

# 命得生注射劑

## Medason for Injection

※本藥限由醫師使用  
衛署藥製字第 029085 號  
G.M.P.:G-0400

【組成】Each vial contains :

40mg: Methylprednisolone Sodium Succinate Buffered 3%.....	54.6 mg
(eq to Methylprednisolone.....	40 mg)
125mg: Methylprednisolone Sodium Succinate Buffered 3%.....	170.6 mg
(eq to Methylprednisolone.....	125 mg)
250mg: Methylprednisolone Sodium Succinate Buffered 3%.....	341.2 mg
(eq to Methylprednisolone.....	250 mg)
500mg: Methylprednisolone Sodium Succinate Buffered 3%.....	682.5 mg
(eq to Methylprednisolone.....	500 mg)
1g: Methylprednisolone Sodium Succinate Buffered 3%.....	1.365 g
(eq to Methylprednisolone.....	1 g)

【賦形劑】無

【性狀】

Methylprednisolone Sodium Succinate 之化學名為 pregn-1,4-diene-3,20-dione 21-(3-carboxy-1-oxo-propoxy)-11,17-dihydroxy-6-methyl-monosodium salt, (6α, 11β), 分子量為 496.53。其結構如下：



本藥可供靜脈或肌肉注射用。

【作用】依文獻刊載

天然生成的糖質固醇 (hydrocortisone 和 cortisone) 同樣也具有鹽滯留性質，作為腎上腺皮質機能不全患者的替代療法。他們的合成類似化合物，以其在許多器官性機能失調的抗發炎作用，為其主要的用途。

糖質固醇可引起廣泛且多樣化的代謝作用，此外，它們也可以矯正人體對不同刺激的免疫反應。

Methylprednisolone 是一種強力抗發炎類固醇。其抗發炎強度較 prednisolone 為大，且少有鈉與水貯留現象。

Methylprednisolone sodium succinate 的代謝和抗發炎作用和 methylprednisolone 相同。

等量注射此兩種藥品，可以獲得相同的生物效力 (biological activity)。為觀察 methylprednisolone 和 hydrocortisone 的作用強度關係，靜脈注射此兩種藥品，並以抑制嗜伊紅性白血球數目情形表示作用強度，發現其比例至少為四比一，若以口服投予時，其強度關係仍然相同。

【適應症】

腎上腺皮質機能不全，劇烈休克，支氣管性氣喘，膠原疾病，過敏反應，泛發性感染。

【說明】依文獻刊載

當口服療法不適用時，methylprednisolone sodium succinate 因其強度，劑型及投予方式適用於下列各疾病：

內分泌疾病

- 原發性或續發性腎上腺皮質素機能不全（可能的話，可與礦物皮質固醇併用）。
- 急性腎上腺皮質素不足（礦物皮質固醇的補充是必需的）。
- 腎上腺皮質機能不全 (adrenocortical insufficiency) 所致之續發性休克，或可能存在腎上腺皮質機能不全的病人，其對傳統療法無反應之休克。
- 對於已知患有腎上腺皮質機能不全或腎上腺皮質機能是否健全值得懷疑的病人在面臨手術前，嚴重創傷或重病等臨床狀況時。
- 先天性腎上腺肥大。
- 非化膿性甲狀腺炎。
- 癌症引起的血鈣過高。

風濕性疾病

(短期投藥作為輔助治療幫助病人渡過急性發作期或惡化期)

- 側傷後骨關節炎。
- 骨關節炎之滑膜炎。
- 類風濕性關節炎，包括幼年型類風濕性關節炎。
- 急性黏液囊炎，和亞急性黏液囊炎。
- 胸膜炎。
- 急性非特異性肌腱滑炎。
- 急性痛風性關節炎。
- 牛皮癬性關節炎。
- 關節黏連性脊椎炎。

膠原疾病及免疫複合體疾病

(用於惡化期或某些病例用於維持療法)

