

樂酸克凍晶注射劑 40 公絲

LOSEC 40mg I.V. Injection

Omeprazole

本

【組成】

Losec 凍晶注射劑 40mg 包裝盒含有 1 小藥瓶及 1 安瓿注射溶劑。每一小藥瓶含有 omeprazole 鈉鹽，相當於 omeprazole 40mg。賦形劑成分請參閱【賦形劑】。

【劑型】

靜脈注射用凍晶粉末和注射溶劑。

【適應症】

下列病症無法以口服藥物有效治療時之取代療法：十二指腸潰瘍、胃潰瘍、逆流性食道炎及 Zollinger-Ellison 症。

【用法用量】

十二指腸潰瘍、胃潰瘍或逆流性食道炎：患者若不適用口服藥物時，建議改用 Losec 凍晶注射劑 40mg 每天 1 次來代替。一般要治療 2-3 天再改口服治療。

Zollinger-Ellison 症候群：須依個人需要來調整劑量，有些患者可能需要較高之劑量及/或每天給予多次劑量。

靜脈治療可以注射給藥，應在注射劑調配好之後，以每分鐘不超過 4 ml 之速率緩慢地給藥至少 2.5 分鐘以上。

腎功能不良：腎功能不良之患者並不須調整劑量。

肝功能不良：肝功能不良之患者，其清除率會大幅降低。

老年病患：老年患者並不須調整劑量。

兒童：兒童使用之經驗相當有限。

【禁忌】

已知對 omeprazole 會發生過敏反應者。

如同其他質子幫浦抑制劑一樣，Omeprazole 不能與 atazanavir 併用(請見【交互作用】)。

【警語及注意事項】

當懷疑是胃潰瘍時，應在早期用 X 光或內視鏡確認，以避免不適當的治療。當有胃潰瘍或懷疑是胃潰瘍，或有下列任一警示症狀：非刻意的體重明顯下降、反覆性嘔吐、吞嚥困難、吐血或黑糞時，應先確認其非惡性腫瘤，因本治療可能會減輕症狀，而延誤其診斷。

【交互作用】

Omeprazole 對其他藥物藥動學之影響

下列藥物應避免與 Losec 凍晶注射劑合併使用：ketoconazole 和 itraconazole。

Omeprazole 可能因其對胃內酸度的作用而影響其他藥物的吸收。

若藥物治療(制酸劑、酸分泌抑制劑、sucralfate)使得胃液 pH 值增加，ketoconazole 錠劑在胃內的溶解便會受到不良影響，以致 ketoconazole 無法達到有效的血漿濃度。併用 omeprazole 和 itraconazole 治療期間，itraconazole 的血漿濃度和 AUC 減少約 65%，可能是吸收較差所致，因其吸收具 pH 依賴性。

Omeprazole 會抑制 CYP2C19 酵素，因此會造成使其他由此酵素代謝的藥物(如 diazepam、phenytoin、warfarin (R-warfarin, 活性較低的形式))之血漿濃度升高。對於已接受 phenytoin、warfarin 或其他維生素 K 拮抗劑治療之患者，建議在開始服用 omeprazole 或停藥時應予以監測。

每天服用 omeprazole 40mg 會導致 voriconazole(CYP2C19 之受質)的最高血中濃度(C_{max})和血漿濃度-時間曲線下面積(AUC)分別增加 15%及 41%。

與 clarithromycin 或 erythromycin 併用期間，omeprazole 的血漿濃度會升高。與 amoxicillin 或 metronidazole 併用期間，omeprazole 的血漿濃度不受影響。

健康受試者併用 omeprazole(40mg 每天一次)和 atazanavir 300mg / ritonavir 100mg，報告顯示會大幅減少 atazanavir 之暴露量(AUC, C_{max} 和 C_{min} 約減少 75%)。即使將 atazanavir 的劑量增加至 400mg 仍無法補償 omeprazole 對於 atazanavir 的暴露量所造成的影響。質子幫浦抑制劑(包括 omeprazole)不能與 atazanavir 併用(參見【禁忌】)。

併用 omeprazole 和 tacrolimus 可能會增加 tacrolimus 之血清濃度。在開始或停止服用 omeprazole 治療時，建議監測 tacrolimus 的血漿濃度。

