

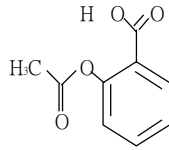
諾比林 腸溶膜衣錠 81 毫克

衛署藥製字第054863號

Lopirin Enteric-Coated Tablets 81mg

GMP G-10962

Aspirin的化學名為乙醯水楊酸 (acetylsalicylic acid, ASA) 構造式為



分子式: $C_9H_8O_4$

分子量: 180.16

成分：

諾比林腸溶膜衣錠每錠內含：

Aspirin..... 81 mg

臨床藥理學：(依文獻記載)

Aspirin具有鎮痛、解熱、抗炎及抗血栓形成等多方面的作用。

鎮痛、解熱及抗炎作用：Aspirin的鎮痛效果係經由周圍與中樞神經系統兩方面的作用而產生。周圍神經方面，Aspirin 抑制 prostaglandins 之合成與釋出；中樞神經方面，作用於 hypothalamic site 而產生效應。Aspirin作為抗炎劑與抗風濕劑的作用模式亦可能是經由對 prostaglandins 合成與釋出的抑制。Aspirin 亦因作用於 hypothalamus 而產生解熱效果，並藉血管擴張與增加周圍循環血流之結果而增加熱的發散。解熱效果亦可能與其抑制 prostaglandins 之合成與釋出有關。

血液學作用：每日服用 1.3~6g，Aspirin藉對 blood coagulation factors VII，IX and X肝臟合成的抑制而延長 prothrombin time 僅 2~3秒；但 Aspirin (其他水楊酸鹽則否)卻可藉 epinephrine或低濃度的 collagen 而抑制血小板凝集，其對血小板凝集第二期的抑制是在阻止 adenosine diphosphate (ADP) 由血小板釋出，同時也阻止 platelet factor 4 的釋出。這樣一來，平均出血時間在健康人就可延長數分鐘，而兒童或具有出血性疾病，如血友病的患者則更長。健康成人接受 325mg單一口服劑量的Aspirin、12小時以內出血時間增加至最高值，24小時內慢慢恢復正常。

在循環血小板與可能巨核細胞 (megakaryocytes) 中，Aspirin 不可逆地對 cyclooxygenase 行乙醯化而使之失去活性。這種去活化作用阻止了血小板中 prostaglandin endoperoxides 及 thromboxane A_2 的合成，這兩種物質都可導致血小板凝集與動脈平滑肌的收縮。因為 cyclooxygenase在血小板中不能再合成，所以 Aspirin的此一效應可持續至整個血小板的生命期 (4~7天)。通常未曾暴露於 Aspirin 的大約 20%的血小板 (約於最後一劑後的 36小時)可恢復其正常的止血功能。但在某些接受長期Aspirin治療的病人，曾報告另外的止血作用可持續至更久。

抗血栓作用：Aspirin 因能夠藉對血小板 cyclooxygenase 的抑制而抑制血小板的凝集，曾被廣泛地作過防止血栓形成，特別是動脈血栓形成。Aspirin也曾被發現可使靜脈內皮中的 cyclooxygenase去活化而抑制 prostacyclin，epoprostanol(PGI₂)的靜脈合成。Prostacyclin對止血作用顯示與 thromboxane A_2 、prostaglandin endoperoxides的作用相反；因此曾設想此等藥物質的形成被抑制可能會同時產生增加或減少血栓形成的兩種結果，究竟最後結果為何，視其相對強度而定。

在 Aspirin 防止血栓形成效果的一些臨床研究中，900 mg 與 1.5 g 的分次劑量即可抑制 prostacyclin 與 thromboxane A_2 的合成。雖然 Aspirin 對 prostacyclin 所產生的同時抑制有可能降低藥物的抗血栓效果，但此一效應並無增加血栓形成的危險性，因在此一研究中，或在接受較高劑量藥物的類風濕性關節炎的患者中，均未發現有這種危險性的增加。在血小板中以及靜脈內皮中的 cyclooxygenase 都可被 80~300 mg單一口服劑量的 Aspirin所抑制。但在此等劑量下血小板中 thromboxane A_2 合成的抑制期間 (約 48~96小時) 卻長於靜脈內皮中 prostacyclin 合成的抑制期間 (約 24~48小時)；因為在靜脈內皮中可進行 cyclooxygenase 的再合成，而在血小板中則否。因為在血小板中的 cyclooxygenase對去活化作用較在靜脈內皮中的 cyclooxygenase敏感，故設想低劑量的 Aspirin可藉選擇性地抑制 prostaglandin endoperoxides與 thromboxane A_2 的合成而防止血栓形成。

因為有許多研究結果顯示，Aspirin抗血栓形成的作用只限於男性，這可能與不同性別的激素因素，在血管壁及血小板中 cyclooxygenase 的抑制敏感性及 / 或血栓病理形成的血小板外因素有關。

藥物動力學：(依文獻記載)

