

久裕企業股份有限公司 函

公司地址：新北市中和區中正路 880 號 14 樓之 5

聯絡電話：02-82277999 分機 2203

聯絡人：萬如耘

受文者：醫院/診所/藥局

發文日期：中華民國 111 年 08 月 15 日

發文字號：字第 11107079 號

速別：普通件

密等及解密條件或保密期限：

附件：新包裝照片/新版仿單/仿單變更處

主旨：暉致醫藥藥品 NORVASC TABLETS 5MG（脈優錠 5 毫克，衛署藥輸字第 021571 號）一包裝及仿單變更通知。

說明：

一、本公司為暉致醫藥股份有限公司之經銷商。

二、暉致醫藥藥品 NORVASC TABLETS 5MG（脈優錠 5 毫克）變更要點如下：

- 1.自批號 FX0313 起，藥商變更為暉致醫藥股份有限公司，外盒、仿單及鋁箔上 Logo 變更為 VIATRIS（詳見照片）。
- 2.新仿單版本為 Australia 20170714-4。
- 3.外盒不再貼防偽標籤。



三、此次變更係依衛生福利部規定自行辦理更新，是項藥品之成分、健保代碼及健保售價均無改變，敬請惠予繼續使用，不勝感激！

順頌 商祺

正本：醫院/診所/藥局

副本：

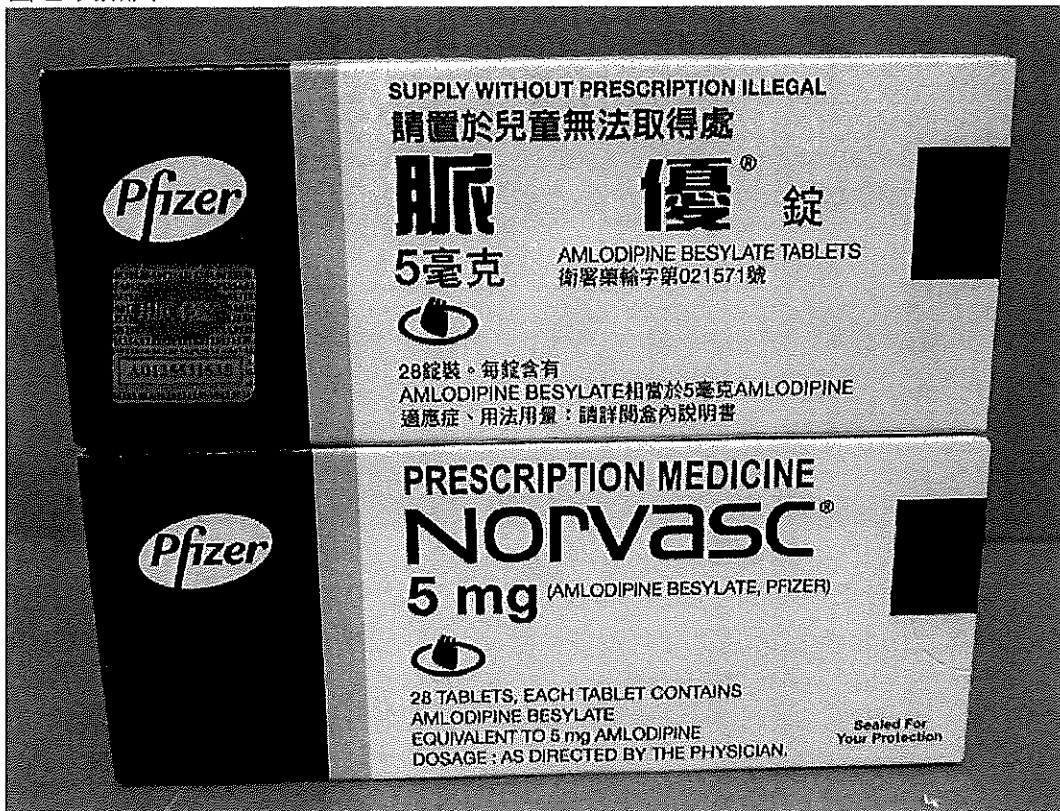
久裕企業
負責人



新包裝照片-1



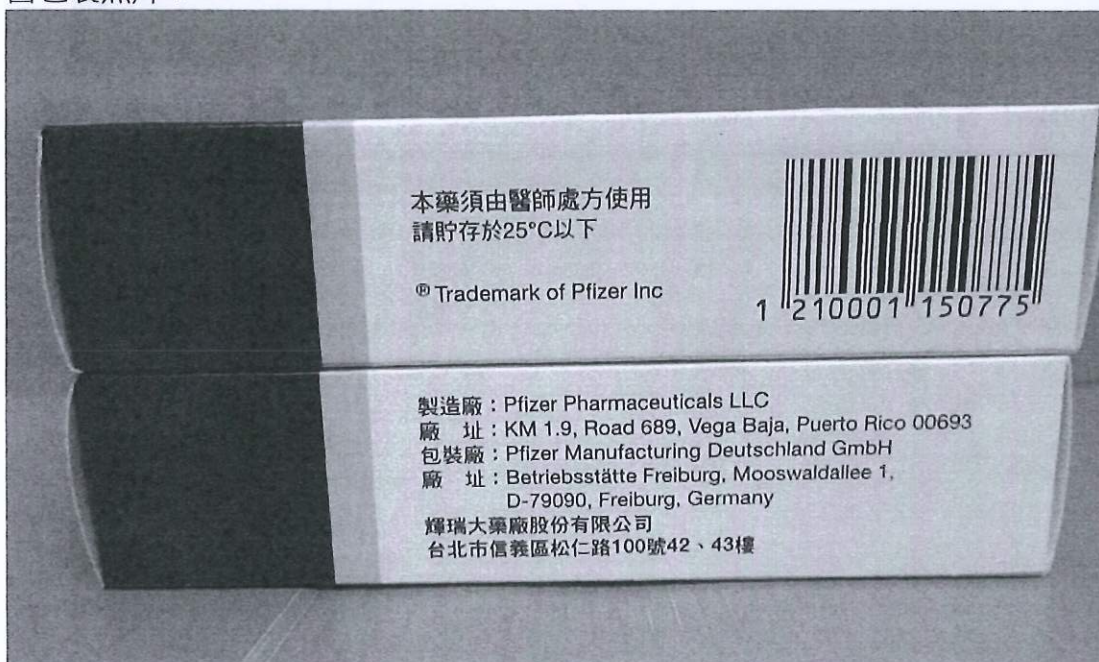
舊包裝照片-1



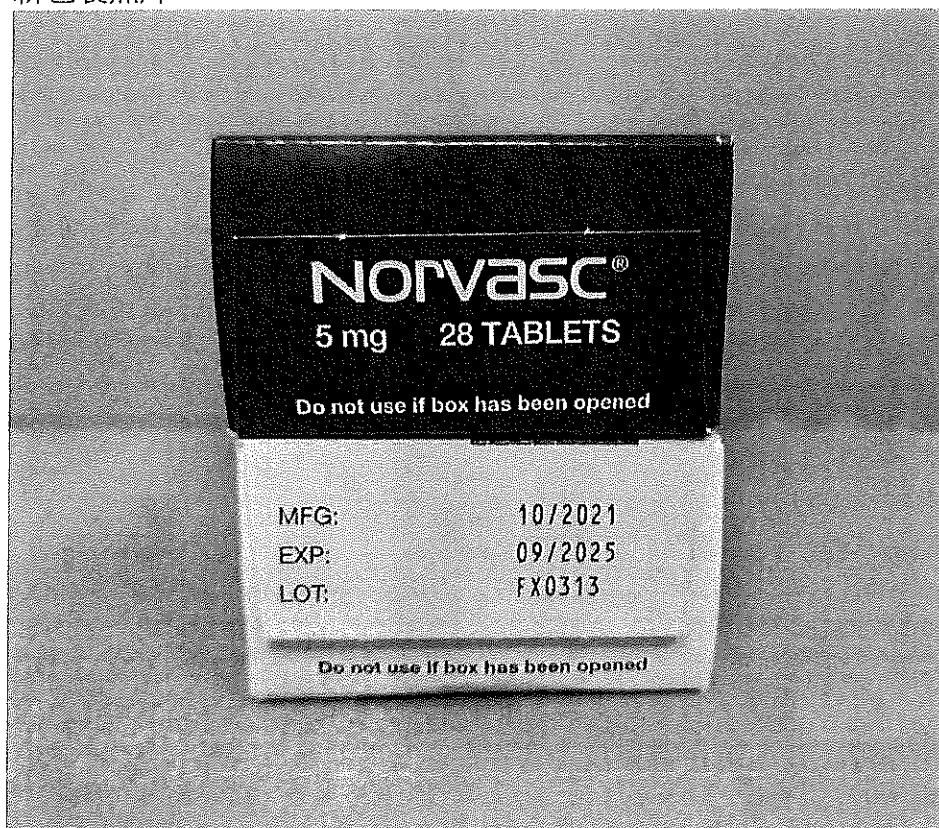
新包裝照片-2



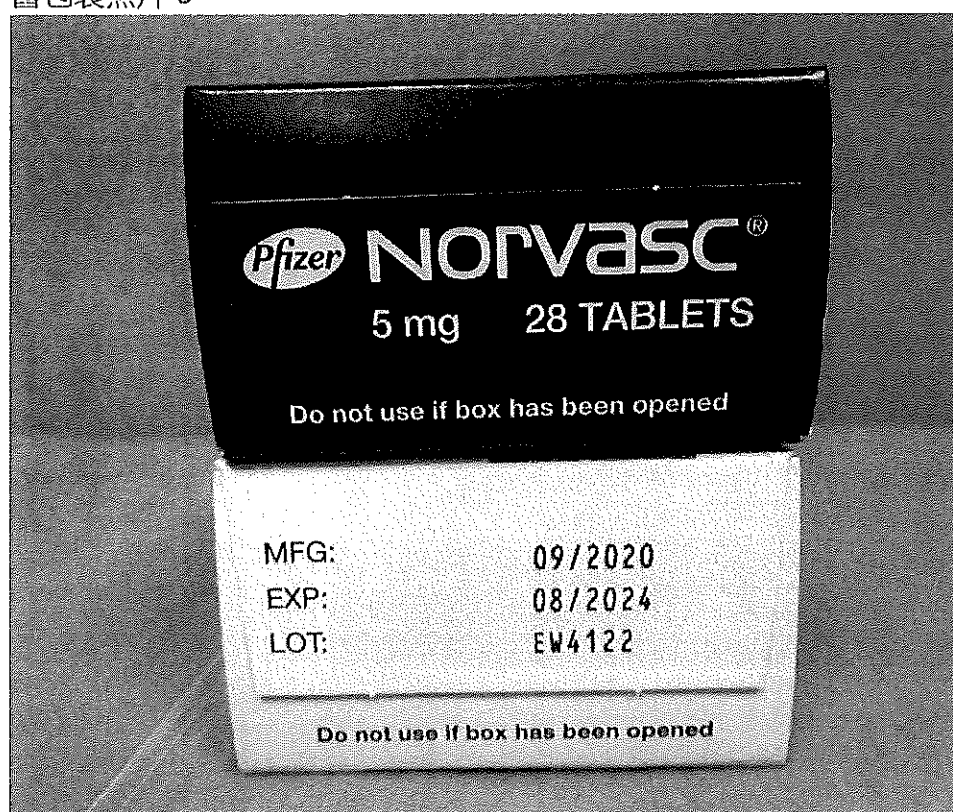
舊包裝照片-2



新包裝照片-3



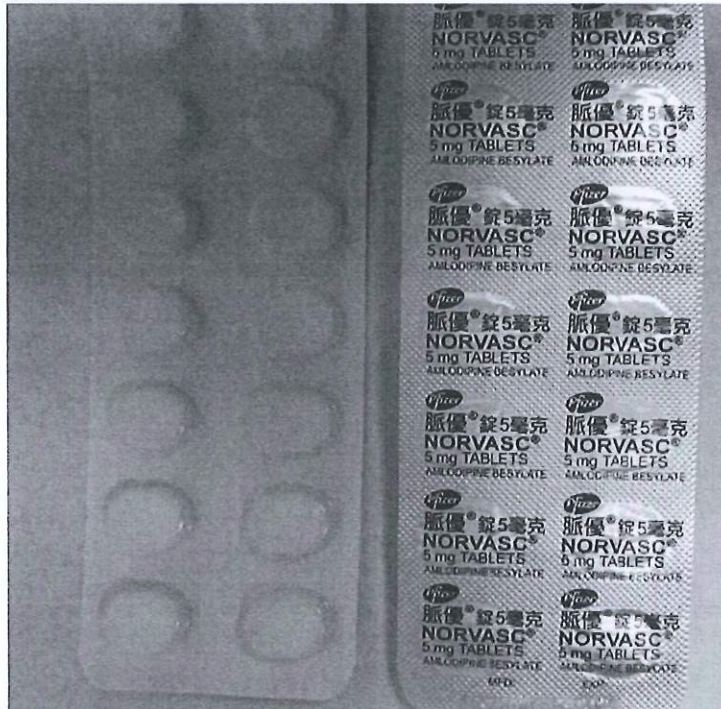
舊包裝照片-3



新包裝照片-4



舊包裝照片-4



脈優® 錠 5 毫克

(Amlodipine 苯磺酸鹽)

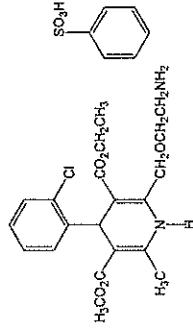
Norvasc® tablets 5mg
(Amlodipine besylate)

衛審藥輸字第 021571 號

產品說明

Amlodipine 苯磺酸鹽是一種 dihydropyridine 衍生物，具有下列的化學名稱：
3-ethyl-5-methyl-2-(2-aminoethoxymethyl)-4-(2-chlorophenyl)-1,4-dihydro-6-methyl-3,5-pyridinedicarboxylate benzene sulphonate [2-(2-胺基乙氧基)甲基)-4-(2-氧苯基)-1,4-二氧-6-甲基-3,5-吡啶二羧酸-3-乙酯-5-甲酯苯磺酸鹽]。