其他藥物對 omeprazole 藥動學之影響

具抑制 CYP2C19 或 CYP3A4 作用的藥物(HIV 蛋白? 抑制劑、ketoconazole、itraconazole 等)會引起 omeprazole 的血漿濃度升高。Voriconazole 會使 omeprazole 的曲線下面積(AUC)增加 280%。如需合併使用時，對於被認為具肝功能不全的病患及有長期治療需求時，應考慮調整 omeprazole 之使用劑量。

Omeprazole 和制酸劑、theophylline、caffeine、quinidine、lidocaine、propranolol、metoprolol 或乙醇之間，並未偵測到有交互作用。

【懷孕及授乳】

懷孕：由執行良好的流行病學研究指出，omeprazole 對懷孕或對胎兒/新生兒的健康沒有不良影響。因此在懷孕期間可以使用 omeprazole。

授乳：Omeprazole 可由乳汁排除，其對小孩的影響不明。

【對駕駛及操作機器能力之影響】

Losec 對開車或操作機器之能力，不會有影響。

【不良反應】

在 Losec 臨床試驗中，最常報告的不良反應是胃腸症狀，例如腹瀉、噁心、便秘，以及頭痛，各有 1-3% 案例發生。

頻率/器官	常見 (>1/100, <1/10)	少見 (>1/1000, <1/100)	罕見 (>1/10000, <1/1000)
一般障礙	頭痛	倦怠	流汗增加、周邊水腫、低鈉血症。過敏反應如喉頭水腫、發燒和過敏性休克
血液障礙			白血球減少症、血小板減少症、顆粒性白血球減少症及全血球低下症
內分泌障礙			男性女乳症
胃腸道障礙	腹瀉、噁心/嘔吐、便秘、腹痛、脹氣		口乾、味覺障礙、口腔炎及念珠菌病
皮膚障礙		皮疹、皮膚炎、搔癢、蕁麻疹	掉髮、光敏感、多形性紅斑
肝膽障礙		肝功能測試異常	有嚴重肝病之患者發生腦病變、肝炎合併(或無)黃疸、肝衰竭
呼吸道障礙			支氣管痙攣
肌肉骨骼障礙			關節痛、肌痛、肌肉無力
神經障礙		感覺異常、頭暈、想睡	
精神障礙		睡眠障礙	可逆性精神混亂、興奮、抑鬱、攻擊及幻覺，主要出現於病情相當嚴重之患者
腎臟及泌尿道障礙			間質性腎炎
視覺障礙			視力模糊

在少數個案中，曾有 Stevens-Johnson 症候群和毒性表皮壞死症之報告，但其與 omeprazole 的關係尚未確立。臨床試驗結果顯示，omeprazole 與 clarithromycin 併用曾觀察到中樞神經系統(尤其是頭痛)及胃腸道方面的副作用發生率增加。

【過量】

在臨床研究中，單日靜脈給予高達 270 mg 之劑量，及 3 日內給予高達 650 mg 之劑量，並無任何與劑量有關之不良反應。

症狀：頭暈、神情呆滯、頭痛、精神混亂、血管擴張、心搏過速、噁心、嘔吐、脹氣、腹瀉。參閱【不良反應】。

治療：如需要時，可採用胃灌洗、活性炭之症狀療法。

【藥效學性質】

ATC Code：A02B C01

酸抑制劑-質子幫浦抑制劑。

Omeprazole 是具有取代基的 benzimidazole。Omeprazole 係由兩種具活性之鏡像異構物組成之消旋混合物，藉由專一性地抑制胃壁細胞內之酸幫浦，來減少胃酸之分泌。其對胃酸分泌之效應是可逆的。Omeprazole 為一弱鹼，會在胃之壁細胞內小管的高度酸性環境下聚集，並轉化成活性型，而抑制酸幫浦：H⁺-K⁺-ATP 酵素。其作用在胃酸形成之最後步驟，具劑量依賴性，且對基礎之胃酸分泌及刺激下之胃酸分泌(無論何種刺激)，均有抑制效果。Omeprazole 不會影響膽素(cholinergic)或組織胺受體。如同 H₂ 受體阻斷劑之減少，以 omeprazole 治療會減少胃內酸度，因此造成胃泌素隨著酸度的減少而成比例的增加。胃泌素的增加是可逆的。在長期治療期間，胃腺囊腫的發生頻率可能會增加。這些變化為生理性變化和抑制胃酸分泌的結果，也是良性和可逆性的。

