



耐適恩錠 40 公絲

NEXIUM TABLETS 40MG

衛署藥輸字 第 023221 號

須由醫師處方使用

版本日期 2023-01-13

1 性狀

1.1 有效成分及含量

各藥錠含有20 mg或40 mg的esomeprazole (以magnesium trihydrate化合物形式存在)。

1.2 賦形劑

單硬脂酸甘油酯 40-55、羥丙基纖維素 (hyprolose)、羥丙基甲基纖維素、氧化鐵(20mg & 40mg錠劑：紅-棕色，20mg錠劑：黃色) [E172]、硬脂酸鎂、甲基丙基酸異分子聚合物(1：1)、微晶狀纖維素、合成石蠟、聚乙炔乙二醇、聚山梨酸醇80、聚乙烯基吡咯啶酮交叉連結、硬脂酸鈉延胡索酸鹽、糖質圓顆粒(蔗糖與玉米澱粉)、滑石粉、二氧化鈦[171]、三乙基檸檬酸鹽。

1.3 劑型

20 mg或40 mg皆為膜衣錠

1.4 藥品外觀

耐胃酸錠：

20 mg：為淡粉紅色、橢圓形、兩面凸出之膜衣錠，一面刻劃 A E H，另一面刻有20 mg之字樣。

40 mg：為粉紅色、橢圓形、兩面凸出之膜衣錠，一面刻劃 A E I，另一面刻有40 mg之字樣。

2 適應症

胃食道逆流性疾病

- 糜爛性逆流性食道炎之治療。
- 胃食道逆流性疾病之症狀治療。

與適當之抗菌劑療法併用，以根除幽門螺旋桿菌 (*Helicobacter pylori*)，及治療由幽門螺旋桿菌 (*Helicobacter pylori*) 引發之十二指腸潰瘍。

需要持續使用非類固醇抗發炎藥(NSAID)之病人。

- NSAID治療相關之胃潰瘍的治療

預防消化性潰瘍再出血之治療。

Zollinger Ellison Syndrome (ZES)之治療。

3 用法及用量

3.1 用法用量

本藥須由醫師處方使用。

本錠劑應整粒以液體吞服，不可嚼破或壓破本錠劑。

對於有吞嚥困難的病人，可將藥錠置入半杯非碳酸類的水中，且不可使用他種液體，因為藥錠的腸衣膜可能因此溶解。同時攪拌直到藥錠崩散，並立即或在30分鐘之內將水連同小藥球喝下。再

將半杯水加入杯中沖洗並喝下，小藥球不可咬碎或壓碎。

對於無法吞嚥的病人，本錠劑可用非碳酸飲料沖泡，並且經由胃管給藥。重要的是要小心測試選用之注射器和胃管的適當性。製備與使用說明請參閱【調製方式】。

成人及12歲以上之青少年

胃逆流性食道疾病(GERD)

- 糜爛性逆流性食道炎之治療：40 mg每天1次，為期4週。對食道炎尚未痊癒或尚有症狀之病人，建議另外再給予4週療程。
- 胃食道逆流性疾病之症狀治療：對食道未發炎之病人20 mg每天1次；若4週後仍有症狀時，則應進一步檢查病人。一旦症狀獲得緩解後，可以每天1次20 mg之療法來做後續的症狀控制。就成人而言，如需要時，可以給予20 mg每天1次之療法。對於使用非類固醇抗發炎藥(NSAID)治療而有誘發胃潰瘍和十二指腸潰瘍危險之病人，不建議以有需要時才服藥的方式作為後續的症狀控制。

成人

與適當之抗菌劑療法併用，以根除幽門螺旋桿菌 (*Helicobacter pylori*)，以及治療由幽門螺旋桿菌 (*Helicobacter pylori*) 引發之十二指腸潰瘍：20 mg Nexium + 1 g amoxicillin + 500 mg clarithromycin；每天2次，共計7天。

預防消化性潰瘍再出血之治療，40 mg每天1次，為期4週。

需要持續使用非類固醇抗發炎藥(NSAID)之病人

- NSAID治療相關之胃潰瘍的治療：一般劑量為20 mg每天1次，為期4-8週。

Zollinger Ellison Syndrome (ZES)之治療

建議起始劑量為服用Nexium 40mg每日2次，然後再依個別情況調整劑量，並視臨床表徵決定是否需繼續治療。根據臨床試驗結果所示，每日服用80至160mg esomeprazole，大部分病人之病情可獲得控制。如每日服用劑量達80mg以上，需分為每日2次給藥。