諾比林腸溶膜衣錠進入中性—鹼性環境的十二指腸後始釋出 Aspirin，由上部小腸吸收。吸收後的 Aspirin在肝臟中很快水解成水楊酸 (salicylic acid)，水楊酸再與 glycine及 glucuronic acid結合，大部份經尿排出。因為水解迅速，所以在普通治療劑量下 Aspirin在血漿中的濃度約出現於口服後 2小時，但腸溶膜衣錠者則行延後。Aspirin血漿半衰期約為15分鐘。水楊酸鹽血漿濃度與臨床鎮痛效果之間的直接關係還未確切確定，但通常達到 15~30

mg /100ml時即可有效鎮痛。20~30mg/100ml血漿濃度時，即可產生有效的抗炎效果。水楊酸中毒症狀與其血漿濃度之間的關係亦缺乏確切的證據，但多數患者水楊酸鹽血漿濃度達35mg/100ml時，即將出現水楊酸鹽中毒的症狀。

水楊酸鹽主要由腎排出。在人類研究中顯示其主要的排出形式有游離水楊酸 (10%)、水楊尿酸 (75%)等數種代謝產物。

適應症：預防及治療男性心肌梗塞及中風。

用法用量：

每日 1~3 次，每次 1 錠；長期使用時由醫師酌量增減。

類別:本藥須由醫師處方使用。

禁忌：(依文獻記載)

對 Aspirin及/或其他非類固醇抗炎劑具過敏性的患者禁忌。最近曾有胃腸出血或有出血性疾病(如血友病)的患者勿用。
懷孕第3期。

副作用：(依文獻記載)

胃腸反應：可能出現食慾缺乏、胃腸不適、口渴、腹瀉、肝功能異常、胃腸出血或潰瘍。
血液學：出血時延長、白血球減少症、血小板減少症、紫斑、血漿鐵濃度降低以及紅血球存活時間縮短。
皮膚科與過敏性：蕁麻疹、血管神經性水腫、搔癢、多汗、各種皮疹、哮喘與過敏性休克。
神經學：心智混亂、昏睡、暈眩、耳鳴、頭痛、可逆性視覺喪失與視覺模糊。
全身症狀：心跳過速、發燒。

警語：(依文獻記載)

Aspirin在與抗凝血劑合併使用時應加注意，因其可降低血漿中凝血素原的濃度，並增加出血時間。
大劑量的水楊酸鹽具降血糖作用，可能加強降血糖劑的作用，故二者不宜同時併用；如果必須同時使用時，應減低降血糖劑的劑量。這種降血糖作用亦可影響糖尿病人對胰島素的需要量。
雖然大劑量水楊酸鹽為促尿酸排泄藥，但小劑量可能降低 probenecid、sulfipyrazone與 phenylbutazone等的尿酸排泄作用。
在未與醫師諮商前，本劑勿用於兒童及二十歲以下青少年之水痘或流行性感胃症狀之解除，因其可能與一種罕見而嚴重之疾病雷氏徵侯群(Reye's Syndrome)有相關性。如有對本劑過敏、哮喘、持續性或反覆發作的胃病病歷的患者，在未諮詢醫師之前不宜使用本劑。
服用後若有發疹、發紅、噁心、嘔吐、食慾不振、頭暈、耳鳴、喉嚨疼痛等症狀時，應停藥並就醫。
除非藥師、藥劑生或醫師指示，服用本劑時，不得併服其他藥品或服含酒精飲料。
蠶豆症 (6-磷酸葡萄糖脫氫酶缺乏 Glucose-6-phosphate Dehydrogenase Deficiency) 患者不得服用本劑。
除非藥師、藥劑生或醫師指示，3歲以下不得服用本劑。
除非藥師、藥劑生或醫師指示，曾有消化性潰瘍或使用抗凝血劑之患者不得服用本劑。曾經因藥物引起過敏症狀者，使用前必須請教藥師、藥劑生或醫師。
(1) 不得併服含酒精飲料，因可能造成胃出血。
(2) 本藥不宜使用於12歲以下兒童，亦不宜使用於18歲以下兒童及青少年之水痘或流行性感胃症狀之解除。因其可能與一種罕見而嚴重之疾病-雷氏症候群(Reye's Syndrome)有相關性。
(3) 蠶豆症(6-磷酸葡萄糖脫氫酶缺乏症，Glucose-6-Phosphate Dehydrogenase Deficiency) 患者，不宜服用本藥。

注意事項：(依文獻記載)

本劑必須整顆吞服不可壓碎。
本劑須置於小孩接觸不到之處。
除非藥師、藥劑生或醫師指示，孕婦及授乳婦不建議自行使用。
勿超過建議劑量，若有副作用產生，應立即停藥就醫。
在大劑量或長期 Aspirin 治療中可能出現輕度水楊酸中毒，這種情形可藉降低劑量消除之。
雖然諾比林腸溶膜衣錠所致大便潛出血之機率遠較未包腸衣者為低，但對具有胃不適、潰瘍或出血的患者，在使用本劑時仍應多加注意。對具有嚴重肝損傷、既有低凝血素原血症 (hypoprothrombinemia)、維生素K缺乏及進行外科手術的患者亦應慎用。
長期 Aspirin治療的患者，即使每天 300 mg，亦應定期測定血中脈氨及尿酸值，以了解其變化情形，因 Aspirin可能會稍稍增加該等物質的生化檢驗值。

包裝：2 ~ 1000錠鋁箔盒裝、塑膠瓶裝。

貯存：30℃ 以下室溫貯存。

製造廠：明德製藥股份有限公司
地 址：桃園縣楊梅鎮民富路二段360號

委託者：舜興企業有限公司
地 址：台北市復興北路333號10樓之3