- 全身紅斑性狼瘡（及狼瘡性腎炎）。
- 急性風濕性心臟炎。
- 全身性皮肌炎（多肌炎）。

皮膚疾病

- 天疱瘡。
- 嚴重多形性紅斑 (Stevens-Johnson 症候群)。
- 脫皮性皮膚炎。
- 嚴重牛皮癬。
- 疱疹樣大庖皮膚炎。
- 嚴重脂漏性皮膚炎。
- 草狀類黴菌病 (mycosis fungoides)。

過敏狀態

(用於控制一般傳統療法難以處理的嚴重過敏疾病)

- 支氣性氣喘。
- 接觸性皮膚炎。
- 異位性皮膚炎。
- 血清病。
- 季節性或全年性過敏性鼻炎。
- 藥物過敏反應。
- 輸血所引起的蕁麻疹反應。
- 急性非感染性喉部水腫。

眼科疾病

(嚴重急性、慢性眼部過敏及發炎疾病)

- 眼部帶狀疱疹。
- 虹膜炎，虹膜睫狀體炎。
- 脈絡膜視網膜炎。
- 擴散性後葡萄膜炎及脈絡膜炎。
- 視神經炎。
- 交感神經性眼炎。
- 眼前部發炎。
- 過敏性結膜炎。
- 過敏性角膜邊緣潰瘍。
- 角膜炎。

腎腸道疾病

(幫助病人度過疾病關鍵期)

- 潰瘍性結腸炎 (ulcerative colitis)。
- 局部性腸炎 (regional enteritis)。

呼吸道疾病

- 症狀性類肉瘤病 (symptomatic sarcoidosis)。
- 鍍毒症 (deryliosis)。
- 急性惡化或散布型肺結核（與適當的抗結核療法同時使用）。
- 無法採取其他治療方式的 Loeffler 氏症候群。
- 吸入性肺炎。

血液疾病

• 後天性 (自體免疫性) 溶血性貧血。

- 成人之原發性血小板減少性紫斑。
- 成人續發性血小板減少。
- 紅血球母細胞減少 (紅血球性貧血)。
- 先天 (紅血球) 生成不良性貧血。

遺傳性疾病

(緩和療法)

- 成人白血病及淋巴瘤。
- 兒童急性和白血病。

水腫狀態

• 用於未出現尿毒症的腎病症候群可誘發利尿作用或緩解蛋白尿。

神經系統

- 多發性硬化症 (multiple sclerosis) 之急性惡化。

其它

- 結核性腦膜炎所造成之蜘蛛網膜下腔阻斷 (subarachnoid block) 或迫在性阻斷 (與適當抗結核藥物同時使用)。
- 侵犯神經或心肌方面的旋毛蟲病 (trichinosis)。

【用法用量】

當需要大劑量療法時，methylprednisolone sodium succinate 的推薦劑量是 30 mg/kg，靜脈注射以 10 至 20 分鐘施行。此劑量可於 48 小時內，每 4 至 6 小時重覆一次。

開始使用時，以一到數分鐘之時間，靜脈投予 methylprednisolone sodium succinate。一般使用高劑量類固醇時，務必等到病人情況穩定後才能停藥，通常不超過 48 至 72 小時。雖然短期間使用大量類固醇不常發生副作用，偶而也會發生胃潰瘍。因此，當配合抗酸藥作為預防療法。

至於其它適應症之第一次劑量可自 10 mg 至 40 mg，依據病情而決定之。當病情危急時，可於短時間使用較大劑量，初次劑量應於一至數分鐘內施行靜脈注射；第二次以後，可以按照病人之病情及反應給與靜脈或肌肉注射。類固醇只是一種輔助治療藥，不能用來取代傳統之療法。

嬰兒及兒童的劑量可以酌減輕，然應以患者病情的嚴重性及其反應，而非年齡大小和體重多寡為主要考慮方向。每 24 小時每公斤體重的用量不得低於 0.5 mg。使用數天後，應該停藥或逐漸減輕用量。慢性病病情減輕期間，須停用本藥。在長期治療期間應作定期之例行檢驗：例如尿液分析，飯後兩小時血糖測定 (two-hour post-prandial blood sugar) 血壓測量、體重、胸部 X 光。以往曾有潰瘍和明顯消化不良的病人，需做上消化道 X 光。