Amlodipine 苯磺酸鹽具有下列的結構式：



Amlodipine 苯磺酸鹽是一種白色結晶粉末，微溶於水中以及難溶於酒精中。分子量為 567.1(原型態為 408.9)。

每顆脈優錠除了含有 amlodipine 苯磺酸鹽外，亦含有下列非活性成份：微晶纖維素、磷酸氫二鈣(無水鹽)、澱粉經基醋酸钠以及硬脂酸鎂。

藥理作用

藥效學

Amlodipine 是鈣離子流入抑制劑(慢速鈣離子通道阻斷劑或鈣離子拮抗劑)，並且會抑制鈣離子穿過細胞膜流入而進入心臟及血管平滑肌內。

實驗結果顯示 amlodipine 可以結合到 dihydropyridine 以及 nondihydropyridine 結合部位上。心肌及血管平滑肌的收縮程序乃是依賴細胞外鈣離子藉由特定離子通

道移入這些細胞內時所引發的。Amlodipine 可以選擇性地抑制鈣離子穿過這些細胞膜而流入細胞內，其選擇性造成對血管平滑肌細胞的作用比對心肌細胞還大。在體外試驗中可以測得減弱收縮力效果，但是完整動物體在治療劑量下並無此種效果。血清中鈣離子濃度不會受 amlodipine 影響。在生理酸鹼度範圍之內，amlodipine 是一種離子化合物(pKa=8.6)，而它與鈣離子通道受體間之動力交互作用的特徵是與這些受體的結合部位形成漸進式的結合及解離速率，這導致其藥理效果的開始作用也是漸進式的。

Amlodipine 是一種周邊動脈血管舒張劑，它能直接作用於血管平滑肌而造成周邊血管阻力下降以及血壓下降。Amlodipine 舒緩心絞痛的確實作用機轉目前尚未完全確立，但 amlodipine 可以經由下列二種作用方式而減低心肌缺血的負擔：

1. Amlodipine 能擴張末梢小動脈，藉此而降低對抗心肌工作的總末梢阻力(afterload)。由於心跳能保持穩定，這種減少心臟卸載作用可以降低心肌能量耗損和氧氣需求。
2. 研究顯示 amlodipine 可以阻斷在正常及缺血區域中由鈣離子、鉀離子、腎上腺素、血清素以及前列凝素 A₂ 類似物所引發的主冠狀動脈以及冠狀小動脈收縮。

血液動力學：高血壓病人服用治療劑量的脈優之後，脈優所產生的血管擴張作用可以降低仰姿及站姿血壓。長期劑量中，這些血壓降低作用不會伴隨發生心跳速率及血漿中兒茶酚胺濃度的明顯變化。雖然用罹患慢性穩定性心絞痛病人所進行的血液動力學研究中，顯示了從靜脈內快速給予 amlodipine 時可以降低動脈血壓以及增加心跳速率，但是在臨床試驗中罹患心絞痛的正常血壓病人經過長期口服 amlodipine 後，並未發現有導致心跳速率或者血壓的明顯變化。

