

論何種刺激) 均有抑制效果。

藥效學作用

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。

對胃酸分泌之作用

靜脈注射 omeprazole 在人體產生劑量依賴性胃酸分泌抑制作用。為了立即達到與重覆口服 20mg 類似的胃內酸度降低，建議第一劑靜脈注射 40mg。這樣造成胃內酸度立即下降，靜脈注射和靜脈輸注都在 24 小時期間，平均下降約 90%。

對胃酸分泌之抑制，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。

使用 omeprazole 治療期間未觀察到藥物減效現象(tachyphylaxis)。

對幽門螺旋桿菌(Helicobacter pylori)之影響

幽門螺旋桿菌與消化性潰瘍疾病有關，包括十二指腸潰瘍和胃潰瘍。幽門螺旋桿菌是罹患胃炎的主要因素。幽門螺旋桿菌連同胃酸是罹患消化性潰瘍病的主要因素。幽門螺旋桿菌是罹患萎縮性胃炎的一個主要因素，後者與罹患胃癌的風險增加有關。

用 omeprazole 和抗菌劑根除幽門螺旋桿菌，與消化性潰瘍的高癒合率和長期緩解有關。

其他與胃酸抑制作用有關的影響

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中胃泌素濃度的增加有關，此現象曾發生於長期接受 omeprazole 治療的兒童及成人身上。這樣的發現被認為不具臨床意義。

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。

使用任何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。減少胃酸分泌的藥物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)，在住院病人，可能還有困難梭狀芽孢桿菌 (Clostridium difficile)。

【藥動學性質】

分佈：
健康受試者的 omeprazole 擬似分佈體積約為 0.3 L/kg。Omeprazole 與血漿蛋白之結合率約為 97%。

代謝：

Omeprazole 完全由細胞色素 P450 系統(CYP)代謝，其代謝主要依賴以基因多型性表現的 CYP2C19，形成血漿中的主要代謝物 hydroxyomeprazole。其餘部分依賴另一個特定的同功酶 CYP3A4，形成 omeprazole sulfone。由於 omeprazole 對 CYP2C19 的親和力高，因此與其他 CYP2C19 受質可能有競爭性抑制作用和代謝性藥物交互作用；然而，由於對 CYP3A4 的親和力低，因此 omeprazole 不會抑制其他 CYP3A4 受質的代謝。此外，omeprazole 對主要的 CYP 酵素無抑制作用。

約有 3% 的白人和 15-20% 的亞洲人缺乏功能性 CYP2C19 酵素，他們被稱為緩慢代謝者；omeprazole 在這些人的代謝可能主要由 CYP3A4 催化。重覆每日一次給予 omeprazole 20mg 後，緩慢代謝者的平均 AUC 比有功能性 CYP2C19 酵素的受試者(廣泛代謝者)高出 5 至 10 倍。平均最高血漿濃度也較高，到 3 至 5 倍。這些發現對 omeprazole 的用量並無影響。

排除：

投予單一劑量後，總血漿清除率約 30-40 l/h。單次和重覆每日一次給藥後，omeprazole 的血漿排除半衰期通常不到 1 小時。在每日一次給藥期間，omeprazole 在兩次劑量之間完全從血漿中排除。約有 80% 以代謝物之形式排於尿中，其餘則於糞便中排除，主要來自膽汁分泌。

重覆給藥後，omeprazole 的 AUC 會增加，可能是由於 omeprazole 及其代謝物(如 sulphone)抑制 CYP2C19 酵素，而使全身清除率減少所致。

代謝物對胃酸分泌沒有影響。

特殊族群

肝功能不良之患者

Omeprazole 在肝功能不全患者的代謝減少，導致 AUC 增加。Omeprazole 每日服用一次並沒有任何蓄積傾向。

腎功能不全之患者

腎功能不全之患者，其 omeprazole 的藥動學(包括生體可用率和排除率)不變。

老人

老年受試者 (75-79 歲)，其 omeprazole 的代謝率有點減少。

【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：聚乙炔乙二醇 (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°C，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】

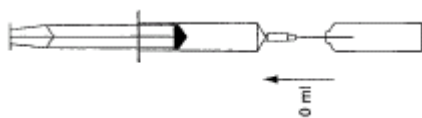
以所附之溶劑加入小藥瓶溶解凍晶粉末，調配成靜脈注射溶液。不可以使用其他溶劑。

調配好的注射液應在 4 小時內使用。

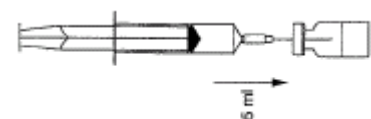
調配

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。



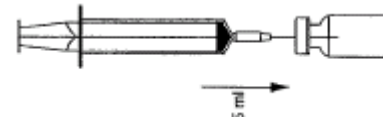
2. 緩慢地將 5ml 左右之溶劑，加入含有 omeprazole 凍晶粉末之小藥瓶中。



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°C 以下，且應於調配後 4 小時內使用。

【修訂日期】

2013 年 8 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.000-097-772.7.0

AstraZeneca