Methylprednisolone sodium succinate 注射劑，可以靜脈注射、肌肉注射、靜脈輸注等方法投藥，而於緊急狀況時以直接靜脈注射為佳。

靜脈 (或肌肉) 注射，請按照說明調配注射液，所需之劑量可以 60 秒之時間施行靜脈注射，隨後之劑量可以同法投予。必要時，可將注射用蒸餾水或適當溶劑加入小瓶中，配成稀釋液然後抽取所需劑量使用。

配製靜脈輸注溶液時，先按照說明調配注射液，然後加入定量之 5% 葡萄糖水溶液，等滲食鹽溶液，或是含有 5% 葡萄糖等滲食鹽溶液。

多發性硬化症：

治療急性惡化的多發性硬化症先以每天 200 mg prednisolone 投予一星期，再每 2 天 80 mg 用一個月；結果證明有效。(4 mg methylprednisolone 相當於 5 mg prednisolone)。

【禁忌】依文獻刊載

Methylprednisolone sodium succinate 禁用於：

- 患有全身性黴菌感染症的患者。
- 已知對 methylprednisolone sodium succinate 或配方中任一成份過敏的患者。
- 呼吸管內給藥。
- 硬脊膜外給藥。

正在使用免疫抑制劑量之皮質類固醇治療的患者禁止接種活性疫苗或活性減毒疫苗。

【使用特殊警語及特殊注意事項】依文獻刊載

免疫抑制效果 / 增加對感染之易感受性

皮質類固醇可能對增加對感染的易感受性，也可能會掩飾一些感染的症狀，且在用藥期間可能會發生新的感染。當使用皮質類固醇時，可能會減少抵抗力而無法將感染侷限於身體之局部部位。身體各部位所感染原體，包括：病毒、細菌、黴菌、原蟲、蠕蟲的感染，都可能跟單獨使用皮質類固醇或是併用其他的免疫抑制劑有關，而類固醇對免疫功能之影響可能及於細胞性、體液性免疫或是嗜中性白血球功能受到抑制。這些可能是輕微，但也可能會嚴重到甚至致命。當增加皮質類固醇的劑量時，感染併發症的發生率也隨之上升。

正在使用會抑制免疫系統之藥物治療的患者對感染的感受性要比身體健康者高。以水痘及麻疹為例，在因使用皮質類固醇治療而喪失免疫力的兒童或成人中，其病程可能會較為嚴重，甚至可能導致死亡。

活菌或是活菌經減毒處理的疫苗禁用在接受具免疫抑制作用劑量之皮質類固醇的病患。死菌或是去活化的疫苗則可投予在接具免疫抑制作用劑量之皮質類固醇的病患，然而病患對於疫苗的反應可能會減弱，但病人若是服用非免疫抑制劑量的皮質類固醇，則應可達到預期的接種效果。

皮質類固醇用於活動性結核病病例應僅限於急性惡化或散布性結核病，當用於此種病例時，皮質類固醇須與適當的抗結核治療法併用。

若皮質類固醇需用於患潛伏性結核或對皮膚結核菌素測驗有反應之病人時，因結核病可能再度活化，故需密切觀察。

在接受皮質類固醇治療的患者中曾有發生卡波西氏肉瘤的報告。

停用皮質類固醇或可減輕臨床症狀。

皮質類固醇在敗血性休克之治療中的角色一直都有爭議，早期的研究有會有利影響的報告，也有會產生不利影響的報告。

最近已證實，對確定發生敗血性休克且腎上腺功能不全的患者，使用皮質類固醇輔助治療可產生有利的影響。不過並不建議固定使用這類藥物治療敗血性休克。一項針對短期使用高劑量皮質類固醇進行的系統性分析並不支持使用這類藥物。不過，綜合性分析及一項回顧性研究顯示，以低劑量的皮質類固醇進行較長時間 (5-11 天) 的治療或可降低死亡率，尤其是升壓藥依賴性的敗血性休克患者的死亡率。