長期地每日口服一次 amlodipine 時，降血壓效果可以維持至少 24 小時。在年輕及老年病人身上，藥物血漿濃度與降壓效果有正相關。

脈優的血壓降低幅度也與治療前血壓升高的幅度有正相關，因此中度高血壓病人(舒張壓 105-114 毫米汞柱)的藥物反應比輕度高血壓病人(舒張壓 90-104 毫米汞柱)的藥物反應高出約 50%。正常血壓受試者在血壓上並未產生明顯的臨床變化(+1/-2 毫米汞柱)。

如同其它鈣離子通道阻斷劑一般，利用脈優治療的心室功能正常的病人，在休息或運動(規律)時之心功能的血液動力學量測，也大體性地證實了心臟指徵會少量上升，而對於dP/dt，或者左心室舒張末期的壓力或體積則沒有明顯影響。

在血液動力學研究中，當完整動物體或者人類服用治療劑量範圍的脈優時並不會伴隨發生減弱收縮力效果，即使人類同時服用了其它beta-阻斷劑時亦不會產生此效果。但是對於正常或其他降低心臟收縮力藥物控制良好的心衰病人，也有類似的發現。

對於腎功能正常的高血壓病人，治療劑量的脈優會使得腎臟血管阻力降低，絲球體過濾速率上升以及有效腎血流上升，而過濾分率或者蛋白尿並不會發生變化。

藥物動力學

吸收

口服治療劑量的amlodipine後，它可以良好地吸收並且在服藥後6-12小時達血中最高濃度，這可以反應出藥物初始在為肝臟吸收而後進入再分佈期，而肝功能不足的病人此區間會較短(2-8小時)。其絕對生體可用率估計約為64-90%，amlodipine的生體可用率不會受食物影響；分佈體積估計約為20公升/公斤體重。

體外研究顯示循環系統中的amlodipine約有97.5%是結合在血漿蛋白上。

生物轉化排除

末端相血漿排除半衰期約為35-50小時，並且在每日一次的劑量下是一致的；連續投與藥物7-8天後可以達到穩定狀態的血漿濃度。

Amlodipine在肝臟大量地被代謝成沒有活性的代謝物，然後以10%原型化合物以及80%代謝物型式由尿液排泄。

特殊族群

老年人 (≥ 65歲)

Amlodipine在老年高血壓病人(平均年齡69歲)的血漿排除率與年輕自願受試者(平均年齡36歲)相比時會降低，這導致了曲線下面積(AUC)增加了大約60%。

臨床試驗：鬱血性心臟衰竭病人的研究

脈優曾在4個8-12週的研究中，對紐約心臟病協會(NYHA) III/II級心臟衰竭病人進行安慰劑的比較，總共包含了697位病人。雖然有關於第一及第二終點方面的效果並未獲得證實，然而依據運動耐性、NYHA分級、症狀或在左心室射出分率的測量結果並無證據顯示心臟衰竭惡化。在長期(至少進行6個月後)追蹤，平均直13.8個月的安慰劑對照性死亡率/發病率研究中，1153名服用穩定劑量利尿劑、毛地黃以及血管收縮素轉換酵素抑制劑的NYHA III級(n=931)或者NYHA IV級(n=222)心臟衰竭病人給予5-10毫克的脈優，在該項研究中的主要評估是所有疾病死亡以及心臟發病(定義為致命性心律不整、急性心肌梗塞或者心臟衰竭)或所導致入院)、NYHA分級或者心臟衰竭症狀等等的總發生率。而脈優對此主要評估沒有影響。所有疾病死亡以及心臟發病事件的總和在服用脈優的病人為222/571(39%)，而服用安慰劑的病人為246/583(42%)：心臟發病事件在此研究中佔有25%的終點。

在這項研究中，amlodipine同時伴有發生肺水腫的案例增高，然而和安慰劑相較，心臟衰竭惡化的發生率並無統計意義上的差別。

電生理影響：在完整動物體或人類身上，amlodipine不會改變竇房節功能或心房心室傳導。對於慢性穩定性心絞痛病人，靜脈注射10毫克amlodipine，然後於30分鐘間隔後再給予另外的10毫克amlodipine時，可以產生周邊血管擴張以及後負載(after load)降低，但是A-H及H-V傳導與節律後負載回復時間並不會明顯改變；同時服用脈優及beta-阻斷劑的病人也有相似的結果。罹患有高血壓或心絞痛的病人於臨床研究中同時服用脈優及beta-阻斷劑時，鬱測到的心電圖變數中並未發現有不良反應。單獨罹患心絞痛的病人在臨床研究中，脈優治療對心電圖區間不會產生改變或者產生更高层次的AV區塊。

對高血壓的療效：高血壓病人服用一天一次的amlodipine後，臨床上顯示在服藥後的24小時區間中，病人的仰姿及立姿血壓都可以明顯降低。由於amlodipine的開始作用是緩慢產生的，因此它不會使得血壓快速的降低。血壓控制效果在24小時劑量區間中可以維持住，而對於藥效波峰及波谷僅有極少差異。持續達1

年以上的研究證實病人沒有產生耐藥性。對於較年長病人收縮壓的療效較大，這可能是因為老年病人治療前收縮壓較高所致。

對於慢性穩定性心絞痛的療效：對於心絞痛病人，一天一次的amlodipine可以增加運動到心絞痛開始發作時的時間，增加運動到1公釐ST區段下移時的總時間，降低心絞痛發生頻率以及降低消化甘油銻劑消耗量。脈優對於心絞痛病人的持續效果已經藉由長期服藥而獲得證實。心絞痛病人沒有臨床明顯的血壓下降(4/1毫米汞柱)或者心率改變(+0.3bpm)。

其它：臨床研究並未發現amlodipine對於血漿中脂質濃度有任何不良的影響。Dihydropyridine類鈣離子通道阻斷劑未曾發現會伴隨任何不良的代謝影響，因此它們適合用於氣喘，糖尿病及痛風的病人。

適應症

高血壓，心絞痛
說明：

1. 高血壓

脈優適合用為輕度至中度本態性高血壓的第一線治療用藥，並且大部分的病人可以單獨使用本藥來控制血壓。使用單一抗高血壓藥物無法適當控制的病人，可以加入脈優以帶來益處，脈優曾被加入到與thiazide類利尿劑、beta腎上腺素受體阻斷劑或者血管收縮素轉換酶抑制劑中一起使用。

2. 心絞痛

脈優適合用為慢性穩定性心絞痛的第一線治療用藥。脈優可以單獨使用、作為單一療法或者與其他抗心絞痛用藥合用。

禁忌

脈優禁用於對amlodipine、其它dihydropyridine類化合物或任何賦型劑過敏的病人。

注意事項

心絞痛增加

極少數病人，特別是那些罹患嚴重障礙性冠狀動脈疾病者，曾經在鈣離子通道阻斷劑療法開始時或者劑量增加之時導致了心絞痛頻率、持續期間及嚴重性增加。這種結果的機制尚不清楚。

流出障礙(大動脈狹窄)

脈優使用於有固定性左心室流出障礙(大動脈狹窄)的病人時應特別注意。

使用於鬱血性心衰病人：一般而言，鈣離子通道阻斷劑使用於心衰病人時均應特別注意。在一項安慰劑對照，包含1153名服用穩定劑量利尿劑、毛地黃以及血管收縮素轉換酶抑制劑的NYHA II或III級心衰病人的臨床試驗中，曾給予這些病人脈優(每天5毫克-10毫克)，而後繼續追蹤至少進行6個月，平均值為14個月。在存活率或心臟發病率(定義為致命性心律不整、急性心肌梗塞或者心衰惡化或所導致入院)方面並無整體性的不良影響。脈優曾在4個8-12週的研究中，對NYHA II/III級心衰病人進行安慰劑的比較，總共包含了697位病人，在這些研究中依據運動耐性、NYHA分級、症狀或左心室射出分率的測量結果並無證據顯示心衰會更糟。

停用Beta-阻斷劑：脈優並非Beta-阻斷劑，因此對於突然停用Beta-阻斷劑並無法提供保護；任何Beta-阻斷劑的停用都應該利用逐漸減低劑量來達到。

使用於肝功能受損病人：尚無有適當的研究建立出肝功能不全病人以及建議劑量之間的關係。少數輕度至中度肝功能受損的病人給予5毫克單一劑量後，amlodipine的半衰期會延長。肝功能檢驗值惡化的情況可能發生，因此這些病人服用脈優時應特別注意，並且應該進行仔細的監測。可能需要較低的起始劑量(參見用法用量)。

使用於腎功能受損病人：amlodipine會大量地代謝成為不活性代謝物，10%是以原型藥物由尿液排泄出去。Amlodipine血漿濃度的改變與腎臟的損傷程度無相關性，所以這些腎功能受損病人可以使用正常劑量。Amlodipine無法被透析。

