

胃默適[®] 膜衣錠 5 毫克

Mozapryl[®] F.C. Tablets 5 mg

網號：E197

【成分】Each Tablet contains：Mosapride citrate dihydrate...5.29mg
(eq. to Mosapride citrate.....5 mg)

【適應症】

消化器官蠕動機能異常引起之不適應症狀，包括心窩灼熱、噁心、嘔吐。

【使用方法、劑量】 本藥須由醫師處方使用

一般成人一日 15 mg 分三次於飯前或飯後經口服用。

【警語及注意事項】(依文獻記載)

1.重要的基本注意事項：

本藥品與心臟節律藥物併用時應注意監測其心電圖，如有心律不整之情形發生時，應予減少使用劑量或停藥。

若服藥經過一定期間(通常為二星期)症狀仍然不見改善時，則請勿再繼續長期服用。

2.交互作用：

(1)Mosapride 與以下藥品併用時須小心注意：

藥品名稱	臨床症狀處置方法	機轉、危險因子
具有抗膽鹼作用的藥品，如：硫酸阿托平 (atropine)、溴化丁基東莨菪鹼 (butylscopolamine) 等。	若是同時有服用抗膽鹼藥品時，由於可能降低本品的作用，請注意服用時間的間隔。	由於本品是經由膽鹼的作用促進消化道蠕動，故若和抗膽鹼藥物併用，會抑制本品的作用。

(2)Mosapride 主要是利用肝臟酵素CYP3A4進行代謝。當與其他會影響CYP3A4活性的藥物一起服用時，會使mosapride在體內的藥物濃度改變，例如與CYP3A4抑制劑併用時，會使mosapride在體內濃度提高。因此，當必須同時服用多種藥物時，必須注意是否會引起藥物在人體體內濃度變化。

3.副作用：

在九百九十八個病例中，有四十個病例發現副作用(占4.0%)。其主要的副作用為下痢、軟便(1.8%)、口渴(0.5%)、倦怠感(0.3%)等。在臨床檢查值中，七百九十二個病例中有三十個病例發現症狀異常狀況(占3.8%)。其主要的症狀為嗜酸球增多(1.1%)、三酸甘油酯上昇(1.0%)、GOT、GPT、ALP及γ-GTP値上昇(各占0.4%)等。

(1)臨床上重大的副作用

猛爆性肝炎，肝功能障礙與黃疸(發生率均小於0.1%)有時會發生致命性的猛爆性肝炎與嚴重的肝功能障礙，他們會伴隨著顯著的 GOT、GPT、ALP 及 γ-GTP 數値上昇，偶爾也可能發生黃疸現象。如果病人有發生任何的不正常，應該要馬上停止服用藥物並小心監測其生化數値。

(2)其他副作用

分類	0.1 ~ 5%	頻率不明
過敏症狀	水腫	發疹、蕁麻疹
血液學	嗜伊紅血球增多、白血球減少	
消化器官	下痢、軟便、口渴、腹痛、噁心、嘔吐、味覺異常	腹脹、口腔失去知覺(包括舌頭與嘴唇等)
肝臟	GOT、GPT、ALP、γ-GTP及bilirubin 數値上昇	
循環器官	心悸亢奮	
精神與神經方面	頭昏、頭痛	
其他	倦怠感、三酸甘油酯上昇	震顫

4.對高齡者的投藥方式：

一般由於高齡者的肝、腎功能等生理功能相較於一般人為低，故須仔細觀察患者的狀態，慎重投藥。若發生副作用時，可減少用藥量(例如一天給予7.5 mg)等。

5.對孕婦、產婦、哺乳婦女等的投藥方式：

(1)對孕婦或是有可能懷孕的婦女，應在判斷投藥治療的效益遠超過危險性時，才能開具此藥。(因為本品對懷孕中婦女的安全性尚未經證實)

(2)避免開本品給哺乳中的婦女，若不得不採用本品時，應要求該婦女暫停授乳。(有動物實驗報告指出藥物可能滲入乳汁中(老鼠實驗))

6.對兒童的用藥：本藥對兒童的安全性尚未確知(因尚無使用經驗)。

7.使用時之注意事項：

交付藥劑時應指導患者將本藥從PTP包裝的外裝中取出服用。【曾有報告指出誤吞外包裝時，其堅硬的銳角部份可能會刺入食道粘膜，進而造成食道穿孔及縱隔洞炎等嚴重的合併症狀】

