耐適恩®懸浮用顆粒劑 10 毫克

Nexium® 10mg gastro-resistant granules for oral suspension

衛署藥輸字第 024991 號

組成

每個藥袋含有 10 mg 的 esomeprazole (以 magnesium trihydrate 化合物形式存在)。

賦形劑：sucrose 和 glucose anhydrous

完整之賦形劑請參閱【賦形劑內容表】

劑型

作為口服懸液劑的耐胃酸顆粒，鋁箔袋裝
淡黃色細顆粒。可能帶有棕色的顆粒。

適應症

耐適恩口服懸液劑主要是用於 1 至 11 歲胃食道逆流性疾病以及糜爛性食道炎之治療。
說明：胃食道逆流性疾病(GERD)
-糜爛性逆流性食道炎(erosive reflux esophagitis)之治療
-對於食道炎已痊癒之患者，預防其復發之長期處置
-胃食道逆流性疾病之症狀治療
耐適恩口服懸液劑也可以用於吞嚥崩散耐適恩錠(Nexium gastro-resistant tablets)有困難的的病人；12 歲以上病人的適應症請參閱「耐適恩錠仿單」。

用法用量

本藥須由醫師處方使用
要服用 10mg 劑量時，將含有 10mg 藥物的藥袋完全倒空至一杯含 15ml 非碳酸類的水中；要服用 20mg 劑量時，將 2 包含有 10mg 藥物的藥袋完全倒空至一杯含 30ml 非碳酸類的水中，攪拌內容物然後放置 2 至 3 分鐘使其變濃，再一次攪拌後於 30 分鐘以內喝下去，如果喝完後有剩下東西在杯裡，多加一些水、攪拌，然後立刻喝下去。
對於插有鼻胃管或胃管的病人，請見仿單最後之【使用和處理說明】

1 至 11 歲孩童，體重 ≥ 10 kg
胃食道逆流性疾病(GERD)
-糜爛性逆流性食道炎之治療
體重 ≥10 ~ <20 kg: 每天 1 次，每次 10 mg，使用為期 8 週
體重 ≥20 kg: 每天 1 次，每次 10 mg 或 20 mg，使用為期 8 週
-對於食道炎已痊癒之患者，預防其復發之長期處置
每天 1 次，每次 10mg

-胃食道逆流性疾病之短期症狀治療
每天 1 次，每次 10mg，使用達 8 週
超過 1mg/kg/day 的劑量目前尚未被研究過
Nexium 使用於 1 至 17 歲的兒童與青少年以短期治療胃食道逆流性疾病是根據成人的臨床試驗及兒童與青少年的安全性與藥動學研究，其他方面之兒童使用的療效與安全性尚未確立。

成人及 12 歲以上之青少年
12 歲以上之用法用量請參閱「耐適恩錠仿單」

1 歲以下的孩童
耐適恩不可用於 1 歲以下的孩童，因為沒有相關的臨床資料。

腎功能不良
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，治療此類病人仍需特別謹慎。(請參閱【藥物動力學】)

肝功能不良
對肝功能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【藥物動力學】)

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 不能和 atazanavir、nelfinavir 合併使用。(請參閱【與其他藥物之交互作用及其他形式之交互作用】)

警語及注意事項

當任何警示性症狀出現時(如體重無故地顯著減輕、反覆嘔吐、吞嚥困難、吐血或黑糞)及懷疑或已存在之胃潰瘍時，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)需接受規則的監測。
視需要治療的病人(on-demand treatment)若有特別的症狀改變時，應與醫師聯繫，但無使用於孩童之相關研究，故不建議用於孩童病患。在 esomeprazole 用於視需要治療中時，因為 esomeprazole 的血漿濃度波動而引起的與其他藥物的相互作用，應該加以考慮。(請參閱【與其他藥物之交互作用及其他形式之交互作用】)
本藥品含有蔗糖和葡萄糖，患有果糖不耐症、葡萄糖-半乳糖吸收不良症或蔗糖異麥芽糖酶(sucrase-isomaltase insufficiency)不足等等的稀有遺傳性疾病的病人，不可使用此藥物。

使用質子幫浦抑制劑治療可能使發生腸胃道感染的風險略微增加，例如沙門桿菌(Salmonella)及彎曲桿菌(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)。如果判斷 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 的劑量不得超過 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)之間的藥動學/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】)。