免疫系統影響

可能會發生過敏反應。因為接受皮質類固醇治療的病人有極少數會發生過敏性 / 類過敏性反應，因此建議在投藥前宜先採取適當的預防措施，特別是對於任何藥物有過敏病史的病人。

內分泌影響

接受皮質類固醇治療的患者如果遭遇異常壓力，可於壓力狀況發生之前、期間及之後增加速效型皮質類固醇的劑量。

長時間投予藥理劑量的皮質類固醇可能會導致下視丘—腦下垂體—腎上腺 (HPA) 的功能受到抑制 (續發性腎上腺皮質機能不全)。

患者發生腎上腺皮質機能不全的程度的持續時間並不盡相同，影的因素包括糖皮質素的劑量、投藥頻率、投藥時間、以及持續治療的時間。

此外，如果驟然停用糖皮質素，可能會發生急性腎上腺機能不全，並可能導致死亡。

因此，逐步降低劑量或可減輕藥物所引起的續發性腎上腺皮質機能不全。這種類型的相對功能不全現象在停止治療後可能會持續數月；因此，如果在這段期間發生任何壓力狀況，應重新開始使用荷爾蒙治療。

在驟然停用糖皮質素之後，可能也會發生一種似乎和腎上腺皮質機能不全無關的類固醇「戒斷症候群」。此症候群的症狀包括：厭食、噁心、嘔吐、嗜睡、頭痛、發燒、關節疼痛、皮膚脫屑、肌痛、體重減輕、以及 (或) 低血壓。這些影響一般認為乃是糖皮質素的濃度驟然改變所致，而非因為皮質類固醇的濃度過低。

由於糖皮質素會引發或加重庫興氏症候群，因此，應避免對庫興氏症患者使用糖皮質素。

對甲狀腺機能低下的患者，皮質類固醇會出現作用增強的現象。

代謝與營養

皮質類固醇，包括 methylprednisolone，會升高血糖，使既有的糖尿病更加惡化，長期使用皮質類固醇的患者也較容易發生糖尿病。

精神影響

的時間長短，因此必須針對個別病例進行風險／效益評估，藉以決定治療的劑量與持續時間，以及應採用每日給藥還是間歇給藥的治療方式。

應使用最低可能劑量的皮質類固醇來控制治療下的狀況，當可以降低劑量時，應採用逐步漸進的方式降低劑量。

**Aspirin** 非類固醇消炎劑併用皮質類固醇時應謹慎。

曾有報告提出，患者在使用全身性皮質類固醇後，出現可能致命的嗜鉻細胞瘤危象 (*pheochromocytoma crisis*)。疑似或確認罹患嗜鉻細胞瘤的患者，必須完成妥善的風險／效益評估後，才可使用皮質類固醇。

#### 兒童之使用

對長時間使用皮質類固醇治療的嬰兒與兒童，應仔細觀察其生長及發育的狀況。長期接受每天分次投予糖皮質素治療的兒童，可能會出現生長受到抑制的現象，因此，這種療法應限用於最緊急的適應症。

長時間使用皮質類固醇治療的嬰兒與兒童特別容易發生顱內壓升高的現象。

對兒童使用高劑量的皮質類固醇可能會引發胰臟炎。

#### 【藥物交互作用】依文獻刊載

**Methylprednisolone** 是細胞色素 P450 酶素 (CYP) 的作用受質，且主要是透過 CYP3A4 酶素的作用進行代謝。在成人的肝臟中，CYP3A4 乃是主要且數量最多的 CYP 亞型酶素。它會催化類固醇的 6 $\beta$ -羥化作用，對內生性與人工合成的皮質類固醇而言，這都是極為重要的第 1 階段代謝步驟。許多其它的化合物也是 CYP3A4 的作用受質，其中有些化合物（以及其他藥物）已證實會因誘導（向上調節）或抑制 CYP3A4 酶素的作用而改變糖皮質素的代謝。