周邊水腫：輕度至中度周邊水腫是臨床試驗中最常見的不良事件(參見不良反應一節)。周邊水腫的發生率與劑量有關，其頻率範圍在5毫克至10毫克劑量範圍間

是3.0至10.8%。應該特別注意左心室功能失常嚴重(惡化)時所產生結果以及這種周邊水腫之間的差異。

懷孕中使用

分級C

鈣離子通道阻斷劑有可能使得母體血壓過低而導致胎兒缺氧，因此除了預期效益比胎兒風險還高時，孕婦不應使用本藥物。

脈優對人類懷孕或授乳的安全性尚未確立。在動物的生殖試驗中，大鼠口服高達18毫克/公斤體重劑量的amlodipine(驗基)時，並未對繁殖力產生影響；而大鼠(18毫克/公斤體重劑量)及兔子(10毫克/公斤體重劑量)亦未產生致畸胎。大鼠在臨盆時或接近期時給予amlodipine(10毫克/公斤體重劑量)亦未產生致畸胎。相當於7毫克/公斤體重劑量會使懷孕期加長、死胎增加以及新生兒存活率降低。

授乳中使用

人體使用經驗表明amlodipine可分泌至人乳中。在31名發生妊娠高血壓的授乳女性中，施用amlodipine(初始劑量為每天一次每次5毫克)後，乳汁與血漿中amlodipine濃度比中位數為0.85。該劑量會視需要做相應調整，平均每日劑量及依體重校正後的每日劑量分別為6毫克和98.7微克/公斤。估計經由乳汁進入嬰兒體內的amlodipine每日劑量約為4.17微克/公斤。

利用脈優進行治療時應停止授乳。

使用於兒童

對於兒童的安全性及效果尚未確立。

使用於老年人

老年人(65歲)對amlodipine的清除率會下降而使曲線下面積(AUC)上升。在臨床試驗中，老年人的不良反應發生率比年輕族群(<65歲)還要高出6%。不良反應包括了水腫、肌肉絞痛及暈眩。老年人使用脈優時應特別小心。

致癌性：amlodipine的致癌性尚未完全確立。大鼠口服高達2.5毫克/公斤體重劑量的amlodipine時，並未引發任何腫瘤。此劑量能讓血漿中amlodipine的濃度達到相似於服用臨床劑量時的血漿中濃度。

藥物交互作用

脈優可以安全地與thiazide類利尿劑、beta阻斷劑、血管收縮素轉換酶抑制剂、長效硝酸鹽、舌下硝化甘油、非固醇抗發炎藥、抗生素以及降血糖藥物等一起使用。

某些研究顯示共同服用脈優與毛地黃不會改變健康個體的血液中毛地黃濃度或者毛地黃腎清除率；與cimetidine共同服用時不會影響amlodipine的藥物動力學；與warfarin共同服用時不會改變warfarin對凝血酶素的反應時間。

利用人類血漿進行的體外研究顯示amlodipine對於受試藥物(毛地黃、phenytoin、warfarin或indomethacin)的蛋白結合率沒有影響。

Simvastatin

Amlodipine 多次劑量與simvastatin併用，和simvastatin單獨使用相較，會使simvastatin曝露量增高。當病人目前已在服用amlodipine時，應閱讀simvastatin的產品資訊以選擇適當的劑量。

葡萄柚汁

葡萄柚汁已知會抑制細胞色素P450系統，因此會影響像鈣離子阻斷劑類藥物的藥物動力學。所以，不建議amlodipine與葡萄柚或葡萄柚汁併用，因為某些病人的生體可用率會增加進而增加血壓降低的作用。

CYP3A4抑制劑

服用CYP3A4抑制劑erythromycin的年輕病人與服用diltiazem的老年病人在併用amlodipine時會造成amlodipine的血中濃度增高。目前其臨床相關性尚未確定。目前無法排除強效CYP3A4抑制劑(如：ketoconazole, itraconazole, ritonavir)可能亦會使amlodipine的血漿濃度增高，且增加的程度較diltiazem的效用強，故amlodipine與CYP3A4抑制劑併用時應小心。

Clarithromycin

Clarithromycin 是一種 CYP3A4 抑制劑。服用 clarithromycin 的病人在併用 amlodipine 時，低血壓的風險會增高。Amlodipine 與 clarithromycin 併用時，建議密切觀察病人。

CYP3A4 誘導劑

目前尚無 CYP3A4 誘導劑對 amlodipine 影響的資料。與 CYP3A4 誘導劑 (如：rifampicin, Hypericum perforatum (St John's Wort)) 併用可能會導致 amlodipine 的血中濃度降低。Amlodipine 與 CYP3A4 誘導劑併用時應小心。

鋁鎂 (制酸劑)

鋁鎂制酸劑與單一劑量的 amlodipine 併用，對 amlodipine 的藥物動力學沒有顯著影響。

Sildenafil

16 位原發性高血壓病人服用 100 毫克 sildenafil，對 amlodipine 的藥物動力學不會有顯著影響。當 amlodipine 與 sildenafil 併用時，兩者藥品會獨立地產生個別降血壓作用。

Atorvastatin

多次劑量 amlodipine 10 毫克與 atorvastatin 80 毫克併用，對 atorvastatin 穩定狀態的藥物動力學不會有顯著影響。

Ethanol (alcohol)

單一與多重劑量 amlodipine 10 毫克不會顯著影響 ethanol 的藥物動力學。

Cyclosporin

除了腎臟移植的病人之外，健康受試者或其他族群，目前尚未進行 cyclosporin 與 amlodipine 的藥物交互作用試驗。許多腎臟移植病人的試驗顯示，amlodipine 併用 cyclosporin 會影響 cyclosporin 的波谷濃度，且應考慮對腎臟移植並使用 amlodipine 的病人監測 cyclosporin 濃度。

Tacrolimus

與 amlodipine 併用，血中 tacrolimus 血中濃度有增高的風險。為避免 tacrolimus 的毒性，對使用 tacrolimus 治療的病人同時投予 amlodipine 時，需要監測 tacrolimus 血中濃度，必要時應適當調整 tacrolimus 劑量。

Rapamycin (mTOR) 抑制劑的機構標靶

mTOR 抑制劑，例如 sirolimus、temsirolimus 和 everolimus 為 CYP3A 受質。

Amlodipine 為弱效 CYP3A 抑制劑。併用 mTOR 抑制劑和 amlodipine 可能會使

mTOR 抑制劑的暴露量增加。

不良反應

脈優曾在世界各國於臨床試驗中經由 11,000 以上名病人評估為安全的。

一般而言，利用高達每日 10 毫克的脈優進行治療時依然有良好的耐受性。利用脈優進行治療時所報告出的大部分不良反應都是輕度至中度的。在有對照組的臨床試驗中，直接將劑量高達 10 毫克的脈優 (n=1730) 與安慰劑 (n=1250) 相較時，由於不良反應而須停用脈優的病人僅有 1.5%，而且與安慰劑 (約 1%) 相比時並沒有顯著的差異。利用脈優進行治療時，實驗室常規檢驗並未產生臨床明顯的變化，在血鉀、血糖、總三酸甘油酯、總膽固醇、高密度脂蛋白膽固醇、尿酸、血中尿素氮、血中肌酸酐或者肝功能測試方面都沒有相關聯的臨床變化。

最常見的不良反應是頭痛及水腫，與劑量相關的不良反應發生率 (%) 如下：

不良反應	2.5 毫克 (n=275)	5.0 毫克 (n=296)	10.0 毫克 (n=520)	安慰劑 (n=1250)
水腫	1.8	3.0	10.8	0.6
暈眩	1.1	3.4	3.4	1.5
潮紅	0.7	1.4	2.6	0.0
心悸	0.7	1.4	4.5	0.6

