

26M092

# 摩舒胃清 膜衣錠

5公絲

Mopride® F.C. Tablets 5mg

衛署製字第 G-8919 號  
047656

- [成分] 每錠含 mosapride citrate 5 mg。
- [一般名] 檸檬酸Mosapride Citrate
- [化學名] (±)-4-amino-5-chloro-2-ethoxy-N-[[4-(4-fluorobenzyl)-2-morpholinyl] methyl] benzamide citrate dihydrate
- [分子式]  $C_{21}H_{25}ClFN_3O_3 \cdot C_6H_6O_7 \cdot 2H_2O$
- [分子量] 650.05
- [分布係數] 在室溫，pH值為7.0的條件下，氯仿與水溶液的分布係數為  $9.1 \times 10^2$ 。
- [描述] Mosapride citrate dihydrate為白色或微黃色的白色晶體粉末，沒有臭味，稍帶苦味，易溶於N,N-dimethyl-formamide、pyridine或100%的醋酸，略溶於於甲醇，微溶於95%的乙醇及無水醋酸，幾乎完全不溶於水及diethylether。

### 【適應症】

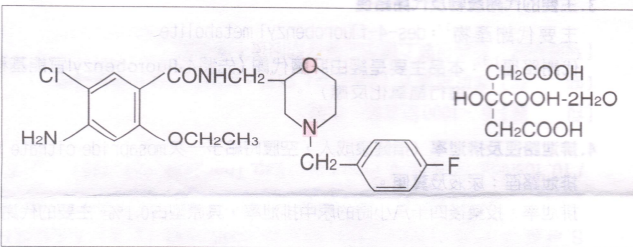
消化器官蠕動機能異常引起之不適症狀，包括心窩灼熱、噁心、嘔吐。

### 【使用方法和劑量】

(本藥須由醫師處方使用)

一般成人一日15mg分三次於飯前或飯後經口服用。

### 【結構式】



### 【警語及注意事項】

#### 1. 重要的基本注意事項

本藥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) MOPRIDE 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%）、三酸甘油脂上昇（1.0%）、GOT、GPT、ALP及 $\gamma$ -GTP値上昇（各占0.4%）等。

#### (1) 臨床上重大的副作用

猛爆性肝炎，肝功能障礙與黃膽（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 $\gamma$ -GTP數値上昇，偶爾也可能發生黃膽現象。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、口控失去知覺（包括舌頭與嘴唇等）
肝臟	GOT、GPT、ALP、 $\gamma$ -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、三酸甘油脂上昇	震顫

### 4. 對高齢者的投藥方式

一般由於高齢者的肝、腎功能等生理功能相較於一般人為低，故需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7.5mg）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 - 100 mg/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】

### 1. 血漿中濃度<sup>1)</sup>

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

T <sub>max</sub> (h)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>1/2</sub> (h)
0.8±0.1	30.7±2.7	2.0±0.2

Mean ± standard error

### 2. 血漿蛋白結合率<sup>2)</sup>

99.0% (in vitro, 人類血清, 濃度 1 $\mu$ g/mL)

### 3. 主要的代謝產物及代謝路徑

主要代謝產物<sup>1)</sup>: des-4-fluorobenzyl metabolite。

代謝路徑<sup>1,3)</sup>: 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 5 mg。)

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<sup>4)</sup>

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 1200mg, 較單獨服用 mosapride 時, 其 mosapride 的最高血中濃度會從 42.1 ng/mL 昇高到 65.7 ng/mL, 其半衰期會從 1.6 小時延長至 2.4 小時, 其 AUC<sub>0-4</sub> 會從 62 ng·hr/mL, 增加到 114 ng·hr/mL<sup>5)</sup>。

於 30 位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 QT<sub>c</sub> 間隔距離並無明顯之影響<sup>6)</sup>。

於體外試驗中投予 warfarin、diazepam 及 digoxin 於含 1 $\mu$ g/mL <sup>14</sup>C mosapride citrate 之人體血漿蛋白 (HAS), 結果各有 59.1%、57.9% 及 54.8% 之 <sup>14</sup>C 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】

在隨機、雙盲、cisapride 對照組比較設計的臨床試驗<sup>7)</sup>, mosapride 在對於腸胃道不適症狀的改善程度與 cisapride 同樣有 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 個案例) 的臨床試驗, 針對慢性胃炎症狀的療效結果如下所示:

疾病及症狀		改善率
慢性胃炎	胸悶	74% (130/176)
	噁心、嘔吐	77% (150/196)

## 【藥效及藥理】

### 1. 臨床藥理

以健康成人<sup>8)</sup> 及慢性胃炎患者<sup>9)</sup> 為對象做胃排出實驗，投與本劑 5mg，顯示有促進胃排出作用。

### 2. 消化道蠕動促進作用<sup>10)</sup>

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<sup>11)</sup>

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<sup>10,11)</sup>

本品是選擇性的 serotonin 5-HT<sub>4</sub> 促進劑，會刺激存在消化道內的神經叢中的5-HT<sub>4</sub>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。

## 【參考文獻】

1. Sakashita M., et al.; Arzneim.-Forsch./Drug Res. 43: 867, 1993 / 2. Matsumoto S. et al., Arzneim.-Forsch./Drug Res. 43: 1084, 1993 / 3. Matsumoto S. et al., Arzneim.-Forsch./Drug Res. 43: 1095, 1993 / 4. 大日本製藥資料 / 5. 加藤貴雄 等. 臨床醫藥. 15: 753, 1999 / 6. 大日本製藥資料(SH-MOS-0015) / 7. 三好秋馬 等. 臨床醫藥. 4: 1037, 1998 / 8. 金泉年郁 等. 日本平滑肌學會雜誌. 26: 161, 1990 / 9. 須山哲次 等. 內科寶函. 40: 175, 1993 / 10. Yoshida. N. et al.: J. Pharmacol Exp. Ther., 257: 781, 1991 / 11. 大日本製藥資料

【包裝】 6 - 1000 錠盒裝、瓶裝

【儲存】 應於室溫下（15-30°C）儲藏。請置於孩童無法取得處。

【有效期間】 超過包裝上標示之保存期限後不應使用。

**TTY BIOPHARM**  
台灣東洋藥品

製造廠：台灣東洋藥品工業股份有限公司  
公司地址：台北市民權東路二段170號4樓

廠址：桃園縣中壢市中華路一段838號  
服務電話：0800086288 網 址：www.tty.com.tw

260W79