干擾實驗室檢驗
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。

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。

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。

低血鎂
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。

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。

與其他藥物之交互作用及其他形式之交互作用

僅針對成人完成交互作用試驗研究

Esomeprazole 對其他藥物之藥動學影響

吸收會受胃液 pH 值影響的藥物
以 esomeprazole 和其他質子幫浦抑制劑治療時，因抑制胃酸分泌，可能會使受胃液 pH 值影響的藥物之吸收減少或增加。相同的，在以 esomeprazole 治療時，併用其他會減少胃內酸度的藥物，會使如 ketoconazole、itraconazole 及 erlotinib 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 的生體可用率增加 10%(10 名受試者中有 2 人增加達 30%)。Digoxin 中毒的報導很少；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 與一些蛋白酶抑制劑交互作用，但未必知道這些交互作用的臨床重要性及其背後的機制。在 omeprazole 治療期間提高胃液 pH 值可能會改變蛋白酶抑制劑的吸收。其他可能的交互作用機制是透過 CYP 2C19。就 atazanavir 和 nelfinavir 而論，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。Omeprazole(esomeprazole 為 omeprazole 之 S 型光學異構物)每天 40mg 和 atazanavir 300mg / ritonavir 100mg 併用於健康自願受試者，會造成 atazanavir 暴露量大幅降低(血漿濃度-時間曲線面積(AUC)， 最高血漿濃度(Cmax) 和 最低血漿濃度(Cmin)約降低 75%)，增加 atazanavir 劑量達 400mg 不會補償 omeprazole 對 atazanavir 造成的影響。相較於服用 atazanavir 300 mg/ritonavir 100 mg 一天一次而未併服 omeprazole 20 mg 一天一次，健康自願受試者併用 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 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產物 M8 的平均 AUC、C_{max} 及 C_{min} 減少 75-92%。就 saquinavir (與 ritonavir 併用) 而論，曾經有在併用 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 一天一次治療對 darunavir (與 ritonavir 併用) 和 amprenavir (與 ritonavir 併用) 的暴露量沒有影響。Esomeprazole 20 mg 一天一次治療對 amprenavir (與 ritonavir 併用或無) 的暴露量沒有影響。Omeprazole 40 mg 一天一次治療對 lopinavir (與 ritonavir 併用) 的暴露量沒有影響。由於 omeprazole 與 esomeprazole 的藥效學效應與藥動學性質類似，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 的作用，它是 esomeprazole 的主要代謝酵素。因此 esomeprazole 與其他經由 CYP2C19 代謝的藥物合用時 (例如 diazepam, citalopram, imipramine, clomipramine, phenytoin 等等)，這些藥物的血漿濃度可能上升，因而需要降低劑量。在視需要療法中使用 esomeprazole 時，特別需要考慮此藥物相互作用。併用 esomeprazole 30 mg，會使被 CYP2C19 代謝 diazepam 之清除率降低 45%。併用 esomeprazole 40 mg，會使癲癇患者血中 phenytoin 之最低濃度升高 13%。因此建議當 esomeprazole 啟用及停用之時，應監測血中 phenytoin 之濃度。
Omeprazole(每天 40mg)會使 voriconazole(一個 CYP2C19 的受質)之 C_{max} and AUCτ 分別增加 15%和 41%。
臨床試驗之結果顯示，以 warfarin 治療之病人若併用 40 mg 的 esomeprazole 後，其凝血時間在可接受之範圍內。然而在上市後，有些獨立個案指出同時併用時會造成 INR 臨床上顯著地增加。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 和 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 cilostazol 的 Cmax 和 AUC 分別增加 18% 和 26%，其中一個活性代謝物的 Cmax 和 AUC 分別增加 29% 和 69%。
在健康自願者中，同時使用 40 mg 的 esomeprazole 造成 cisapride 的 AUC 有 32%增加，廓清半衰期 ($t_{1/2}$) 延長 31%，但對其血漿最高濃度沒有顯著增加。在 cisapride 單獨使用後造成的 QTc 間期輕度延長，不因與 esomeprazole 同時使用而更加延長。(請參閱【使用上需特別提醒及注意之事項】)
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 quinidine 之藥動學，在臨床上並無顯著之影響。
短期研究顯示，同時併用 esomeprazole 與 naproxen 或 rofecoxib，在臨床上並無顯著之藥動學交互作用。