在安慰劑對照性臨床試驗中，所產生的不良反應並非確實與劑量相關而且發生率大於 1.0% 者包括下列：

不良反應	脈優 (%) (n=1730)	安慰劑 (%) (n=1250)
頭痛	7.3	7.8

疲勞	4.5	2.8
噁心	2.9	1.9
腹痛	1.6	0.3
嗜睡	1.4	0.6

下列是對照性臨床試驗、開放性試驗條件之下或者是市場經驗中，原因不確定而自發生率<1%及>0.1%的不良反應；在此列出這些不良反應以告知醫生其可能性關係：

血液與淋巴系統障礙：白血病、血小板缺乏。

心臟障礙：心跳過快。

耳與迷路障礙：耳鳴、頭暈。

眼睛障礙：視覺異常、結膜炎、複視、眼痛。

胃腸道障礙：排便習慣改變、便秘、腹瀉、口乾、消化不良*、吞嚥困難、脹氣、牙齦腫、胰臟炎、嘔吐。

一般性障礙與投予位置：衰弱*、不適、疼痛、僵硬、口渴。

免疫系統障礙：過敏。

調查：體重增加。

代謝與營養障礙：厭食、血糖增加。

肌肉骨骼與結締組織障礙：關節痛、關節炎、肌肉絞痛*、肌肉痛。

神經系統障礙：感覺遲鈍、感覺異常、末梢神經病變、姿勢性暈眩、暈厥、震顫。

精神障礙：夢境異常、焦慮、人格解體、震駭、失眠、心情改變、神經質。

腎臟與泌尿系統障礙：排尿異常、頻尿、夜尿。

生殖系統與乳房障礙：女樣男乳、性功能障礙(男性*與女性)。

呼吸、胸膈與縱隔障礙：呼吸困難*、流鼻血。

皮膚及皮下組織障礙：禿頭、血管水腫、搔癢*、紫癜病、發疹*、發疹性紅斑、發疹性黑丘疹、盜汗。

血管障礙：臉部發熱發紅、低血壓、周邊組織缺血、姿勢性低血壓、血管炎。

* 在安慰劑對照性實驗中，小於1%病人發生這些不良反應，但是在所有多重劑量的研究中其發生率介於1%及2%。

下列不良反應發生小於0.1%的病人上：心臟衰竭、脈搏不規則、心臟期外收縮、皮膚變色、蕁麻疹、皮膚乾燥、脫毛、皮膚炎、多樣性皮膚發紅、肌肉無力、抽搐、運動失調、張力性亢進、偏頭痛、皮膚發冷及滑膩、冷淡、焦慮、健忘、胃炎、食慾上升、軟便、咳嗽、鼻炎、排尿困難、多尿、嗅覺異常、味覺變調、視覺調節異常、乾眼症以及體重增加。

和其他鈣離子阻斷劑一樣，下列副作用很少發生，也無法與潛在疾病的自然病史區分開來：心肌梗塞、心率不整(包括心跳緩慢、心室心跳過速與心房顫動)與胸痛。

偶爾會有肝炎、黃疸及肝酵素上升(大部分與膽固醇沉著病一致產生)的上市後報告。曾有一些與使用amlodipine有關的病例是嚴重到需要住院，但是大部分病例的發病原因不確定。

曾有與使用amlodipine有關的離體外症候群的上市後報告。

慢性阻塞性肺疾、良好代償性心衰竭、周邊血管疾病、糖尿病以及血脂不正常的人都曾安全地使用過脈優。

用法用量

本藥須由醫師處方使用

對於高血壓及心絞痛，通常起始劑量為每日2.5毫克至5毫克，可以依據個別病人的治療結果將劑量增加至最大10毫克。

小體型、脆弱或老年病人，或者肝功能不足病人必須從每日2.5毫克開始，而且可以將此劑量的脈優加入至其它正使用中的降血壓治療藥物中。

劑量應依據個別病人的需要而調整。一般而言，每次的劑量調整應在7至14天後進行，好讓醫生能完整評估病人對每種劑量的治療結果。如果病人可以更密集地加以整評，而且有臨床需求時，劑量調整可以加快進行。關於劑量及不良反應的資訊請參見**不良反應**。

與其它抗高血壓藥物及/或抗心絞痛藥物併用：

脈優曾經安全地與thiazide類利尿劑、血管收縮素轉換酵素抑制劑、beta阻斷劑、長效硝酸鹽及/或舌下硝化甘油等一起使用。

當脈優與 thiazide 類利尿劑、血管收縮素轉換酵素抑制劑、beta 阻斷劑、長效硝酸鹽及/或舌下硝化甘油等一起使用時，不須進行劑量調整。

藥物過量

目前資料顯示脈優過量時會引起過度的末梢血管擴張與顯著低血壓以及反射性心跳過速。任何鈣離子阻斷過量時皆可能會發生心率不整。脈優過量 1-5 小時內會出現低血壓與心跳緩慢。即經治療，低血壓可能持續超過 24 小時。心臟障礙曾有案例持續至 7 天。曾有案例報導發生顯著且持續全身性低血壓到包括休克死亡。

企圖性藥物過量的報告包括一位病人吞服 250 毫克藥物後無症狀產生並且未住院；另一位(120 毫克)則有住院，進行了洗胃並且保持在正常血壓；第三位(105 毫克)則有住院並且產生低血壓(90/50 毫米汞柱)，經過增加血漿後血壓恢復正常。第一位 15 歲女孩服用 amlodipine 140 毫克併服 10 粒 mefenamic acid 膠囊與一位 63 歲女性服用 amlodipine 70 毫克併服未知量 oxazepam 而致死。曾被記載的一例意外性藥物過量是 19 個月大的男性服用了 30 毫克脈優(約為 2 毫克/公斤體重)，於急救室處理時生命跡象很穩定而且沒有低血壓現象，但是心跳速率高達每分鐘 180 下。

如果可能產生大劑量的藥物過量時，應給予密切的心臟及呼吸監測。經常劑量血壓是必要的。一旦發生低血壓時，必須開始使用包含提高四肢以及重複注入流體的心血管支援處理。如果低血壓現象對於這些傳統手段依然沒有反應時，則應仔

細考慮注射血管加壓素(例如 phenylephrine)，同時要評估循環體積以及排尿量。靜脈注射葡萄糖酸鈣可以幫助回償這種鈣離子流入受阻的效果。健康自願者在服用 amlodipine 10 毫克立即或 2 小時內服用用活性碳會有意義地降低 amlodipine 的吸收。對意識尚未清醒或嘔吐反射失調的病人，應考慮在呼吸道被保護的情況下，經由鼻胃管給予活性碳。因為血液動力不穩定與可能會立即發生中樞神經系統抑制，不建議使用 ipecac 催吐。由於 amlodipine 的蛋白結合率高，透析似乎沒什麼益處。洗胃在某些狀況中值得考慮。

外觀

脈優為“翡翠”型的白色至灰白色錠劑，含有相當於 5 毫克活性 amlodipine 鹼基的 amlodipine 苯磺酸鹽。這些錠劑在其中一面有刻痕及“AML 5”字樣，而另一面有“Pfizer”的字樣。

包裝

2-1000 粒盒裝

儲存條件

請貯存於 25°C 以下

版本: Australia 20170714-4

製造廠:

Pfizer Pharmaceuticals LLC
KM 1.9, Road 689, Vega Baja, Puerto Rico 00693

包裝廠：

Pfizer Manufacturing Deutschland GmbH
Betriebsstätte Freiburg, Mooswaldallee 1, D-79090, Freiburg, Germany
輝致醫藥股份有限公司 販賣
臺北市信義區松仁路 100 號 42、43 樓

脈優® 錠 5 毫克

(Amlodipine 苯磺酸鹽)

Norvasc® tablets 5mg

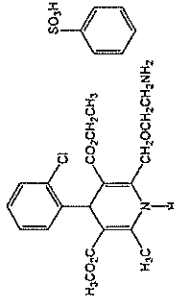
(Amlodipine besylate)

衛署藥輸字第 021571 號

產品說明

Amlodipine 苯磺酸鹽是一種 dihydropyridine 衍生物，具有下列的化學名稱：
3-ethyl-5-methyl-2-(2-aminoethoxymethyl)-4-(2-chlorophenyl)-1,4-dihydro-6-methyl-3,5-pyridinedicarboxylate benzene sulphonate [2-(2-胺基乙羰基甲基)-4-(2-氯苯基)-1,4-二氫-6-甲基-3,5-吡啶二羧酸-3-乙酯-5-甲酯苯磺酸鹽]。

Amlodipine 苯磺酸鹽具有下列的結構式：



Amlodipine 苯磺酸鹽是一種白色結晶粉末，微溶於水中以及難溶於酒精中。分子量為 567.1(原型態為 408.9)。

每顆脈優錠劑除了含有 amlodipine 苯磺酸鹽外，亦含有下列非活性成份：微晶纖維素、磷酸氫二鈣(無水鹽)、羧粉經基醋酸鈉以及硬脂酸鎂。

藥理作用

藥效學

Amlodipine 是鈣離子流入抑制劑(慢速鈣離子通道阻斷劑或鈣離子拮抗劑)，並且會抑制鈣離子穿過細胞膜流入而進入心臟及血管平滑肌內。

實驗結果顯示 amlodipine 可以結合到 dihydropyridine 以及 nondihydropyridine 結合部位上。心肌及血管平滑肌的收縮程序乃是依賴細胞外鈣離子藉由特定離子通

