慢性內視鏡檢查急性出血性胃潰瘍或十二指腸潰瘍之後的再出血
- 1-18歲兒童及青少年
 - 不適合使用口服治療時之抗胃酸分泌治療。
- 胃食道逆流性疾，於嚴重逆流性食道炎及/或有嚴重逆流症狀之病

用法用量
成人

口服以鈉鹽的品質點滴輸注
對於不能接受口服治療的患者，可注射20-40 mg 每天一次加以治療。對於逆性食道炎患者，應採用40 mg 每天一次加以治療。耐適恩注射劑輸注之用法與口服20 mg 每天一次加以治療。

NSAID治療相關之胃潰瘍的治療：一般劑量為20 mg 每天一次。

通常耐適恩注射劑療程短，應該儘速改為口服治療。

用法
成人

耐適恩注射劑輸注之用法與口服20 mg 每天一次加以治療。耐適恩注射劑輸注之用法與口服20 mg 每天一次加以治療。

針對使用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鉀之藥品(如利尿劑)時，醫護人員宜於用藥前及用藥後定期監測病人血中鉀濃度。

與其他藥物之交互作用及其他形式之交互作用
應針對成人完成交互作用試驗研究

Esomeprazole對其他藥物之藥動力學影響
吸收受胃酸pH值影響的藥品
esomeprazole和其他質子泵抑制劑(如法莫替定、尼拉替尼)等，可能受胃酸pH值影響的藥物之吸收減少或增加。相同的，在以esomeprazole治療時，併發其他胃酸分泌抑制劑(如 ketoconazole, itraconazole及erlotinib)的藥物吸收降低，而digoxin的吸收會增加。健康自願受試者服用esomeprazole (40 mg)和digoxin治療，會使digoxin的主體可用率增加10% (10名受試者中每人增加30%)。Digoxin 中的雜質很少；然而，對老年患者使用高劑量esomeprazole時應謹慎，需要加強digoxin的藥物濃度監測。

曾有報告指出，omeprazole與一些蛋白質抑制劑交互作用，這些交互作用的臨床重要性及對最終的藥物未完全了解。在omeprazole治療期間提高胃酸pH值可能會改變蛋白質抑制劑的吸收。其他可能的交互作用包括與CYP2C19, itraconazole及netilmicin。曾有與omeprazole併服時血清濃度降低的報告，所以不建議同時給藥。

健康自願受試者服用omeprazole (40 mg 一天一次) 與 atazanavir 300 mg/ritonavir 100 mg，會使atazanavir 的暴露量大幅減少 (AUC, C_{max} 及 C_{min} 均減少約75%)。即使將atazanavir 的劑量增加至400 mg仍無法避免omeprazole對atazanavir 的暴露量所造成的影響。

相較於服用atazanavir 300 mg/ritonavir 100 mg 一天一次而未服用omeprazole 20 mg 一天一次，健康自願受試者服用omeprazole (20 mg 一天一次) 與 atazanavir 400 mg/ritonavir 100 mg，會使atazanavir 的暴露量減少約30%。與 omeprazole (40 mg 一天一次) 併服，則會使netilmicin 的暴露量 (AUC, C_{max}, C_{min} 及 C_{trough}) 減少30-50%，並使其具有藥理活性的代謝產物M8的平均AUC, C_{max} 及 C_{min} 減少75-92%。與saquinavir (與ritonavir併用) 併服，曾有在服用omeprazole (40 mg 一天一次) 期間，saquinavir 的血清濃度升高(80-100%)的報告。Omeprazole 20 mg 一天一次與amprenavir (與ritonavir併用) 和amprenavir (與ritonavir併用) 的暴露量沒有影響。Esomeprazole 20 mg 一天一次與amprenavir (與ritonavir併用) 或ritonavir 的暴露量沒有影響。Omeprazole 40 mg 一天一次治療topiramate (與phenytoin併用) 沒有影響。由於omeprazole與esomeprazole 的藥效學反應與藥學性質相似，故不建議同時給予esomeprazole與esomeprazole，並禁止同時服用esomeprazole與netilmicin。

CYP2C19 抑制劑
Esomeprazole會抑制CYP2C19的作用。這與esomeprazole的主要代謝產物。因此esomeprazole與其他經由CYP2C19 代謝的藥物併用時 (例如diazepam, citalopram, imipramine, clomipramine, phenytoin) 等，這些藥物的血清濃度可能上升，因而需要降低劑量。同時口服esomeprazole 30 mg，會使CYP2C19 代謝的diazepam 清除率降低45%，同時口服esomeprazole 40 mg 與phenytoin，會使服用者phenytoin 之血清濃度升高13%。因此建議當esomeprazole開始使用及停用之時，應監測血中phenytoin 之濃度。Omeprazole (40 mg 一天一次) 會使voriconazole (CYP2C19 的抑制劑) 的C_{max} 及AUC 分別增加15% 及14%。