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)之間的藥動學/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，不確定這種交互作用要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 治療的患者中比較安慰劑與 omeprazole 20mg)和對大型前瞻性隨機臨床結果研究(超過 47,000 名患者)所得數據進行的非隨機事後分析，沒有發現任何證據證明給予 clopidogrel 和 PPIs (包括 esomeprazole)時，心血管不良結果的風險會加。

關於同時投予 clopidogrel 與 PPI 時，心血管血栓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，同時投予 clopidogrel 與固定劑量複方藥物(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 組和 clopidogrel+複方產品(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。

未知的機制
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，可能需要考慮暫時停用 esomeprazole。

其他藥物對 esomeparzole 藥動學的影響

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 之暴露量(AUC)增加 1 倍； Esomeprozole 與同時是 CYP2C19 抑制劑又是 CYP3A4 抑制劑的藥品併服時可能會使 esomeprazole 之暴露量增加一倍以上；同時是 CYP2C19 抑制劑又是 CYP3A4 抑制劑的 voriconazole 會增加 omeprazole AUCτ達 280%。然而，在以上二種情況下通常都無須調整 esomeprazole 之劑量，但是有嚴重肝功能不全的病人若需長期使用，應該要考慮調整劑量。
會誘導 CYP2C19 或 CYP3A4 或兩者 (如 rifampicin 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 omeprazole 用於大量孕婦之資料顯示並無畸胎或胎兒毒性。Esomeprazole 在動物實驗中，對胚胎/胎兒發育方面，並未顯示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、生產及產後子代的發育，並無直接或間接之不良影響。開此藥之處方給孕婦時，還是應特別謹慎。
目前並不知道 esomeprazole 是否會由人類乳汁中排出；亦未曾對哺乳中婦女進行研究。因此，在哺乳期間不應使用 Nexium。

對駕駛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 臨床試驗以及上市後的經驗中，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。
這些不良反應依照發生之頻率分類排列：極常見(≥1/10)；常見(≥1/100 且<1/10)；少見(≥1/1000 且<1/100)；罕見(≥1/10000 且<1/1000)；極罕見(<1/10000)；未知 (不能從現有的數據估計)。

一般疾病及投予部位狀況
罕見：倦怠、流汗增加

呼吸道、胸腔及縱隔疾病
罕見：支氣管痙攣

血液及淋巴系統疾病
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

神經系統疾病
常見：頭痛
少見：暈眩、感覺異常、困倦
罕見：味覺障礙

免疫系統疾病
罕見：過敏反應，如發燒、血管性水腫及過敏性反應/休克(anaphylactic reaction/ shock)

皮膚及皮下組織疾病
少見：皮膚炎、搔癢、紅疹、蕁麻疹
罕見：禿頭、光敏感性
極罕見：多形性紅斑、Stevens-Johnson 症候群、Toxic epidermal necrolysis (TEN)

肝膽疾病
少見：肝酵素增加
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腦病變

胃腸道疾病
常見：腹痛、便秘、腹瀉、腹脹、噁心 / 嘔吐
少見：口乾
罕見：口腔炎、腸胃道念珠菌感染
極罕見：經顯微鏡診斷之大腸炎

代謝及營養疾病
少見：週邊水腫
罕見：低血鈉症
極罕見：低血鎂，嚴重的低血鎂症可能引起低血鈣症。低血鎂症也可能會引起低血鉀症

肌肉骨骼、結締組織及骨骼疾病
罕見：關節痛、肌痛
極罕見：肌肉無力

腎臟及泌尿道疾病
極罕見：間質性腎炎

精神醫學方面疾病
少見：失眠症
罕見：不安、神智錯亂、沮喪
極罕見：侵略性、幻覺

生殖系統及乳房疾病
極罕見：男性女乳症

視覺疾病
罕見：視覺模糊

聽力及內耳迷路疾病
少見：眩暈

上市後經驗: 代謝和營養方面異常 - 低血鎂

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。

藥效學性質
藥理分類：氫離子幫浦抑制劑
ATC Code: A02B C05
Esomeprazole 為 omeprazole 之 S 型光學異構物，經由專一性抑制胃壁細胞之氫離子幫浦而降低胃酸分泌。Omeprazole 的 R 及 S 型光學異構物二者有相似的藥理活性。