8.其他注意事項：

對齧齒類動物以臨床通常使用量的100~300倍用量(30~100mg/kg/day)長時間經口投予的實驗後(大鼠104星期、小鼠92星期)，發現其腫瘤發生率(肝細胞腫瘤及甲狀腺濾泡性腫瘤)有上昇的狀況。

【藥物動力學】(依文獻記載)

1.血漿中濃度：

(5位健康的成人空腹時服用一次 mosapride citrate 5 mg)

Tmax (h)	Cmax (ng/mL)	t1/2 (h)	Mean ± Standard error
0.8 ± 0.1	30.7 ± 2.7	2.0 ± 0.2	

2.血漿蛋白結合率：99.0% (in vitro，人類血清，濃度 1 μg/mL)

3.主要的代謝產物及代謝路徑：

主要代謝產物：des-4-fluorobenzyl metabolite。

代謝路徑：本品主要是經由肝臟代謝(先將 4-fluorobenzyl 官能基移除，緊接在morpholine環的第5個位置進行氧化反應；在苯環的第3個位置進行氫氧化反應)。

4.排泄路徑及排泄率：(指健康成人，空腹時給予一次mosapride citrate 5mg)

排泄路徑：尿液及糞便。

排泄率：投藥後四十八小時的尿中排泄率，其原型占 0.1%。主要的代謝物質為 (des-4-fluorobenzyl mosapride) 占 7.0%。

5.代謝酵素：細胞色素 (cytochrome) P-450：主要為 CYP3A4

於健康志願者每日投予mosapride 15mg併用erythromycin 1200 mg，較單獨服用mosapride時，其mosapride的最高血中濃度會從42.1ng/mL 昇高到65.7ng/mL，其半衰期會從1.6小時延長至2.4小時，其 AUC₀₋₄會從 62ng · hr/mL，增加到 114ng · hr/mL。

於30位健康志願者每日三次投予mosapride 30mg (90mg/day)，併用ketoconazole 200mg每日一次，結果顯示併用ketoconazole試驗組的mosapride血中濃度高於未併用ketoconazole的對照組的2倍。但對於心電圖QTc間隔距離並無明顯之影響。

於體外試驗中投予warfarin、diazepam及digoxin於含1 μg/mL¹⁴C mosapride citrate之人體血漿蛋白(HAS)，結果各有59.1%、57.9%及 54.8%之¹⁴C mosapride citrate結合於血漿蛋白，顯示與未併用warfarin、diazepam及 digoxin時之血漿蛋白結合率58.0%相似，並無明顯差異。

【臨床實驗】(依文獻記載)

在隨機、雙盲、cisapride 對照組比較設計的臨床試驗，mosapride 在對於腸胃道不適症狀的改善程度與cisapride同樣70%以上的效果；而整體評估方面，兩組的結果也相近(74.8% vs 75%)。累計臨床試驗第一期至第三期服用mosapride的實驗人數(435 個病例)的臨床試驗，針對慢性胃炎症狀的療效結果如右所示：

【藥效及藥理】(依文獻記載)

1.臨床藥理：以健康成人及慢性胃炎患者為對象做胃排出實驗，投與本劑 5 mg，顯示有促進胃排出作用。

2.消化道蠕動促進作用：對清醒的狗在其餐後，促進其胃及十二指腸的蠕動，但對其結腸運動幾乎完全沒有影響。

3.促進胃排出作用：對大鼠及小鼠的實驗中顯示，具有促進胃部對液體的排出作用，及對固型物的排出作用(大鼠)，同時在連續一週反覆投藥後，其促進胃排出作用會減弱(大鼠)。

4.作用機制：本品是選擇性的 serotonin 5-HT₄ 促進劑，會刺激存在消化道內的神經叢中的 5-HT₄ 受體，藉由增加 Acetylcholine 的游離，因而顯示出促進消化道蠕動及胃排出作用等。

【儲存條件】請密封保存於室溫30℃以下及小孩接觸不到之處所。

【包裝】6 ~ 1000 錠塑膠瓶裝、鋁箔盒裝。

賦形劑：Silicon dioxide (Adsolider 101)，Microcrystalline cellulose (Avicel 101)，Croscarmellose sod. (Ac-Di-Sol)，Crospovidone，Lactose，Hydroxypropyl cellulose，Magnesium stearate，HPMC 6 cps，PEG 6000，Titanium dioxide，Talc



中國化學製藥股份有限公司

CHINA CHEMICAL & PHARMACEUTICAL CO., LTD.

總公司：台北市襄陽路 23 號 TEL：(02)23124200

新豐工廠：新竹縣新豐鄉坑子口 182-1 號 ⑥