CYP3A4 抑制劑 - 會抑制 CYP3A4 之活性的藥物通常都會降低 CYP3A4 受質藥物（如 methylprednisolone）的肝臟廓清率，並升高其血中濃度。在與 CYP3A4 抑制劑併用的情況下，可能須調整 methylprednisolone 的劑量，以免發生類固醇毒性。

CYP3A4 誘導劑 - 會誘導 CYP3A4 之活性的藥物通常都會提高 CYP3A4 受質藥物的肝臟廓清率，從而導致其血中濃度降低。併用時可能須提高 methylprednisolone 的劑量，才能達到期望的效果。

CYP3A4 受質 - 與另一種 CYP3A4 受質併用時，methylprednisolone 的肝臟廓清作用可能會受到影響，因此須採取相應的劑量調整措施。單獨使用其中一種藥物時曾伴隨發生的不良事件在合併使用時可能會更容易發生。

非 CYP3A4 相關的交互作用 - 使用 methylprednisolone 時可能會發生的其它交互作用與影響如以下的表 1 所示。

表 1 列出並說明了使用 methylprednisolone 時最為常見且（或）具臨床重要性的藥物交互作用或影響。

表 1. 使用 methylprednisolone 時的重要藥物或物質交互作用／影響

藥物類別或類型 - 藥物或物質	交互作用／影響
抗菌劑 - ISONIAZID	CYP3A4 抑制劑。此外，methylprednisolone 也可能會增加 isoniazid 的乙醯化速率與清除率。
抗生素、抗結核病藥物 - RIFAMPIN	CYP3A4 誘導劑
抗凝血劑（口服）	Methylprednisolone 對口服抗凝血劑的影響並不盡相同。有報告指出，與皮質類固醇同時投予時，抗凝血劑的作用會增強，也有報告指出其作用會減弱。因此，應監測凝血指標，以維持期望的抗凝血效果。
抗痙攣藥物 - CARBAMAZEPINE	CYP3A4 誘導劑（及作用受質）
抗痙攣藥物 - PHENOBARBITAL - PHENYTOIN	CYP3A4 誘導劑
抗膽鹼藥物 - 神經肌肉阻斷劑	皮質類固醇可能會影響抗膽鹼藥物的作用。 1) 將高劑量的皮質類固醇與抗膽鹼藥物（如神經肌肉阻斷劑）併用時，曾有發生急性肌肉病變的報告。（其它資訊請參見“使用特殊警語及特殊注意事項”中的“肌肉骨骼影響”） 2) 在使用皮質類固醇的患者中，曾有對 pancuronium 與 vecuronium 之神經肌肉阻斷作用產生拮抗作用的報告。可能所有的競爭性神經肌肉阻斷劑都會發生這種交互作用。
抗膽鹼酯酶	類固醇可能減少抗膽鹼酯酶對於重症肌無力的療效
抗糖尿病藥物	由於皮質類固醇可能會升高血糖濃度，因此可能須調整抗糖尿病藥物的劑量。
止吐劑 - APREPITANT - FOSAPREPITANT	CYP3A4 抑制劑（及作用受質）
抗黴菌藥物 - ITRACONAZOLE - KETOCONAZOLE	CYP3A4 抑制劑（及作用受質）
抗病毒劑 - HIV-蛋白酶抑制劑	CYP3A4 抑制劑（及作用受質） 1) 蛋白酶抑制劑，如 indinavir 與 ritonavir，可能會升高皮質類固醇的血中濃度。 2) 皮質類固醇可能誘導 HIV 蛋白酶抑制劑代謝，造成其血漿濃度降低。
芳香環轉化酶抑制劑 - AMINOGLUTETHIMIDE	Aminoglutethimide 所引發的腎上腺抑制作用可能會加劇長時間使用糖皮質素治療所造成的內分泌變化。
鈣離子通道阻斷劑 - DILTIAZEM	CYP3A4 抑制劑（及作用受質）
避孕藥（口服） - ETHINYLESTRADIOL / NORETHINDRONE	CYP3A4 抑制劑（及作用受質）
葡萄柚汁	CYP3A4 抑制劑
免疫抑制劑 - CYCLOSPORINE	CYP3A4 抑制劑（及作用受質） 1) 同時使用 methylprednisolone 與 cyclosporine 可能會發生相互抑制代謝作用的反應，這可能會升高其中一種藥物或兩種藥物的血中濃度。因此，單獨使用其中一種藥物時曾伴隨發生的不良事件在合併使用時可能會更容易發生。 2) 同時使用 methylprednisolone 與 cyclosporine 曾有發生痙攣反應的報告。
免疫抑制劑 - CYCLOPHOSPHAMIDE - TACROLIMUS	CYP3A4 作用受質
巨環類抗菌劑 - CLARITHROMYCIN - ERYTHROMYCIN	CYP3A4 抑制劑（及作用受質）
巨環類抗菌劑 - TROLEANDOMYCIN	CYP3A4 抑制劑
NSAIDs (非類固醇抗發炎藥) - 高劑量阿斯匹靈 (acetylsalicylic acid)	1) 將皮質類固醇與 NSAIDs 併用時，胃腸道出血及潰瘍的發生率可能會升高。 2) Methylprednisolone 可能會升高高劑量阿斯匹靈的清除率，可造成水楊酸的血清濃度降低。一旦停用 methylprednisolone 治療，可造成水楊酸的血清濃度增加，提高水楊酸中毒的風險。
排鉀藥物	將皮質類固醇與排鉀藥物（如利尿劑）合併投予時，應嚴密觀察患者是否出現低血鉀的現象。將皮質類固醇與 amphotericin B、 $\beta$ 2 或 xanthenes 作用劑併用時，發生低血鉀現象的風險也會升高。