作用部位及機轉
Esomeprazole 為一弱鹼，其會在胃壁細胞內之細胞內小管，高度酸性環境下集中，並轉化成活性型而抑制酸幫浦：H^+-K^+-ATP 酵素。Esomeprazole 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 口服之後，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 刺激所生之胃酸分泌可減少達 90%。
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，則分別達 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 97%、92%及 56%。
以血漿 esomeprazole 濃度與時間，所形成 AUC，來代替血漿濃度，已顯示其對酸分泌之抑制程度，與劑量之間有相關性。

抑制胃酸之療效
逆流性食道炎患者以 esomeprazole 40 mg 治療 4 週後，有 78%之病人痊癒，治療 8 週後則有 93%。

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，嗜鉻粒蛋白 A（CgA）也會增加。CgA 濃度升高可能會干擾神經內分泌腫瘤的調查。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。
ECL 細胞的增加可能與血清胃泌素增加有關，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，據報告顯示胃腺囊腫之發生率有一點增加；此係胃酸被顯著抑制後之生理變化，其為良性且被認為具可復性。
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使發生腸胃道感染的風險略微增加，例如沙門桿菌(Salmonella)及彎曲桿菌(Campylobacter)，在住院病人，可能還有困難梭狀芽孢桿菌(*Clostridium difficile*)。

小兒族群
在一個以胃食道逆流性疾病的小兒患者(<1 至 17 歲)長期使用質子幫浦抑制劑治療的研究中，觀察到 61%的兒童有輕微程度未知臨床意義的 ECL 細胞增生，未發展為萎縮性胃炎或類癌瘤。

藥動學性質
吸收及分佈
Esomeprazole 對酸不穩定，以腸衣顆粒之劑型口服。在活體內轉化成 R 型光學異構物之量非常少。Esomeprazole 之吸收迅速，給藥後 1-2 小時即可達血中最高濃度。在 40 mg 的 esomeprazole 單一劑量後的絕對生體可用率為 64%，並在重複一天一次的給藥後增加至 89%。若是 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。

代謝及排除
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 之羥基代謝物及去甲基代謝物。其他部分則依賴另一特定之異型酵素 CYP3A4，負責形成 esomeprazole 之磺酸鹽代謝物，此為其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，在重覆給藥後為 9 L/h。在每天 1 次重覆給藥後，其排除半衰期約為 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 重覆給藥而增加；此種增加係劑量依賴性，且導致在重覆給藥後，其 AUC 增加之相對比例高於劑量增加，呈現非線性之關係。此種時間及劑量依賴性，係因為首度代謝及全身清除率降低所致；此可能因為 esomeprazole 及其磺酸代謝物抑制了 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%以其代謝產物由尿中排除，其餘則由糞便中排除。只有低於 1%之原藥可在尿液中發現。

特殊病人族群
約有 2.9±1.5%的人口(歐美白種人口中約有 3%而在我國人口中可能有 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。這些發現與 esomeprazole 的用量並無關聯。
Esomeprazole 之代謝在老年人中(71-80 歲)並無顯著之變化。

在單一劑量 40 mg 的 esomeprazole 使用後，女性的血漿濃度時間曲線下的面積大約高於男性 30%，重複的一天一次使用後則無性別差異存在。這些發現與 esomeprazole 的用量並無關聯。

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的 esomeprazole 代謝率降低，導致血漿濃度時間曲線下的面積加倍，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。
本藥並未曾在腎功能不良之患者進行研究。因為腎臟負責 esomeprazole 代謝物之排泄，但不負責 esomeprazole 之排除，所以在腎功能不良之患者身上，一般認為 esomeprazole 之代謝，並不會有顯著之變化。

未成年人
12 至 18 歲之青少年
重複給予 20mg 或 40mg 之 esomeprazole，12 至 18 歲之青少年的總暴露量(AUC)和藥物達最高血漿濃度所需時間(t_{max})在給予相同劑量下的成人相似。

1 至 11 歲之孩童
每天給予一次 10mg 的 esomeprazole 連續 5 天後，6 至 11 歲年紀範圍孩童的總暴露量(AUC)和給予 esomeprazole 20mg 劑量下的青少年和成人是相似的；但 1 至 5 歲孩童的暴露量會比 6 至 11 歲孩童高出約 30%。Esomeprazole 20mg 在 6 至 11 歲孩童的暴露量較同樣劑量下之青少年和成人來的高，但低於 esomeprazole 40mg 在青少年和成人的暴露量。