3.2 調製方式

經胃管給藥

- 1.把本錠劑放在適當的注射器中，注入水約25 mL及空氣約5 mL。有些胃管需要用50 mL水沖泡，以免小藥粒堵塞胃管。
- 2.立即振搖注射器約2分鐘，以使藥錠崩散。
- 3.將注射器的尖端朝上，以檢查尖端未被堵塞。
- 4.保持上述位置，把注射器接上胃管。
- 5.振搖注射器，並將其尖端朝下，立即注入5-10 mL至胃管，然後倒轉注射器並振搖之（注射器的尖端必須朝上，以免尖端堵塞）。
- 6.將注射器的尖端朝下，再立即注入5-10 mL至胃管。重複這個程序，直到注射器內溶液注入完畢。
- 7.若有需要，可在注射器內再注入水約25 mL及空氣約5 mL，重複步驟5以沖洗留在注射器內的沈澱物。有些胃管可能需要50 mL的水。

3.3 特殊族群用法用量

12歲以下之孩童

1至11歲孩童之用法用量請參閱「耐適恩懸浮用顆粒劑仿單」。

腎功能不良

腎功能不良之病人，並不須調整劑量。對腎臟功能嚴重不足之病人，因經驗有限，治療此類病人仍需特別謹慎。(請參閱【藥物動力學特性】)

肝功能不良

對肝功能輕度及中度不良之病人，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【藥物動力學特性】)

老年病人

老年病人並不須調整劑量。

4 禁忌

已知對esomeprazole、benzimidazole取代物或配方中其他成份有過敏反應之病人。
Esomeprazole不可與nelfinavir併用(請參閱【交互作用】)。

5 警語及注意事項

5.1 警語/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)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。病人在長期治療時(特別是治療時間超過一年)需接受規則的監測。

視需要治療的病人若有特別的症狀改變時，應與醫師聯繫。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【交互作用】)。

當esomeprazole用於根除幽門螺旋桿菌(*Helicobacter pylori*)時，應考慮與三合療法中所有組成成分間的藥物相互作用。Clarithromycin是CYP3A4的強效抑制物，因此三合療法使用於正在服用其他由CYP3A4代謝的藥物(例如cisapride)的病人時，應考慮clarithromycin的禁忌症及藥物相互作用。

本藥品含有蔗糖。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【藥效藥理特性】)。

不建議同時投予esomeprazole和atazanavir(參閱【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【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病人時，宜監控病人骨質狀況，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，包括手足抽搦、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。

5.3 操作機械能力

尚未發現有任何不良影響。

6 特殊族群注意事項

6.1 懷孕

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，其對胚胎/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，使用消旋混合物，對懷孕、生產及產後之發展，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。

6.2 哺乳

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。

7 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值影響的藥品

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，對老年病人使用高劑量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CYP2C19。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。

健康自願受試者併用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} 約減少75%)。即使將atazanavir 的劑量增加至400 mg仍無法補償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esomeprazole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，這是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，會使癲癇病人血中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 (40 mg 一天一次) 會使voriconazole (CYP2C19的受質) 的 C_{max} 和 AUC_T 分別增加15%及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 C_{max} 和AUC分別增加18%和26%，其中一個活性代謝物的 C_{max} 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的血漿濃度時間曲線下面積（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【警語及注意事項】）。

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治療的病人中比較安慰劑與omeprazole 20mg)和對大型前瞻性隨機臨床結果研究(超過47,000名病人)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esomeprazole藥動學之影響

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之曲線下面積(AUC)增加1倍；Esomeprazole與同時是CYP2C19抑制劑又是CYP3A4抑制劑的藥品併服時，如voriconazole，可能會使esomeprazole之暴露量增加一倍以上。CYP2C19及CYP3A4抑制劑voriconazole會使omeprazole AUC_T增加280%。在以上二種情況下通常無須調整esomeprazole之劑量。然而，對於肝功能嚴重不良的病人以及有長期治療需求時，應該考慮調整劑量。

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。

8 副作用/不良反應

8.1 臨床重要副作用/不良反應

在esomeprazole臨床試驗中，以及上市後，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 \geq 1/100 且 <1/10；少見 \geq 1/1000且 <1/100；罕見 \geq 1/10000 且 <1/1000；極罕見<1/10000；未知 (不能從現有的數據估計)。

血液及淋巴系統障礙

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。

免疫系統障礙

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)

代謝及營養障礙

少見：週邊水腫

罕見：低血鈉症

極罕見：低血鎂症，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

精神醫學方面障礙

少見：不眠症

罕見：不安、神智錯亂、沮喪

極罕見：侵略性、幻覺

神經系統障礙

常見：頭痛

少見：暈眩、感覺異常、困倦

罕見：味覺障礙

視覺障礙

罕見：視覺模糊

聽力及內耳迷路障礙

少見：眩暈

呼吸道、胸腔及縱隔障礙

罕見：支氣管痙攣

胃腸道障礙

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

肝膽障礙

少見：肝臟酵素增加

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

皮膚及皮下組織障礙

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、毒性表皮壞死症 (TEN)、急性廣泛性發疹性膿疱症(AGEP)、藥物反應伴隨嗜伊紅性白血球增加與全身症狀(DRESS)