#### 不相容

為避免發生相容性與安定性方面的問題，建議將 methylprednisolone sodium succinate 和其它透過 IV 途徑投予的藥物分開給藥。在溶液中會與 methylprednisolone sodium succinate 呈物理學不相容狀態的藥物包括但不侷限於：allopurinol sodium、doxapram hydrochloride、tigecycline、diltiazem hydrochloride、calcium gluconate、vecuronium bromide、rocuronium bromide、cisatracurium besylate、glycopyrrolate、propofol。（其它相關資訊請參見“不相容性”）

#### 【生育力、懷孕及哺乳】

皮質類固醇已在動物試驗中證實會損害生育力。（請參閱“臨床前安全性資料”）。

在一些病患，類固醇可能造成精子的活動力和數量增加或減少。

動物研究指出當投予母體高劑量皮質類固醇時，可能導致胎兒畸形。然而，並無研究顯示皮質類固醇對於孕婦投予會造成胎兒先天性畸形。然而，在人類的研究並未排除胎兒傷害的可能性，故 methylprednisolone sodium succinate 藥物用於孕婦應只限於明確需要時才投予。

有些皮質類固醇會快速通過胎盤。一項追溯性研究發現，在接受皮質類固醇治療之母親所生下的嬰兒中，低出生體重的發生率有升高的現象。懷孕過程中，接受相當劑量皮質類固醇療法的孕婦，胎兒出生後必須小心觀察評估，是否出現腎上腺皮質機能不全的徵象，雖然孕婦子宮中的胎兒暴露於皮質類固醇的治療下少有新生兒腎上腺功能不全的情況發生。目前對於胎兒在母親分娩及生產過程中接受皮質類固醇的影響是未知的。

