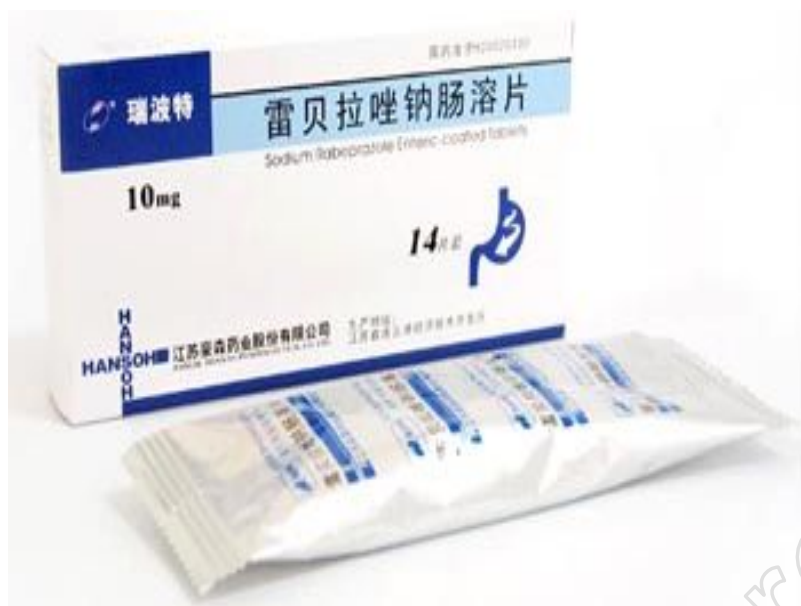


瑞波特 （ 雷贝拉唑钠肠溶片 ）



【药品名称】

通用名称：雷贝拉唑钠肠溶片

商品名称：瑞波特

英文名称：Sodium Rabeprazole Enteric-coated Tablets

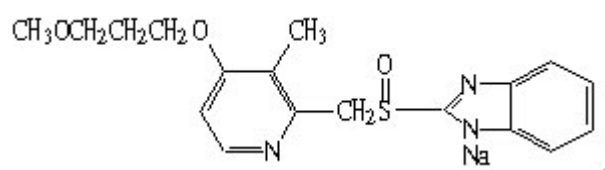
汉语拼音：Leibeilazuona Changrong Pian

【成份】

本品主要成份为雷贝拉唑钠。

化学名称： 2-[[4-(3-甲氧基丙氧基)-3-甲基吡啶-2-基]甲亚磺酰基]-1H-苯并咪唑钠。

化学结构式：



分子式：C₁₈H₂₀N₃O₃Na

分子量：381.43

【性状】

本品为肠溶包衣片，除去包衣后显类白色。

【适应症】

本品适用于以下治疗：

1. 活动性十二指肠溃疡；
2. 良性活动性胃溃疡；
3. 伴有临床症状的侵蚀性或溃疡性的胃-食管返流征（GORD）；
4. 与适当的抗生素合用，可根治幽门螺旋杆菌阳性的十二指肠溃疡；
5. 侵蚀性或溃疡性胃-食管返流征的维持期治疗。目前疗程超过 12 个月的药效尚未进行评估。