道移入這些細胞內時所引發的。Amlodipine 可以選擇性地抑制鈣離子穿過這些細胞膜而流入細胞內，其選擇性造成對血管平滑肌細胞的作用比對心肌細胞要大。在體外試驗中可以測得減弱收縮力效果，但是完整動物體在治療劑量下並無此種效果。血清中鈣離子濃度不會受 amlodipine 影響。在生理酸鹼度範圍之內，amlodipine 是一種離子化合物(pKa=8.6)，而它與鈣離子通道受體間之動力交互作用的特徵是與這些受體的結合部位形成漸進式的結合及解離速率，這導致其藥理效果的開始作用也是漸進式的。

Amlodipine 是一種周邊動脈血管舒張劑，它能直接作用於血管平滑肌而造成周邊血管阻力下降以及血壓下降。Amlodipine 舒緩心臟的確實作用機轉目前尚未完全確立，但 amlodipine 可以經由下列二種作用方式而減低心臟的負擔：

1. Amlodipine 能擴張末梢小動脈，藉此而降低對抗心臟工作的總末梢阻力(afterload)。由於心臟能保持穩定，這種減少心臟負擔作用可以降低心肌能血耗損和氧氣需求。
2. 研究顯示 amlodipine 可以阻斷在正常及缺血區域中由鈣離子、鉀離子、腎上腺素、血清素以及前列腺素 A 類似物所引發的主冠狀動脈以及冠狀小動脈收縮。

血液動力學：高血壓病人服用治療劑量的脈優之後，脈優所產生的血管擴張作用可以降低仰姿及站姿血壓。長期劑量中，這些血壓降低作用不會伴隨發生心跳速率及血漿中兒茶酚胺濃度的明顯變化。雖然用慢性穩定性心臟病人所進行的血液動力學研究中，顯示了從靜脈內快速給予 amlodipine 時可以降低動脈血壓以及增加心跳速率，但是在臨床試驗中穩定性心臟病人的正常血壓病人經過長期口服 amlodipine 後，並未發現有導致心跳速率或者血壓的明顯變化。

長期地每日口服一次 amlodipine 時，降血壓效果可以維持至少 24 小時。在年輕及老年病人身上，藥物血漿濃度與降壓效果有正相關。

脈優的血壓降低幅度也與治療前血壓升高的幅度有正相關，因此中度高血壓病人(舒張壓 105-114 毫米汞柱)的藥物反應比輕度高血壓病人(舒張壓 90-104 毫米汞柱)的藥物反應高出約 50%。正常血壓受試者在血壓上並未產生明顯的臨床變化(+1/-2 毫米汞柱)。

如同其它钙离子通道阻断劑一般，利用脈壓治療的心室功能正常的病人，在休息或運動(節律)時之心功能的血液動力學量測，也大體性地證實了心臟指數會小量上升，而對於dP/dt，或者左心室舒張末期的壓力或體積則沒有明顯影響。

在血液動力學研究中，當完整動物體或者人類服用治療劑量範圍的脈壓時並不會伴隨發生減弱收縮力效果，即使人類同時服用了其它beta-阻斷劑時亦不會產生此效果。(但是對於正常或其他降低心臟收縮力藥物控制良好的心衰竭病人，也有類似的發現。

對於腎功能正常的高血壓病人，治療劑量的脈壓會使得腎臟血管阻力降低，絲球體過濾速率上升以及有效腎血流量上升，而過濾分率或者蛋白尿並不會發生變化。

藥物動力學

吸收

口服治療劑量的amlodipine後，它可以良好地吸收並且在服藥後6-12小時達血中最高濃度。這可以反應出藥物初始先為肝臟吸收而後進入再分佈期，而肝功能不足的病人此區間會較短(2-8小時)。其絕對生體可用率估計約為64-90%，amlodipine的生體可用率不會受食物影響；分佈體積估計約為20公升/公斤體重。

體內研究顯示循環系統中的amlodipine約有97.5%是結合在血漿蛋白上。

生物轉化/排除

末端相血漿排除半衰期約為35-50小時，並且在每日一次的劑量下是一致的；連續投與藥物7-8天後可以達到穩定狀態的血漿濃度。

Amlodipine在肝臟大量地被代謝成沒有活性的代謝物，然後以10%原型化合物以及60%代謝物型式由尿液排泄掉。

特殊族群

老年人 (≥ 65歲)

Amlodipine在老年高血壓病人(平均年齡69歲)的血漿排除率與年輕自願受試者(平均年齡36歲)相比時會降低，這導致了曲線下面積(AUC)增加了大約60%。

臨床試驗：鬱血性心臟衰竭病人的研究

脈壓曾在4個8-12週的研究中，對紐約心臟病協會(NYHA) III/III級心臟衰竭病人進行安慰劑的比較，總共包含了697位病人。雖然有關於第一及第二終點方面的效果並未獲得證實，然而依據運動耐性、NYHA分級、症狀或左心室射出分率的測量結果並無證據顯示心衰竭會惡化。在長期(至少進行6個月後)連續追蹤，平均值(13.8個月)的安慰劑對照性死亡率/發病率研究中，1153名服用穩定劑量利尿劑、毛地黃以及血管收縮素轉換酶抑制劑的NYHA III級(n=931)或者NYHA IV級(n=222)心臟衰竭病人給予5-10毫克的脈壓，在該項研究中的主要評估是所有疾病死亡以及心臟衰竭(定義為致命性心律不整、急性心肌梗塞或者心臟衰竭化或所導致入院)、NYHA分級或者心臟衰竭症狀等等的總發生率。而脈壓對此主要評估沒有影響。所有疾病死亡以及心臟發病事件的總和在服用脈壓的病人為222/571(39%)，而服用安慰劑的病人為246/583(42%)；心臟發病事件在此研究中佔有25%的終點。

在這項研究中，amlodipine同時伴有發生肺水腫的案例增高，然而和安慰劑相較，心臟衰竭惡化的發生率並無統計學上的差別。

電生理影響：在完整動物體或人類身上，amlodipine不會改變竇房節功能或心房心室傳導。對於慢性穩定性心絞痛病人，靜脈注射10毫克amlodipine，然後於30分鐘間隔後再給予另外的10毫克amlodipine時，可以產生周邊血管擴張以及後負載(after load)降低，但是A-H及H-V傳導與節律後寬節回復時間並不會明顯改變；同時服用脈壓及beta-阻斷劑的病人也有相似的結果。電擊有高血壓或心絞痛的病人於臨床研究中同時服用脈壓及beta-阻斷劑時，體測到的心電圖變數中並未發現有不良反應。單獨電擊心絞痛的病人在臨床研究中，脈壓治療對心電圖區間不會產生改變或者產生更程度的AV區塊。

對高血壓的療效：高血壓病人服用一天一次的amlodipine後，臨床上顯示在服藥後的24小時區間中，病人的仰姿及立姿血壓都可以明顯降低。由於amlodipine的開始作用是緩慢產生的，因此它不會使得血壓快速的降低。血壓控制效果在24小時劑量區間中可以維持住，而對於藥效波峰及波谷區僅有極少差異。持續達1

年以上的研究證實病人沒有產生耐藥性。對於較年長病人收縮壓的療效較大，這可能是因為老年病人治療前收縮壓較高所致。

對於慢性穩定性心絞痛的療效：對於心絞痛病人，一天一次的amlodipine可以增加通到心絞痛開始發作的時間，增加通到1公釐ST區段下移時的總時間，降低心絞痛發生頻率以及降低消化甘油酸酯消耗量。脈優對於心絞痛病人的持續效果已經藉由長期服藥而獲得證實。心絞痛病人沒有臨床明顯的血壓下降(4/1毫米汞柱)或者心率改變(+0.3bpm)。

其它：臨床研究並未發現amlodipine對於血漿中脂質濃度有任何不良的影響。Dihydropyridine類鈣離子通道阻斷劑未曾發現會伴隨任何不良的代謝影響，因此它們適合用於氣喘，糖尿病及癱瘓的病人。

適應症

高血壓，心絞痛

說明：

1. 高血壓

脈優適合用為輕度至中度本態性高血壓的第一線治療用藥，並且大部分的病人可以單獨使用本藥來控制血壓。使用單一抗高血壓藥物無法適當控制的病人，可以加入脈優以帶來益處，脈優曾被加入到與thiazide類利尿劑、beta腎上腺素受體阻斷劑或者血管收縮素轉換酶抑制劑中一起使用。

2. 心絞痛

脈優適合用為慢性穩定性心絞痛的第一線治療用藥。脈優可以單獨使用，作為單一療法或者與其它抗心絞痛用藥合用。

禁忌

脈優禁用於對amlodipine、其它dihydropyridine類化合物或任何脈型劑過敏的病人。

注意事項

心絞痛增加

極少數病人，特別是那些罹患嚴重障礙性冠狀動脈疾病者，曾經在鈣離子通道阻斷劑療法開始時或者劑量增加之時導致了心絞痛頻率、持續期間及嚴重性增加。這種結果的機制尚不清楚。