使用質子幫浦抑制劑或其他酸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，因此這種治療會使發生胃腸道感染的危險性略微增加，例如沙門桿菌 (*Salmonella*) 和彎曲桿菌 (*Campylobacter*)。所有觀察到之藥效學作用，均可用 omeprazole 抑制胃酸分泌之作用來解釋。對酸分泌之抑制，與 omeprazole 血漿濃度及時間所形成之曲線下面積 (AUC) 有相關性；但與給藥後真正之血漿濃度卻無相關。靜脈給予 Losec 40mg 之後，胃酸之分泌立即減少。靜脈注射 40mg 之單一劑量對胃液酸度 24 小時的效果，大約與口服 80mg 之單一劑量或口服 20mg 每天一次重複給藥相同。

【藥動學性質】

吸收：

Omeprazole 與蛋白質之結合率約為 95%，分佈體積為 0.3 L/kg。

代謝：

Omeprazole 完全由肝臟代謝，其代謝主要由 CYP2C19 及 CYP3A4 酵素催化。確認的代謝產物為 sulphone、sulphide 及 hydroxy-omeprazole，這些代謝物對胃酸之分泌並無顯著影響。其血漿總清除率為 0.3-0.6 L/min。

排除：

多次給藥後，omeprazole 的排除期血漿半衰期約為 40 分鐘 (30-90 分鐘)。約有 80% 以代謝物之形式排於尿中，其餘則於糞便中排除。

患者因子：

肝功能不良之患者，omeprazole 的清除率會大幅降低。

【賦形劑】

活性成分小藥瓶：適量之氫氧化鈉用來調整酸鹼度。注射溶劑安瓿：聚乙烯乙二醇 (400) 4 g、檸檬酸單水合物 5mg、以注射用水加至 10 mL。

【不相容性】

依照建議之調配指示下，無已知之不相容性。

【儲架期】

請參閱外盒之有效期限。

【包裝】

請參閱外盒。

【儲存時注意事項】

儲存勿超過 25℃，並存放於外盒包裝內。對光敏感。一旦小藥瓶從外盒包裝取出後，可在室內正常燈光下保存 24 小時。

【使用與處理指示】

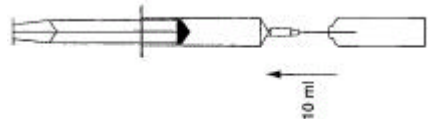
以所附之溶劑加入小藥瓶溶解凍晶粉末，調配成靜脈注射溶液。不可以使用其他溶劑。

調配好的注射液應在 4 小時內使用。

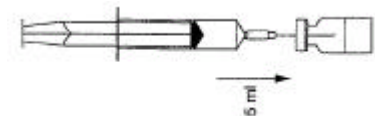
調配

注意：步驟 1-5 應盡快依序完成。

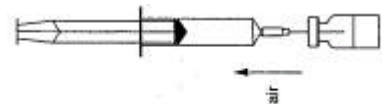
1. 以針筒自安瓿抽出 10 ml 之溶劑。



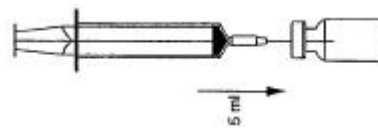
2. 緩慢地將 5ml 左右之溶劑，加入含有 omeprazole 凍晶粉末之小藥瓶中。



3. 儘可能地將小藥瓶中之空氣回抽至針筒，以降低小藥瓶中之壓力。如此才能使剩餘之溶劑易於加入小藥瓶中。



4. 將剩餘之溶劑加入小藥瓶中，確定針筒中無殘留之溶劑。



5. 將小藥瓶充分搖晃，以確保 omeprazole 與溶劑能適當地混合。



6. 調配好之靜脈注射溶液應保存於 25℃ 以下，且應於調配後 4 小時內使用。

【修訂日期】

2008 年 5 月

製造廠：AstraZeneca AB

廠址：S-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)2378-2390

GI.000-042-947.5.0