

蛋白分解酵素阻斷劑

胰活愛[®]注射劑

FOY[®] for Injection

貯存：室溫保存。

保存期限：標示於外盒(3年)

禁忌 (下述患者禁止使用)：

對本劑有過敏病史的病人。

成分・性狀：

藥品名	胰活愛注射劑
成分	Gabexate mesilate
含量	100mg
劑型	注射劑 (vial)
pH	4.0 ~ 5.5 (本品1.0gm溶於10ml 生理食鹽水的溶液)
滲透壓比	1.1 ~ 1.3 (本品0.1gm溶於10ml 5w/v%葡萄糖注射液的溶液)
顏色	白色，凍結乾燥品

適應症：

急性胰臟炎，伴有蛋白分解酵素釋出之胰臟疾患症狀之緩解，泛發性血管內血液凝固症。

用法・用量：本藥限由醫師使用

1. 胰臟炎：

通常1次1vial(Gabexate mesilate 100mg)以5%葡萄糖注射液或ringer液溶解之,全量為500ml，或者先用注射用水5ml溶解之，此溶液再與5%葡萄糖注射液或ringer液500ml混合，而以8ml/分以下的速率點滴靜注。

(1) 原則上初期用量1日1~3vial (溶解液500~1500ml)其後隨症狀的消退而減量，然按症狀之需要亦可同日中再追加1~3vial(溶解液500~1500ml)點滴靜注。

(2) 按照症狀適當增減用量。

2. 泛發性血管內血液凝固症：

通常成人1日量在Gabexate mesilate 20~39mg/kg範圍內24小時靜脈內持續注射。

用法・用量的相關注意事項：

針對泛發性血管內血液凝固症

本劑在高濃度下可能損害血管內壁，而引起注射部位或血管的靜脈炎，潰瘍或壞死。於末梢血管給藥時，本劑100mg請溶於50ml以上的輸液(濃度0.2%以下)經點滴靜脈注射。

注意事項：

1. 重要的基本注意：

休克症狀可能會發生(極罕見)。應小心詢問病人，並備妥急救器材。使用時應充分觀察，當有血壓下降、發紅、搔癢、感覺不適、乾嘔等症狀發生時，應立即中止給藥，並作適當處置。

2. 副作用

〈胰臟炎〉

在3,893例中85例(2.18%)提出副作用報告。主要為與注射部位相關的血管痛、靜脈炎、發紅等59例(1.52%)，與過敏症相關的發疹、搔癢感25例(0.64%)，血壓下降5例(0.13%)，與消化系統相關的噁心、嘔吐12例(0.31%)。

(從上市到1981年3月的副作用發生頻率報告結果)

〈泛發性血管內血液凝固症〉

在1,952例中56例(2.87%)提出副作用報告。主要為與注射部位相關的血管痛、靜脈炎、發紅等37例(1.90%)，與過敏症相關的發疹、搔癢感5例(0.26%)，GOT、GPT上昇等肝功能異常5例(0.26%)。

(再審查結束時)

(1) 重大副作用

- ① 休克：休克症狀罕見。出現此種症狀時，立即中止給藥，並作適當處理。
- ② 血管：增加濃度或給藥速度時，可能會損傷血管內壁，注射部位及沿注射針頭刺入的血管產生靜脈炎或潰瘍、壞死，因此要充分觀察。注射部位出現血管痛、發紅、發炎等症狀時，要減量或中止給藥。
- ③ 白血球減少：白血球減少可能發生(0.03%)，出現此種症狀時，請中止給藥。

(2) 其他副作用

	0.1~1%以下	0.1%以下	頻率不明
過敏症(註1)	發疹、搔癢感		
出血傾向(註2)		出血傾向亢進	
血液(註1)		顆粒球減少	嗜伊紅血球增多
循環系統	血壓下降		
肝臟	GOT・GPT上昇		
其他	噁心	顏面潮紅、發燒	高血鉀症

(註1) 出現此種症狀時，請中止給藥。

(註2) 出現此種症狀時，請減量或中止給藥。

3. 高齡者給藥

一般高齡者因生理機能衰退，投藥時須注意減量。

4. 孕婦、產婦、授乳婦等給藥：

孕婦或有懷孕可能之婦人應避免大量給藥，[動物實驗老鼠大量給藥(100mg/kg/日)有胎仔體重減少之情形發生。]

5. 使用注意：

(1) 給藥速度：因為增加點滴速度時，可能會引起血壓下降，其速度以不超過每小時每公斤體重2.5mg(Gabexate mesilate)為宜。

(2) 給藥注意：藥液漏出血管外時，注射部位可能會發生硬結或壞死，注意避免藥液漏出血管外。由較大血管給藥可避免鬱血發生。

(3) 製備注意：

1. 溶解後儘快使用。

2. 與其他注射液如抗生素製劑混合時須注意，因為渾濁等變化可能發生。

藥動學：

人新鮮血添加¹⁴C-Gabexate mesilate時，其半衰期約60秒。健康志願者靜脈給藥Gabexate mesilate 10mg/kg時，血中濃度成級數遞減，半衰期約為55秒。健康男性志願者，持續靜脈注射Gabexate mesilate 2mg/kg/小時，其血中濃度在給藥後5~10分鐘達到穩定狀態，其未變化體Gabexate mesilate血中濃度為109ng/ml。

臨床應用：

1. 胰臟炎

- (1) 以急性胰炎、再發型慢性胰炎之急性增惡期、術後之急性胰炎為對象所作之比較臨床試驗，FOY注射劑有改善效果。
- (2) 在包括比較臨床試驗之臨床試驗例256例有疼痛、壓痛與血清amylase值、尿amylase值之改善，其有效率為76.6%。

2. 泛發性血管內血液凝固

- (1) 以泛發性血管內血液凝固症為對象所作之比較臨床試驗FOY注射劑有改善出血症狀與抑制凝固因子之消耗的效果。
- (2) 在包括比較臨床試驗之臨床試驗例254例，其有效率為53.9%

藥效・藥理：

1. 作用機轉

本品能阻斷trypsin, kallikrein 之同時對於Oddi氏括約肌有弛緩作用，對於蛋白分解酵素釋出所伴生之胰臟疾患的症狀緩解有優異的效果。又對於血液凝固系統有阻斷效果，不但能在Antithrombin III不存在下，阻斷thrombin及活性型第X因子，且抑制血小板凝集，對泛發性血管內血液凝固症確認有效。