

樂酸克膠囊 20 公絲

LOSEC® 20mg Capsules
Omeprazole

衛署藥輸字第 017808 號

【組成】

每一膠囊含有 omeprazole 20mg。

賦形劑成分請參閱【賦形劑】

【劑型】

Losec 20mg 之膠囊：為不透明粉紅色之硬膠囊，膠囊體印有 20 之字樣，膠囊蓋上印有 A/OM 之字樣。每一膠囊含有 omeprazole 20mg，其由腸衣包膜之小藥球（enteric coated pellets）組成。

【適應症】

十二指腸潰瘍、胃潰瘍、逆流性食道炎、Zollinger-Ellison 症候群、合併抗生素治療與幽門螺旋桿菌(*Helicobacter pylori*)相關的消化性潰瘍。

【用法用量】

本藥須由醫師處方使用。

Losec 膠囊建議應於早晨以半杯水整粒吞服，不可嚼破或壓碎本膠囊。

吞膠囊有困難之患者及可以服用或吞服半固體食物之兒童

可打開膠囊直接以半杯水吞下其內容物，或將其混合於微酸性之液體(如果汁、蘋果醬或非碳酸類的水中)後服用。此種混合之分散液應立即(或於 30 分鐘內)服用。每次飲用前應適當的攪拌。再將半杯水加入杯中沖洗並喝下。

另外有些病人能吸入膠囊內之小藥球並以半杯水吞下；服用本藥時不可咬嚼腸衣包膜之小藥球。

【十二指腸潰瘍】

對患有活動性十二指腸潰瘍之病人建議劑量為 Losec 20 mg，每天一次。症狀可迅速緩解，且大多數患者會在 2 週內痊癒。在初期療程未復原者，通常會在繼續治療之 2 週中痊癒。對反應不佳之十二指腸潰瘍病人，建議劑量為 Losec 40 mg，每天一次。通常會在 4 週內獲得痊癒。預防病人之十二指腸潰瘍復發，建議劑量為 Losec 10 mg，每天一次。需要時其劑量可增加為 Losec 20-40 mg，每天一次。

【胃潰瘍】

建議劑量為 Losec 20 mg，每天一次。症狀可迅速緩解，且大多數患者會在 4 週內痊癒。在初期療程未復原者，通常會在繼續治療之 4 週中痊癒。對反應不佳之胃潰瘍病人，建議劑量為 Losec 40 mg，每天一次。通常會在 8 週內獲得痊癒。預防反應不佳之胃潰瘍病人復發，建議劑量為 Losec 20 mg，每天一次。需要時其劑量可增加為 Losec 40 mg，每天一次。

【消化性潰瘍疾病幽門螺旋桿菌(*Helicobacter pylori*, Hp)之根除療法】

三藥合併療法：

Losec 20 mg, amoxicillin 1 g 及 clarithromycin 500 mg 均每天 2 次，給藥 1 週；
或 Losec 20 mg, metronidazole 400 mg (或 tinidazole 500 mg) 及 clarithromycin 250 mg 均每天 2 次，給藥 1 週；
或 Losec 40 mg 每天 1 次，amoxicillin 500 mg, metronidazole 400 mg 則均每天 3 次，給藥 1 週。

二藥合併療法：

Losec 每天 40-80 mg, amoxicillin 每天 1.5 g 分數次給藥，為期 2 週；在臨床研究中 amoxicillin 曾使用之劑量為 1.5-3 g；或 Losec 40 mg 每天 1 次，clarithromycin 500 mg 每天 3 次，給藥 2 週。
為確定病人活動性消化性潰瘍之痊癒，請參考更進一步針對十二指腸、胃潰瘍之建議劑量。
假如病患在以上療法中仍呈現幽門螺旋桿菌陽性，需重複療程。

【逆流性食道炎】

建議劑量為 Losec 20 mg，每天一次，症狀可迅速緩解，且大多數患者會在 4 週內痊癒。在初期療程未復原者，通常會在繼續治療之 4 週中痊癒。對嚴重逆流性食道炎之病人，建議劑量為 Losec 40 mg，每天一次。通常會在 8 週內獲得痊癒。
對逆流性食道炎已痊癒病人之長期處理，建議劑量為 Losec 10 mg，每天一次。需要時其劑量可增加為 Losec 20-40 mg，每天一次。