【规格】

10 mg。

【用法用量】

本品不能咀嚼或压碎服用，应整片吞服。

1. 成年人/老年患者的用药

A. 活动性十二指肠溃疡和活动性良性胃溃疡患者：20mg（2 片）， 每日 1 次，晨服。

大多数活动性十二指肠溃疡患者在用药 4 周后痊愈。但有 2% 的患者还需要继续用药 4 周才能达痊愈。

一些十二指肠溃疡患者对晨服 10 mg（1 片）片剂，每日 1 次的治疗量即有反应。

大多数活动性良性胃溃疡需在用药六周后痊愈。但有 9% 的患者还需继续用药六周才可达痊愈。

B. 侵蚀性或溃疡性的胃-食管返流征（GORD）患者：20mg（2 片）， 每日 1 次，疗程为 4~8 周。

C. 胃-食管返流征的长期治疗方案（GORD）的维持治疗：疗程为 12 个月，维持治疗量为 10 mg（1 片）或 20mg（2 片），每日 1 次。一些患者对每日 10 mg（1 片）的维持治疗量即有反应。

D. 幽门螺旋杆菌的根治性治疗。

与适当的抗生素合用，可根治幽门螺旋杆菌阳性的十二指肠溃疡。

本品应在早晨、餐前服用，尽管用药时间及摄食对雷贝拉唑钠药效无影响，但此种给药方式更有利于治疗的进行。

2. 肝肾功能不全患者的用药

肝肾功能不全患者在用药过程中无需进行剂量调节。但在对有严重的肝功能不全患者用药时，应参见“不良反应及注意事项”。

【不良反应】

据国外文献报道：

1. 严重副作用：

(1) 休克：有报道本品有发生过敏、休克的副作用，因此若发现异常应立即停止服用，并进行妥善处理。

(2) 血液：本品罕见引起各类血细胞减少，血小板降低，粒细胞缺乏，溶血性贫血等。但偶可引起粒细胞减少，贫血等，发现异常，立即停止服用，并进行治疗。

(3) 视力障碍：国外服用本药，有发现视力障碍的报告。

2. 最常见的不良反应为头痛、腹泻和恶心。其它的不良反应有鼻炎、腹痛、虚弱、胃肠胀气、咽炎、呕吐、非特异性的疼痛或背痛、头晕、流感症状、感染性咳嗽、便秘和失眠。

3. 不良反应有瘙痒、皮疹、心悸、肌痛、胸痛、口干、消化不良、神经过度敏感、嗜睡、支气管炎、鼻窦炎、畏寒、暖气、腿部抽搐、尿道感染、关节炎和发热、四肢无力、感觉麻木、握力下降、步履不稳、疲倦感。

4. 少见的不良反应有：厌食、胃炎、体重增加、抑郁、瘙痒症、视觉/嗅觉功能障碍、口炎、发汗和白细胞增多症。

5. 2%的患者出现肝酶的升高，如 ALT、AST、AI-P、 γ -GTP、LDH 总胆红素上升。

6. 有报道出现大疱疹或其他皮肤反应包括红斑。当出现皮肤病损时应立即停药。

【禁忌】

1. 对雷贝拉唑钠，苯并咪唑替代品或对该制剂制备中使用的任何赋形剂过敏的患者禁用。
2. 孕妇和哺乳期妇女禁用。

【注意事项】

1. 用雷贝拉唑钠治疗的反应不排除存在胃或食道癌。因此在使用本品开始治疗之前应排除存在癌症的可能性。尽管在年龄和性别匹配的轻中度肝脏损伤患者与正常者的对照研究中，未见到明显与药物相关的安全问题，但是重度肝损伤患者初次使用本品治疗时，医生建议要特别注意。
2. 服用本品时，应定期进行血液检查及血液生化学（如肝酶检查），发现异常，即停止用药，并进行及时处理。
3. 肝功能损伤的患者慎用。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

孕妇及哺乳期妇女禁用。

【儿童用药】

对儿童的安全性尚未确定（没有使用经验）。

【老年用药】

本药主要通过肝脏代谢，一般高龄者肝功能低下，会产生副作用，如发生严重副作用时，要暂停用药。

【药物相互作用】

雷贝拉唑钠是作为其他质子泵抑制剂（PPI）类化合物中的一员，通过细胞色素 P450（CYP450）肝脏药物代谢系统代谢。健康受试者研究表明雷贝拉唑钠与其他通过 CYP450 系统代谢的药物，如华法林、苯妥英、茶碱或地西洋无临床上明显的相互作用关系。

雷贝拉唑钠可长期持续地抑制胃酸分泌。本品与依赖 PH 吸收的化合物存在相互作用，因此应该对潜在的相互作用关系进行调查。正常受试者同时服用雷贝拉唑钠结果导致酮康唑水平下降 33%，地高辛水平升高 22%。因此需要对患者个体进行检测以确定当这些药物与本品同时服用时是否需要剂量调整。在临床试验中，同时服用抗酸药物和本品，在一个确定该相互作用的特殊研究中，未观察到液体抗酸药物的相互作用。本品与食物无临床上相应的相互作用。

人体肝脏微粒体体外研究表明雷贝拉唑钠可被 CYP450 的同功酶（CYP2C19 和 CYP3A4）代谢。研究表明有较低的潜在相互作用，然而，对环孢菌素代谢的影响与以前观察过的其他质子泵抑制剂是相似的。