肌肉骨骼、結締組織及骨頭障礙

罕見：關節痛、肌痛

極罕見：肌肉無力

腎臟及泌尿道障礙

極罕見：間質性腎炎

生殖系統及乳房障礙

極罕見：男性女乳症

一般障礙及投予部位狀況

罕見：倦怠、流汗增加

8.3 上市後經驗

上市後經驗：代謝和營養方面異常 - 低血鎂

9 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。

10 藥理特性

10.1 作用機轉

Esomeprazole為一弱鹼，其會在胃之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，其可抑制酸幫浦： H^+-K^+-ATP 酵素。其對基礎之胃酸分泌及刺激下之胃酸分泌，均有抑制效果。

10.2 藥效藥理特性

藥物治療分類：質子幫浦抑制劑

ATC Code：A02B C05

Esomeprazole為omeprazole之S型光學異構物，經由作用於專一性目標之作用機轉，降低胃酸分泌。其為位於胃壁細胞內之酸幫浦之專一性抑制劑。Omeprazole的R及S型光學異構物二者有相似的藥物效力活性。

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，所形成之曲線下面積(AUC)，來代替血漿濃度，已顯示其對胃酸分泌之抑制程度，與劑量之間有相關性。

抑制胃酸之療效

逆流性食道炎病人以esomeprazole 40 mg治療4週後，有78%之病人痊癒，治療8週後則有93%。

幽門螺旋桿菌病人以esomeprazole 20 mg每天2次，與適當之抗生素併用治療1週後，可根除90%病人之幽門螺旋桿菌。就無併發症之十二指腸潰瘍病人而言，在為期1週之根除治療之後，並無須以抗胃酸分泌藥物再治療，即可有效使潰瘍癒合及症狀緩解。

在一項隨機、雙盲、安慰劑對照臨床試驗中，經由內視鏡檢查確認消化性潰瘍出血，特徵為Forrest Ia、Ib、IIa或IIb (分別是9%、43%、38%及10%) 的病人隨機接受Nexium 靜脈點滴輸注射液(n=375)或安慰劑(n=389)治療。以內視鏡止血後，病人接受 esomeprazole 80 mg 靜脈輸注30分鐘，隨後esomeprazole 8 mg/h 或安慰劑持續靜脈點滴輸注72小時。在此起始72小時之後，所有的病人都接受開放性標示的口服 Nexium 40 mg，服用27天以抑制胃酸分泌。三天內發生再出血的比例Nexium治療組是5.9%，安慰劑組是10.3%。在治療後30天發生再出血的比例Nexium治療組是7.7%，安慰劑組是13.6%。

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)。

在二個以ranitidine為比較對象之研究，於治療有使用NSAID(包括具有COX-2選擇性之NSAID)之胃潰瘍病人，Nexium有較佳的癒合效果。

在兩個以安慰劑為比較對象之研究，對於使用NSAID(包括具有COX-2選擇性之NSAID)之病人(年齡超過60歲及/或以前有潰瘍)，Nexium有較佳的預防胃及十二指腸潰瘍的效果。

小兒族群

在一個以胃食道逆流性疾病的小兒病人(<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。

10.3 臨床前安全性資料

目前尚無資訊。

11 藥物動力學特性

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一劑量後為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

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。此類病人代謝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。

這些結果與esomeprazole的藥量學無關。

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。這些結果與esomeprazole的藥量學無關。

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病人進行研究。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病人身上，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歲之青少年其血漿濃度-時間曲線下面積(AUC)和藥物達最高血漿濃度所需時間(t_{max})在給予相同劑量下與成人相似。

112.01.13



目前尚無資訊。

13 包裝及儲存

13.1 包裝

請參閱外盒說明。

13.2 效期

請參閱外盒說明。

13.3 儲存條件

貯存於低於30°C處

存放於原包裝之內以避免潮濕。

15 其他

配伍禁忌

目前無已知之配伍禁忌。

製造廠：AstraZeneca AB

製造廠地址：SE-151 85 Sodertalje Sweden

藥商：臺灣阿斯特捷利康股份有限公司

地址：台北市大安區敦化南路二段207號21樓

電話：(02) 23782390

修訂日期：2022年10月

本註冊商標屬AstraZeneca集團之財產。

© AstraZeneca 2009 – 2022

製造廠

ASTRAZENECA AB

SE-151 85 SODERTALJE SWEDEN

藥商

臺灣阿斯特捷利康股份有限公司

台北市大安區敦化南路二段207號21樓