【Zollinger-Ellison 症候群】

治療 Zollinger-Ellison 症候群之劑量需依個人來調整，且只要臨床上需要，就持續治療下去。建議劑量為每天 Losec 60 mg。所有病情嚴重及對其他治療反應不佳之病人均可有效控制，且超過 90% 之病人以 Losec 每天 20-120 mg，為其維持劑量。當 Losec 每天之劑量超過 80 mg 時，宜分為每天 2 次服用。

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：肝功能不良之患者因 omeprazole 之生體可用率及血漿半衰期均增加，以 Losec 每天劑量 10-20 mg 可能即已足夠。

老年病患：老年病患並不須調整劑量。

【警語及注意事項】

過去病歷中，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。

當確認或懷疑有胃潰瘍時，或出現下列一個或多個警告症狀：如體重無故地顯著減輕、反覆嘔吐、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。Losec MUPS 不會造成胃腸蠕動性失調。

經由內視鏡檢測確認之食道炎患者，長期服用 omeprazole 10mg 治療後，症狀緩解的頻率比服用 20mg 來的低，因此以 10mg 每日一次治療的患者每兩一段固定時間需進行內視鏡檢測。

由觀察研究發現，PPI 類藥品高劑量或長時間使用時，可能會增加腎部、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。

【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】)。

【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 MUPS 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} 均減少 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 蛋白酶抑制劑、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。

【對駕駛或操作機器能力之影響】

Losec 不太可能影響駕駛或操作機器的能力。

【不良反應】

在 omeprazole 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】

成人給予 320-800mg 劑量會導致低程度之急性毒性，給予高達 560mg 劑量會導致中度中毒。

症狀：頭暈、神情呆滯、頭痛、精神混亂、血管擴張、心悸過速、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。

【藥理學性質】

藥效學性質

ATC Code: A02B C01

減少胃酸分泌之物質-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 受體阻斷劑之治療，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。

口服給予 Losec 20mg 後，2 小時內會減少胃酸分泌。重複每天給藥一次，在治療 3 至 5 天內達到最大療效。十二指腸潰瘍病患服藥後，其胃內酸度在給藥後 24 小時期間，平均可減少 80% 以上；以胃泌素刺激後之胃酸產量，在給藥後 24 小時期間，減少 70% 左右。

抑制胃酸分泌的作用屬長效性，且持續到結束治療大約 5 天後才會消失。

初次劑量後每天服用一膠囊(20mg)時，可達症狀緩解之效用，且大多數十二指腸潰瘍病患可於 2 週內治癒，而胃潰瘍及逆流性食道炎之患者於 4 週內得以治癒。

使用 omeprazole 會增加某些抗生素對於幽門螺旋桿菌 (*Helicobacter pylori*) 的抗菌效果。

藥動學性質

吸收：

Omeprazole 通常於 3 至 6 小時內在小腸被完全吸收。重覆每日一次給予 omeprazole 後，其生體可用率大約為 60%。食物的攝取並不影響其生體可用率。

Omeprazole 與血漿蛋白之結合率約為 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。

Omeprazole 會抑制本身 CYP2C19 進行催化代謝，因此多劑量給藥情況下，omeprazole 的生體可用率相較於單劑量給藥而言會增加約 50%。

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：

老人或腎功能不全之患者，omeprazole 的生體可用率無顯著改變。而肝功能不良之患者，其生體可用率會增加，且 omeprazole 的清除率會大幅降低。

【賦形劑】

磷酸氫二鈉二水合物、羥丙基纖維素、羥丙基甲基纖維素、無水乳糖、硬脂酸鎂、己六醇、甲基丙基酸異分子聚合物、微晶狀纖維素、macrogol (聚乙炔乙二醇)、月桂硫酸鈉、碘化鐵 (E172)、二氧化鈦 (E171) 及白明膠。

【配伍禁忌】

在遵循給藥方法之指示下，目前無已知之配伍禁忌。

【儲架期】

請參閱外盒之有效期限。

【貯存時注意事項】

貯存於低於 30°C 處。使用後請將瓶蓋蓋緊。

【保存期限】

請見外盒

【包裝】

請見外盒

【修訂日期】

2011 年 6 月

製造廠：AstraZeneca AB

廠址：S-151 85 Södertälje Sweden

藥商：臺灣阿斯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.000-051-725.7.0