在懷孕期間長期使用皮質類固醇治療之母親所生下的嬰兒中，曾觀察到白內障的現象。

哺乳

皮質類固醇會於乳汁中分泌。

分佈在乳汁中的皮質類固醇可能會使餵哺母乳之嬰兒的生長受到抑制，並會干擾內生性糖皮質素的生成。由於目前尚未對人類以糖皮質素進行過適當的生殖研究，因此，在考量對授乳婦的治療效益下，須在停止授乳或停止用藥間做一選擇。

【駕駛或操作機械能力之影響】

皮質類固醇對於駕駛或操作機械能力之影響尚未進行有系統之

評估。使用皮質類固醇治療後可能會發生不良的影響，如頭昏、眩暈、視覺障礙及疲倦。如果發生這些影響，患者不可開車或操作機械。

#### 【副作用】

使用禁用的椎管內／硬脊膜外給藥，有下列不良反應的報告：蜘蛛膜炎、功能性胃腸道疾病／膀胱功能異常、頭痛、腦膜炎、輕癱／偏癱、抽搐、感覺障礙。這些不良反應的發生頻率，目前並不清楚。

#### 表 2. 副作用列表

系統器官類別 (MedDRA 16.0 版)	頻率未知 (無法依據現有資訊推估)
感染及寄生	伺機性感染、感染
血液及淋巴系統失調	白血球增多
免疫系統方面	藥物過敏（包括類過敏性反應或過敏性反應）
內分泌失調	類庫興氏症候群、腦下垂體功能低下、類固醇戒斷症候群
代謝及營養失調	脂肪增生、鈉滯留、體液滯留、低血鉀性鹼中毒、血脂異常、葡萄糖耐受不良、糖尿病病人對胰島素（或口服降血糖劑）的需要量增加、負氮平衡（肇因於蛋白質分解）、血中尿素升高、食慾增加（可能導致體重增加）
精神失常	情感疾患（包括憂鬱情緒、欣快情緒、情緒不穩定、藥物依賴性、自殺想法）精神疾患（包括狂躁、妄想、幻覺、精神分裂症）、心理異常、人格改變、意識混亂狀態、焦慮、情緒波動、行為異常、失眠、易怒
神經系統方面	硬脊膜脂肪過多症、顱內壓增高（合併視神經乳頭水腫 [良性顱內高壓]）、痙攣、健忘、認知功能失調、頭昏、頭痛
眼睛方面	中心漿液性脈絡膜視網膜病變、白內障、青光眼、眼球凸出
耳朵及內耳疾患	眩晕
心臟方面	鬱血性心臟衰竭（感受性高的病人）、心律不整
血管方面	血栓、高血壓、低血壓
呼吸、胸腔及縱隔方面	肺栓塞、打嗝
胃腸道方面	胃潰瘍（可能伴有胃潰瘍性穿孔及胃潰瘍性出血）、腸道穿孔、胃出血、胰臟炎、腹膜炎、潰瘍性食道炎、食道炎、腹脹、腹痛、腹瀉、消化不良、噁心
肝臟方面	肝炎†
皮膚及皮下組織方面	血管性水腫、周邊水腫、多毛症、皮膚點狀出血（petechiae）、瘀斑、皮膚萎縮、紅斑、多汗、皮膚條紋、皮疹、搔癢、蕁麻疹、座瘡、皮膚色素不足
骨骼肌及結締組織方面	肌肉無力、肌痛、肌肉病變、肌肉萎縮、骨質疏鬆症、骨壞死、病理性骨折、神經源性關節病變、關節痛、生長遲滯
生殖系統及乳房方面	月經不規則
一般副作用及給藥部位情形	癒合不良、疲倦、不適、注射部位反應
臨床研究	尿鈣升高、血鉀降低、碳水化合物耐受性降低、眼內壓增加、丙胺酸轉胺酶升高、天冬氨酸轉胺酶增加、皮膚測試的反應受抑制
創傷、中毒及手術併發症	脊椎壓迫性骨折、肌腱裂傷