表 1. 1 至 11 歲患有胃食道逆流性疾病(GERD)孩童每天投予一口服劑量之 esomeprazole 連續 5 天後的藥物動力學參數值摘要

	1 至 5 歲	6 至 11 歲	
參數	10mg (N=8)	10mg (N=7)	20mg (N=6)
AUC (μmol*h/L)*	4.83	3.70	6.28
Cmax (μmol/L)*	2.98	1.77	3.73
tmax (h)†	1.44	1.79	1.75
$t_{1/2\lambda Z}$ (h)*	0.74	0.88	0.73
Cl/F (L/h)*	5.99	7.84	9.22

*幾何平均值
†算數平均值

表 2. 每天重複給予 esomeprazole 口服治療 12 至 17 歲患有胃食道逆流性疾病(GERD)之青少年及成人 GERD 症狀治療之藥物動力學參數值對照

	12 至 17 歲 (N=28)		成人 (N=36)	
參數	20mg	40mg	20mg	40mg
AUC (μmol*h/L)	3.65	13.86	4.2	12.6
Cmax (μmol/L)	1.45	5.13	2.1	4.7
tmax (h)	2.00	1.75	1.6	1.6
$t_{1/2\lambda Z}$ (h)	0.82	1.22	1.2	1.5

AUC, Cmax 和 $t_{1/2\lambda Z}$ 的數據以幾何平均值表示; tmax 的數據以中位數表示之。
*12 至 17 歲青少年和成人接受口服治療的時間分別為 8 天和 5 天。數據分別由 2 個不同的試驗結果取得。

臨床研究
孩童
胃食道逆流性疾病(GERD)
1 至 11 歲
在一項多中心、平行之臨床試驗，針對 109 位(年齡 1 至 11 歲；53 位女孩；計有：白種人 89 名，黑人 19 名，其他人種 1 名)經內視鏡檢測證實患有胃食道逆流性疾病病史之兒童病患，投予口服之 Nexium 每日一次，持續 8 週後，評估其安全性及耐受性。

依病患體重給予之劑量如下:
體重< 20 公斤：esomeprazole 5mg 或 10mg 每日一次
體重≥ 20 公斤：esomeprazole 10mg 或 20mg 每日一次
且以內視鏡區分病患是否患有糜爛性食道炎。
結果顯示 109 位病人中，試驗前有 53 位患有糜爛性食道炎(51 位輕微，1 位中度和 1 位重度食道炎)，在 8 週治療結束時，大多數接受內視檢查的病患皆已痊癒。然而此現象不排除為自然痊癒，因這些病人在試驗開始前已伴隨有低程度之糜爛性食道炎，且此試驗並未有對照組。

賦形劑內容表
*Esomeprazole 顆粒：
Glycerol monostearate 40-55、Hydroxypropyl cellulose、Hypromellose、Magnesium stearate、Methacrylic acid-ethyl acrylate copolymer (1:1)、Polysorbate 80、Sugar spheres (sucrose and maize starch)、Talc、Triethyl citrate。

*賦形劑顆粒：
Citric acid anhydrous (為調整 pH 值) 、Crospovidone 、Glucose anhydrous、Hydroxypropyl cellulose、Yellow iron oxide (color E172) 、Xanthan gum。

配伍禁忌
目前無已知之配伍禁忌。

儲架期
須於泡製完成後 30 分鐘內服用。**請參閱**外盒說明。

貯存時注意事項
貯存低於 25℃處

包裝
鋁箔袋裝。請參閱外盒說明。

棄置和處理之注意事項
對於插有鼻胃管或胃管的病人
1. 要服用 10mg 劑量時，把 1 包含 10mg 藥物的藥袋倒至 15ml 水中。
2. 要服用 20mg 劑量時，把 2 包含 10mg 藥物的藥袋倒至 30ml 水中。
3. 攪拌
4. 放置幾分鐘使其變濃
5. 再次攪拌
6. 將懸浮液注入注射器
7. 泡製後 30 分鐘內經由注入管(尺寸 6 French 以上)以進入胃中
8. 再加 15ml 水(如服用 10mg 劑量) 或 30mL 水(如服用 20mg 劑量)於注射器中
9. 搖晃並沖洗剩餘在管中的藥物進入胃中。

未服用之懸浮液應予丟棄。

修改日期： 2013 年 9 月

本註冊商標屬 AstraZeneca 集團之財產。
© AstraZeneca 2008 - 2013

製造廠：AstraZeneca AB
製造廠地址：SE-151 85 Södertälje 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

GI.000-156-127.5.0