臨床試驗顯示，接受warfarin (抗凝血劑) 者同時口服esomeprazole 40 mg，其凝血時間仍在可接受的範圍內；然而口服esomeprazole 上訴之後，在併服用warfarin 治療期間已發現一些有臨床意義的國際標準化時間比 (INR) 升高的使用案例。因此建議使用warfarin 或其他coumarin 衍生物治療期間，當開始及停止併服esomeprazole 之時，應進行密切監測。Omeprazole與esomeprazole 是CYP2C19 抑制劑。在一項又研究中，健康受試者使用omeprazole 40mg 造成clostazolol 的C_{max} 及AUC 分別增加約20%。其中一些活性代謝物的C_{max} 和AUC 分別增加20%和30%。在健康自願受試者，同時口服esomeprazole 40 mg 與cispripide，會造成cispripide 的血清濃度與時間曲線下面積 (AUC) 增加32%，排除非預期 (1,4) 或31%。Esomeprazole 的暴露量與血清濃度沒有顯著增加。在cispripide 單藥使用後造成的QTc 間隔稍微延長，並不因esomeprazole 同時服用而增加。曾有併用esomeprazole 與tacrolimus 會增加tacrolimus 之血清濃度的報告。研究顯示esomeprazole 對amoxicillin 或amoxicillin 2-巯基嘧啶，在臨床上並無顯著影響。

未對高劑量耐適恩注射劑療法 (80 mg 8 mg h) 進行體外交互作用研究。Esomeprazole 對由CYP2C19 衍生的藥物之影響在此處可能更顯著。因此在正式耐適恩注射劑療法中，應密切注意是否有不良反應。

在健康自願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) 與esomeprazole (每天40 mg 口服) 之間的藥物學-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%。然而，不確定這些交互作用對任何程度才有臨床重要性。一個前瞻性隨機(但不完全) 研究性試驗超過370名服用clopidogrel 和ASA 治療的患者中比較服用esomeprazole 20mg 和對大型前瞻性隨機臨床試驗研究超過47,000 患者所得數據進行後端分析，沒有發現任何證據顯示給予clopidogrel 和PPIs (包括esomeprazole) 時，心血管不良事件的風險增加。

關於同時給予clopidogrel 與PPIs 時，心血管事件之風險是否有增加，一些觀察性研究所得的結果不一致。在一項對健康受試者進行的研究中，同時給予clopidogrel 與固定劑量藥物(esomeprazole 20 mg + ASA 81 mg) 時，與單獨服用clopidogrel 相比，clopidogrel 的活性代謝產物的暴露量減少約40%。然而，在clopidogrel 與clopidogrel 複方產品(esomeprazole + ASA) 組的受試者中，對ADP 誘導之血小板凝集的最大抑制作用相同，可能是由於同時給予低劑量ASA 所致。

戒菸的輔助
與質子泵抑制劑併用時，有報告指出有些人的methetoxate 血清濃度，在給予高劑量methetoxate 時，可能需要考慮同時服用esomeprazole。

其他藥物對esomeprazole 藥動力學之影響
Esomeprazole 與CYP2C19 和CYP3A4 衍生的藥物。Esomeprazole 與CYP3A4 抑制劑 clarifromycin (500 mg b.i.d.) 併服時，會使esomeprazole 之暴露量 AUC 增加一倍；Esomeprazole 與同時是CYP2C19 抑制劑又是CYP3A4 抑制劑的藥品併服時，可能使esomeprazole 之暴露量增加一倍以上。CYP2C19 及CYP3A4 抑制劑 voriconazole 會使esomeprazole AUC 增加28%。在以上三種情況下，暴露量與esomeprazole 之劑量。然而，對於功能嚴重不良的患者以及有長期治療需求時，應注意藥物濃度。

曾報導 CYP2C19 或CYP3A4 或兩者 (如 tramipocin 和聖約翰草) 的藥物，可能會使esomeprazole 的暴露量增加，導致esomeprazole 的血清濃度下降。

懷孕及授乳期間使用
僅有少數有關併服用esomeprazole 之資料可供參考。Esomeprazole 對動物實驗中，對胎動胎兒發育方面，並未顯示其有直接或間接之不良影響。在動物實驗中，使用劑量與相對劑量，生及產後之發育，並無直接或間接之不良影響。隨此藥之藥力被孕婦時，仍應持續謹慎。

目前尚不知道esomeprazole 是否進入人乳中排出。亦未對授乳婦進行研究。因此，在授乳期間不應服用Nexium。

駕駛或操作機械能力之影響
Nexium 不可能影響駕駛或操作機械的能力。

用法
成人

耐適恩注射劑輸注之用法與口服20 mg 每天一次加以治療。耐適恩注射劑輸注之用法與口服20 mg 每天一次加以治療。

用法
成人

耐適恩注射劑輸注之用法與口服20 mg 每天一次加以治療。耐適恩注射劑