\*非 MedDRA 常用詞彙。

† 靜脈投藥曾有肝炎的報告（見“使用特殊警語及特殊注意事項”）。

#### 【藥物過量】

皮質類固醇無急性藥物過量臨床症候群。皮質類固醇使用過量後發生急性毒性反應及／或死亡的報告極為罕見。如果使用過量，並無特定的解毒劑；應採取支持性與症狀性的處置措施。Methylprednisolone 可以經由透析排除。

#### 【藥理學性質】

##### 藥效藥劑學特性

Methylprednisolone 是具強效抗發炎的類固醇。其抗發炎效力比 prednisolone 強，而引發鈉水滯留的能力則傾向比 prednisolone 小。

Methylprednisolone sodium succinate 與 hydrocortisone sodium succinate 有相同的代謝及抗發炎作用，當注射投予相等莫耳數的兩成分時，在生理活性上是相等的。在靜脈注射給藥後，可依嗜酸性球數量的減少得知 methylprednisolone sodium succinate 與 hydrocortisone 的相對強度至少是 4 比 1。此強度比例關係在兩種成分的口服劑型上，也是非常一致的。

##### 藥物動力學特性

Methylprednisolone 的藥物動力學呈線性分佈，且不受投藥途徑的影響。

##### 吸收：

在 14 個成年健康男性的自願受試者中，以肌肉注射藥物 methylprednisolone sodium succinate 40 毫克的劑量，在 1 小時可達到平均最高濃度為 454 ng/mL。在第 12 小時，methylprednisolone 的血漿中濃度已下降至 31.9 ng/mL。在給藥後 18 小時，就無法偵測 methylprednisolone 的濃度。依照血漿水平一時間下面積觀察藥物完整的吸收情形，發現該藥在同劑量下，以肌肉注射及靜脈注射方式有相同的吸收。

研究結果證實，不論何種路徑投予 methylprednisolone sodium succinate 皆可以快速且大量轉換成具活性的 methylprednisolone。以靜脈注射及肌肉注射投予其自由態的 methylprednisolone，其吸收程度是相等的，且明顯大於口服溶液或是口服錠劑的投藥途徑。該藥無論是靜脈注射後多數以 hemisuccinate 到達全身循環，或是肌肉注射後隨即把組織中酯類轉換成自由態的 methylprednisolone 而吸收，其靜脈注射及肌肉注射投予的吸收程度是相等的。

##### 分佈：

Methylprednisolone 會廣泛分佈進入身體組織、通過血腦障礙、並且會分泌至乳汁。其擬似分佈體積約為 1.4 公升／公斤，methylprednisolone 在人體內的血漿蛋白結合率約為 77%。

##### 代謝：

在人體內，methylprednisolone 會在肝臟代謝成不具活性的代謝物；主要的代謝物為 20 $\alpha$ -hydroxymethylprednisolone 與 20 $\beta$ -hydroxymethylprednisolone。肝臟中的代謝主要是透過 CYP3A4 的作用。（關於因 CYP3A4 所媒介之代謝作用而發生的藥物交互作用，請參見“藥物交互作用”段落中的說明）

和許多 CYP3A4 受質一樣，methylprednisolone 可能也是 ATP 結合匣 (ATP-binding cassette ; ABC) 運輸蛋白 p-糖蛋白的作用受質，因此可能也會影響其它藥物的組織分佈，並發生交互作用。

##### 排泄：

Methylprednisolone 的平均排除半衰期在 1.8 至 5.2 小時的範圍內。其全身清除率約為 5 至 6 毫升／分鐘／公斤。

#### 臨床前的安全性資料

安全性藥理學以及重複給藥毒性的傳統研究中，並未發現任何非預期的危害。在重複給藥研究中所觀察到的毒性反應和持續投予腎上腺皮質類固醇時預期會發生的毒性反應相同。

##### 致癌性：

目前尚未進行過評估致癌性的長期動物研究。

##### 致突變性：

在有限的細菌與哺乳類細胞試驗中，並無任何證據顯示可能會發生遺傳突變及染色體突變。

##### 生殖毒性：

施用於大鼠時已證實