流出障礙(大動脈狹窄)

脈優使用於有固定性左心室流出障礙(大動脈狹窄)的病人時應特別注意。

使用於鬱血性心臟病人：一般而言，鈣離子通道阻斷劑使用於心臟病人時均應特別注意。在一項安慰劑對照，包含1153名服用穩定劑量利尿劑、毛地黃以及血管收縮素轉換酶抑制劑的NYHA III或IV級心臟病人的臨床試驗中，曾給予這些病人脈優(每天5毫克-10毫克)，而後繼續至少進行6個月，平均值為14個月。在存活率或心臟發病率(定義為致命性心律不整、急性心肌梗塞或者心臟惡化或所導致入院)方面並無整體性的不良影響。脈優曾在4個8-12週的研究中，對NYHA III級心臟病人進行安慰劑的比較，總共包含了697位病人。在這些研究中依據運動耐性、NYHA分級、症狀或左心室射出分率的測量結果並無證據顯示心臟病會更糟。

停用Beta-阻斷劑：脈優並非Beta-阻斷劑，因此對於突然停用Beta-阻斷劑並無法提供保護；任何Beta-阻斷劑的停用都應該利用逐漸減低劑量來達到。

使用於肝功能受損病人：尚未有適當的研究建立出肝功能不全病人以及建議劑量之間的關係。少數輕度至中度肝功能受損的病人給予5毫克單一劑量後，amlodipine的半衰期會延長。肝功能檢驗值惡化的情況可能發生，因此這些病人服用脈優時應該特別注意，並且應該進行仔細的監測。可能需要較低的起始劑量(參見用法用量)。

使用於腎功能受損病人：amlodipine會大量地代謝成為不活性代謝物，10%是以原型藥物由尿液排泄出去。Amlodipine血漿濃度的改變與腎臟的損傷程度無相關性，所以這些腎功能受損病人可以使用正常劑量。Amlodipine無法被透析。

周邊水腫：輕度至中度周邊水腫是臨床試驗中最常見的不良事件(參見不良反應一節)。周邊水腫的發生率與劑量有關，其頻率範圍在5毫克至10毫克劑量範圍間

是9.0至10.8%，應該特別注意左心室功能失常嚴重(惡化)時所產生結果以及這種周邊水腫之間的差異。

懷孕中使用

分級C

鈣離子通道阻斷劑有可能使得母體血壓過低而導致胎兒缺氧，因此除了預期效益比胎兒風險還高時，孕婦不應使用本藥物。

脈優對人類懷孕或授乳的安全性尚未確立。在動物的生殖試驗中，大鼠口服高達18毫克/公斤體重劑量的amlodipine(總基)時，並未對繁殖力產生影響；而大鼠(18毫克/公斤體重劑量)及兔子(10毫克/公斤體重劑量)亦未產生致畸胎。大鼠在臨盆時或接近期時給予amlodipine(10毫克/公斤體重劑量)，相當於7毫克/公斤體重)會使懷孕期加長、死胎增加以及新生兒存活率降低。

授乳中使用

人體使用經驗表明amlodipine可分泌至人乳中。在31名發生妊娠高血壓的授乳女性中，施用amlodipine (初始劑量為每天一次每次5毫克)後，乳汁與血漿中amlodipine濃度比中位數為0.85。該劑量會視需要做相應調整，平均每日劑量及依體重校正後的每日劑量分別為6毫克和98.7微克/公斤。估計經由乳汁進入嬰兒體內的amlodipine每日劑量約為4.17微克/公斤。

利用脈優進行治療時應停止授乳。

使用於兒童

對於兒童的安全性及效果尚未確立。

使用於老年人

老年人(65歲)對amlodipine的清除率會下降而使曲線下面積(AUC)上升。在臨床試驗中，老年人的不良反應發生率比年輕族群(<65歲)還要高出6%。不良反應包括了水腫、肌肉痠痛及暈眩。老年人使用脈優時應特別小心。

致癌性: amlodipine的致癌性尚未完全確立。大鼠口服高達2.5毫克/公斤體重劑量的amlodipine時，並未引發任何腫瘤。此劑量能讓血漿中amlodipine的濃度達到相似於服用臨床劑量時的血漿中濃度。

藥物交互作用

脈優可以安全地與thiazide類利尿劑、beta阻斷劑、血管收縮素轉換酵素抑制劑、長效硝酸鹽、舌下硝化甘油、非固醇抗發炎藥、抗生素以及降血糖藥物等一起使用。

某些研究顯示共同服用脈優與毛地黃不會改變健康個體的血液中毛地黃濃度或者毛地黃清除率，與cimetidine共同服用時不會影響amlodipine的藥物動力學，與warfarin共同服用時不會改變warfarin對凝血酶素的反應時間。

利用人類血漿進行的體外研究顯示amlodipine對於受試藥物(毛地黃、phenytoin、warfarin或indomethacin)的蛋白結合率沒有影響。

Simvastatin

Amlodipine 多次劑量與simvastatin併用，和simvastatin單獨使用相較，會使simvastatin濃度增高。當病人目前已在服用amlodipine時，應閱讀simvastatin的產品資訊以選擇適當的劑量。

葡萄柚汁

葡萄柚汁已知會抑制細胞色素P450系統，因此會影響像鈣離子阻斷劑藥物的藥物動力學，所以不建議amlodipine與葡萄柚或葡萄柚汁併用，因為某些病人的生體可用率會增加進而增加血壓降低的作用。

CYP3A4抑制劑

服用CYP3A4抑制劑erythromycin的年輕病人與服用diltiazem的老年病人在併用amlodipine時會造成amlodipine的血中濃度增高。目前其臨床相關性尚未確定。目前無法排除強效CYP3A4抑制劑(如: ketoconazole, itraconazole, niconavir)可能亦會使amlodipine的血漿濃度增高，且增加的程度較diltiazem的效用強。故amlodipine與CYP3A4抑制劑併用時應小心。

Clarithromycin

Clarithromycin 是一種 CYP3A4 抑制劑。服用 clarithromycin 的病人在併用 amlodipine 時，低血壓的風險會增高。Amlodipine 與 clarithromycin 併用時，建議密切觀察病人。

CYP3A4 誘導劑

目前尚無 CYP3A4 誘導劑對 amlodipine 影響的資料。與 CYP3A4 誘導劑 (如：rifampicin, Hypericum perforatum (St John's Wort)) 併用可能會導致 amlodipine 的血中濃度降低。Amlodipine 與 CYP3A4 誘導劑併用時應小心。

鋁鎂 (制酸劑)

鋁鎂制酸劑與單一劑量的 amlodipine 併用，對 amlodipine 的藥物動力學沒有顯著影響。

Sildenafil

16 位原發性高血壓病人服用 100 毫克 sildenafil，對 amlodipine 的藥物動力學不會有顯著影響。當 amlodipine 與 sildenafil 併用時，兩者藥品會獨立地產生個別降血壓作用。

Atorvastatin

多次劑量 amlodipine 10 毫克與 atorvastatin 80 毫克併用，對 atorvastatin 穩定狀態的藥物動力學不會有顯著影響。

Ethanol (alcohol)

單一與多重劑量 amlodipine 10 毫克不會顯著影響 ethanol 的藥物動力學。

Cyclosporin

除了腎臟移植的病人之外，健康受試者或其他族群，目前尚未進行 cyclosporin 與 amlodipine 的藥物交互作用試驗。許多腎臟移植病人的試驗顯示，amlodipine 併用 cyclosporin 會影響 cyclosporin 的波谷濃度，且應考慮對腎臟移植並使用 amlodipine 的病人監測 cyclosporin 濃度。

Tacrolimus

與 amlodipine 併用，血中 tacrolimus 血中濃度有增高的風險。為避免 tacrolimus 的毒性，對使用 tacrolimus 治療的病人同時投予 amlodipine 時，需要監測 tacrolimus 血中濃度，必要時應適當調整 tacrolimus 劑量。

Rapamycin (mTOR) 抑制劑的機轉標靶

mTOR 抑制劑，例如 sirolimus、temsirolimus 和 everolimus 為 CYP3A 受質。

Amlodipine 為弱效 CYP3A 抑制劑，併用 mTOR 抑制劑和 amlodipine 可能會使

mTOR 抑制劑的暴露量增加。

不良反應

脈優曾在世界各國於臨床試驗中經由 11,000 以上名病人評估為安全的。

一般而言，利用高達每日 10 毫克的脈優進行治療時依然有良好的耐受性。利用脈優進行治療時所報告出的大部分不良反應都是輕至中度的。在有些組的臨床試驗中，直接將劑量高達 10 毫克的脈優 (n=1730) 與安慰劑 (n=1250) 相較時，由於不良反應而須停用脈優的病人僅有 1.5%，而且與安慰劑 (約 1%) 相比時並沒有顯著的差異。利用脈優進行治療時，實驗室常規檢驗並未產生臨床明顯的變化，在血鈣、血糖、總三酸甘油酯、總膽固醇、高密度脂蛋白膽固醇、尿酸、中尿酸素、血中肌酸酐或者肝功能測試方面都沒有相關聯的臨床變化。