【药物过量】

无已知的特效的解毒剂。雷贝拉唑钠可广泛与蛋白结合，因此，不易透析。应该根据症状治疗。

【药理毒理】

药理作用：

雷贝拉唑钠属于抑制分泌的药物，是苯并咪唑的替代品，无抗胆碱能及抗 H₂ 组胺特性，但可附着在胃壁细胞表面通过抑制 H⁺/K⁺-ATP 酶来抑制胃酸的分泌。此酶系统被看作是酸质子泵，故雷贝拉唑钠作为胃内的质子泵抑制剂阻滞胃酸的产生，此作用是剂量相关性的。动物试验证实雷贝拉唑钠在用药后不久即可从血浆和胃黏膜中排出。

抑制胃酸分泌特性：

在口服雷贝拉唑钠 20mg 后一小时内发挥药效，在 2~4 小时内血药浓度达峰值，在初次用雷贝拉唑钠 23 小时后可抑制基础胃酸量和由食物刺激产生的胃酸量，抑制率分别为 69%和 82%，且时间可长达 48 小时，此作用时间明显长于药代动力学中的半衰期（约 1 小时）。作用机制为抑制 H⁺/K⁺-ATP 酶。雷贝拉唑钠对胃酸分泌的抑制作用随剂量增加可轻微增强，但在三天后可达稳定水平。即使在停药后，此稳定水平也可保持 2~3 天。

毒理研究：

（1）对大鼠以 5mg/kg 剂量进行 2 年的口服毒性试验，在雌性大鼠胃部发现类癌瘤。

（2）动物实验（大鼠口服 25mg/kg 以上），发现甲状腺重量及血中甲状腺素增加，因此服用时要注意甲状腺功能。

对血清胃泌素的影响：

临床实验中，患者接受雷贝拉唑钠 10mg 或 20mg，每日 1 次，疗程为 24 个月的治疗。血清胃泌素水平在用药 2~8 周内升高。通常在停药后一到两周内血清胃泌素值可恢复到治疗前的水平。

【药代动力学】

据国外文献报道：该药是经胃后在肠道内才开始被吸收的。在 20mg 剂量组，血药浓度峰值是在用药后 3.5 小时达到的。在 10mg~40mg 剂量范围内，血药浓度

峰值和曲线下面积与剂量呈线性关系。口服 20mg 剂量组的绝对生物利用度约为 52%。重复用药后生物利用度不升高。健康受试者的药物半衰期约为 1 小时（在 0.7~1.5 范围内），体内药物清除率为 $283 \pm 98 \text{ ml/min}$ 。在慢性肝病患者体内，血药浓度的曲线下面积提高 2~3 倍。

雷贝拉唑钠的血浆蛋白结合率约为 97%，主要的代谢产物为硫醚（M1）和羧酸（M6）。次要代谢物还有砒（M2）乙基硫醚（M4）和硫醚氨酸（M5）。只有乙基代谢物（M3）具有少量抑制分泌的活性，但不存在于血浆中。该药 90% 主要随尿排出，其它代谢物随粪便排出。在需要血液透析的晚期稳定的肾衰患者体内（肌氨酸酐清除率 $\leq 5 \text{ ml/min/1.73m}^2$ ）、雷贝拉唑钠的分布与在健康受试者体内的分布相似。此药用于老年患者时，药物清除率有所降低。当老年患者用雷贝拉唑钠 20mg，每日 1 次，连续 7 天，出现血药浓度的曲线下面积加倍，浓度峰值相对于年轻健康受试者升高 60%。另外，此药在体内无累积现象。

【贮藏】

避光，密闭阴凉处（不超过 20℃）保存。

【包装】

铝塑包装，7 片/板×1 板/盒，7 片/板×2 板/盒，10 片/板×1 板/盒。

【有效期】

暂定 24 个月。

【执行标准】

WS - 389(X - 330) - 2002。

【批准文号】

国药准字 H20020330

【生产企业】

企业名称：江苏豪森药业股份有限公司

生产地址：江苏省连云港经济技术开发区

邮政编码：222047

客户服务电话：8008285227 8008285117（免费，仅限座机拨打）0518-82343315

网 址：<http://www.hansoh.cn>