最常見的不良反應是頭痛及水腫，與劑量相關的不良反應發生率 (%) 如下：

不良反應	2.5 毫克 (n=275)	5.0 毫克 (n=296)	10.0 毫克 (n=268)	安慰劑 (n=520)
水腫	1.8	3.0	10.8	0.6
暈眩	1.1	3.4	3.4	1.5
潮紅	0.7	1.4	2.6	0.0
心悸	0.7	1.4	4.5	0.6

在安慰劑對照性臨床試驗中，所產生的不良反應並非確實與劑量相關而且發生率大於 1.0% 者包括下列：

不良反應	脈優 (%) (n=1730)	安慰劑 (%) (n=1250)
頭痛	7.3	7.8
		安慰劑對照性研究
		10

疲勞	4.5	2.8
噁心	2.9	1.9
腹痛	1.6	0.3
嗜睡	1.4	0.6

下列是對照性臨床試驗、開放性試驗條件之下或者是市場經驗中，原因不確定而自發生率<1%及>0.1%的不良反應；在此列出這些不良反應以告知醫生其可能性關係：

血液與淋巴系統障礙：白血病、血小板缺乏。

心臟障礙：心跳過快。

耳與迷路障礙：耳鳴、頭暈。

眼睛障礙：視覺異常、結膜炎、視損、眼痛。

胃腸道障礙：排便習慣改變、便秘、腹瀉、口乾、消化不良*、吞嚥困難、脹氣、牙齦腫、腮腺炎、嘔吐。

一般性障礙與投予位置：衰弱*、不適、疼痛、僵硬、口渴。

免疫系統障礙：過敏。

調查：體重增加。

代謝與營養障礙：厭食、血糖增加。

肌肉骨骼與結締組織障礙：關節痛、關節炎、肌肉絞痛*、肌肉痛。

神經系統障礙：感覺遲鈍、感覺異常、末梢神經病變、姿勢性僵硬、暈厥、震顫。

精神障礙：夢境異常、焦慮、人格解體、震擊、失眠、心情改變、神經質。

腎臟與泌尿系統障礙：排尿異常、頻尿、夜尿。

生殖系統與乳房障礙：女樣男乳、性功能障礙(男性*與女性)。

11

呼吸、胸膈與縱膈障礙：呼吸困難*、流鼻血。

皮膚及皮下組織障礙：禿頭、血管水腫、搔癢*、紫癍病、發疹*、發疹性紅斑、發疹性黑丘疹、盜汗。

血管障礙：臉部發熱發紅、低血壓、周邊組織缺血、姿勢性低血壓、血管炎。

* 在安慰劑對照性實驗中，小於1%病人發生這些不良反應，但是在所有多重劑量的研究中其發生率介於1%及2%。

下列不良反應發生小於0.1%的病人上：心臟衰竭、脈搏不規則、心臟期外收縮、皮膚變色、蕁麻疹、皮膚乾燥、脫毛、皮膚炎、多樣性皮膚發紅、肌肉無力、抽搐、運動失調、張力性亢進、偏頭痛、皮膚發冷及滑膩、冷淡、焦慮、健忘、胃炎、食慾上升、軟便、咳嗽、鼻炎、排尿困難、多尿、嗅覺異常、味覺變調、視覺調節異常、乾眼症以及體重增加。

和其他鈣離子阻斷劑一樣，下列副作用很少發生，也無法與曾在疾病的自然史區分開來：心肌梗塞、心室不整(包括心跳緩慢、心室心跳過速與心房顫動)與胸痛。

偶爾會有肝炎、黃疸及肝酵素上升(大部分與膽固醇沉澱病一致產生)的上市後報告，曾有一些與使用amlodipine有關的病例是嚴重到需要住院，但是大部分病列的發病原因不確定。

曾有與使用amlodipine有關的維體外症候群的上市後報告。

慢性阻塞性肺炎、良好代償性心衰竭、周邊血管疾病、糖尿病以及血脂值不正常的病人都曾安全地使用過脈脈。

用法用量

本藥須由醫師處方使用

對於高血壓及心絞痛，通常起始劑量為每日2.5毫克至5毫克，可以依據個別病人的治療結果將劑量增加至最大10毫克。

12

小體型、脆弱或老年病人，或者肝功能不足病人必須從每日2.5毫克開始，而且可以將此劑量的脈脈加入至其它正使用中的降血壓治療藥物中。

劑量應該依據個別病人的需要而調整。一般而言，每次的劑量調整應在 7 至 14 天後進行，好讓醫生能完整評估病人對每種劑量的治療結果。如果病人可以更密集地加以評估，而且有臨床需求時，劑量調整可以加快進行。關於劑量及不良反應的資訊請參見不良反應。

與其他抗高血壓藥物及/或抗心絞痛藥物併用：

脈脈會安全地與thiazide類利尿劑、血管收縮素轉換酶抑制劑、beta阻斷劑、長效硝酸鹽及/或舌下硝化甘油等一起使用。

當脈脈與 thiazide 類利尿劑、血管收縮素轉換酶抑制劑、beta 阻斷劑、長效硝酸鹽及/或舌下硝化甘油等一起使用時，不須進行劑量調整。

藥物過量

目前資料顯示服藥過量時會引起過度的末梢血管擴張與顯著低血壓以及反射性心跳過速。任何鈣離子阻斷劑過量時皆可能發生心率不整。服藥過量 1-5 小時內會出現低血壓與心跳緩慢。即使治療，低血壓可能持續超過 24 小時。心律障礙曾有案例持續至 7 天。曾有案例報導發生顯著且持續全身性低血壓，到包括休克死亡。

企鵝性藥物過量的報告包括一位病人吞服 250 毫克藥物後無症狀產生並且未住院；另一位(120 毫克)則有住院，進行了洗胃並且保持在正常血壓；第三位(105 毫克)則有住院並且產生低血壓(90/50 毫米汞柱)，經過增加血漿後血壓恢復正常。一位 15 歲女孩服用 amlodipine 140 毫克併服 10 粒 mefenamic acid 膠囊與一位 63 歲女性服用 amlodipine 70 毫克併服未知量 oxazepam 而致死。曾被記載的一例意外性藥物過量是 19 個月大的男性服用了 30 毫克脈脈(約為 2 毫克/公斤體重)，於急救室處理時生命跡象很穩定而且沒有低血壓現象，但是心跳速率高達每分鐘 180 下。

如果可能產生大劑量的藥物過量時，應給予密切的心臟及呼吸監測。經常測量血壓是必要的，一旦發生低血壓時，必須開始使用包含提高四肢以及置傾注入流體的心血管支援處理。如果低血壓現象對於這些傳統手段依然沒有反應時，則應仔

細考慮注射血管加壓素(例如 phenylephrine)，同時要評估循環體積以及排尿量。脈脈注射葡萄糖酸鈣可以幫助回償這種鈣離子流入受阻的效果。健康自願者在服用 amlodipine 10 毫克立即或 2 小時內服用活性碳會有意義地降低 amlodipine 的吸收。對意識尚未清醒或嘔吐反射失調的病人，應考慮在呼吸道或保護的情況 下，經由鼻胃管給予活性炭。因為血液動力不穩定與可能會立即發生中樞神經系統抑制，不建議使用 ipecac 催吐。由於 amlodipine 的蛋白結合率高，透析似乎沒什麼益處。洗胃在某些狀況中值得考慮。

外觀

脈脈為“翡翠”型的白色至灰白色錠劑，含有相當於 5 毫克活性 amlodipine 錠劑的 amlodipine 苯磺酸鹽。這些錠劑在其中一面有刻痕及“AML 5”字樣，而另一面有“Pfizer”的字樣。

包裝

2-1000 粒盒裝

儲存條件

請貯存於 25°C 以下

版本: Australia 20170714-43

製造廠:

Pfizer Pharmaceuticals LLC
KM 1.9, Road 688, Vega Baja, Puerto Rico 00693

包裝廠:

Pfizer Manufacturing Deutschland GmbH
Betriebsstätte Freiburg, Mooswaldallee 1, D-79090, Freiburg, Germany
輝瑞醫藥股份有限公司/輝瑞大藥廠股份有限公司 販賣
臺北市信義區松仁路 100 號 42、43 樓/台北市信義區松仁路 100 號 42、43 樓