

內舒拿水溶性鼻用噴液劑

NASONEX® Aqueous Nasal Spray

S-CCDS-MK0887-NS-012013052017
MK0887-TWN-2017-015053

衛署藥輸字第022924號
本藥須由醫師處方使用

描述：可計量式的水性鼻腔噴霧劑 NASONEX，是一個含有 mometasone furoate 懸浮液，藉由手動幫浦噴霧裝置。

每次擠壓可計量式的幫浦 NASONEX 水性鼻腔噴霧劑可以提供約 100 mg 的 mometasone furoate 懸浮液，其中含有 mometasone furoate monohydrate 相當於 50 mcg 的 mometasone furoate。非活性成分：glycerin, microcrystalline cellulose, carboxymethylcellulose sodium, sodium citrate, citric acid, benzalkonium chloride 及 polysorbate 80。

作用：Mometasone furoate 是一種局部使用的醃皮質類固醇，在不會造成全身性作用的劑量下有局部的抗發炎作用。

臨床前藥理與毒性資料：臨床前試驗顯示，mometasone furoate 並沒有雄激素性、抗雄激素性、雌激素性與抗雌激素性作用，但正如其他的醃皮質類固醇，在動物試驗中給予口服高劑量 56 mg/kg/day 及 280 mg/kg/day 會造成抗子宮增厚活性及延遲陰道開口的作用。在細胞培養實驗中，mometasone furoate 比其他類固醇如 beclomethasone dipropionate (BDP)、betamethasone、hydrocortisone、dexamethasone 等，其抑制 IL-1, IL-6 和 TNF α 的合成及釋放之強度為至少 10 倍。Mometasone furoate 在 IC₅₀ 為 0.12 Nm 時抑制 IL-5 生成的強度亦為 BDP 及 betamethasone 的至少 6 倍。同時，在取自異位性病人的混合白血球中，mometasone furoate 抑制白三烯素(leukotriene)的生成亦比 BDP 強。

在臨床前試驗中，mometasone furoate 可顯著降低過敏發生部位的嗜酸性白血球(eosinophil)堆積，例如，在 IgE 引發的過敏大鼠，投以吸入性 mometasone furoate 劑量低至 13 mcg/kg 即可抑制 eosinophil 滲入到支氣管肺泡液、肺支氣管及細支氣管中。另外，mometasone furoate 可以減少淋巴球數量，以及過敏反應之前的細胞激素 IL-4 和 IL-5 mRNA 的量。

Mometasone furoate 主要抗過敏及抗發炎反應的機制來自於抑制免疫反應媒介分子的釋出。Mometasone furoate 可顯著抑制過敏病人白血球中白三烯素的釋放。另外，它也是人類 CD4⁺ T 細胞中 Th₂ 細胞激素 IL-4、IL-5 生成的強力抑制劑。

Mometasone furoate 在 mouse-lymphoma 分析和 salmonella/mammalian-microsome 生物分析法中不具致癌性。Mometasone furoate 對小鼠骨髓 erythrocyte-micronucleus 分析、大鼠骨髓 clastogenicity 分析、大鼠肝細胞非定期 DNA 合成(UDS)分析、小鼠分裂期的雄性生殖細胞 clastogenicity 分析、中國田鼠肺細胞染色體錯亂(chromosomal-aberration)分析皆為陰性反應。在中國田鼠卵巢細胞株中，非活化相(nonactivation phase)持續曝露(7.5 小時)在 mometasone furoate 具細胞毒性的劑量下，會引發劑量相關性的染色體錯亂增加，但大鼠肝細胞 S9 片段則無此現象。此一發現並不被認為是 mometasone furoate 顯著的毒性，因為 S9 相的染色體錯亂分析以及所有的體內試驗結果均為陰性。其他的皮質類固醇如 dexamethasone 在細胞毒性劑量下也曾觀察到 clastogenic 反應，但並不危害人體健康。

在生殖與發育的毒性試驗中，Segment I & III 期，mometasone furoate 劑量在 7.5 mcg/kg(人類吸入劑量的 2.6 倍)可被動物忍受。在 15 mcg/kg，妊娠延長、分娩延長、分娩困難及子代存活率下降、子代體重增加或減少皆曾發生。但生育力並不受影響。

如同其他的醃皮質類固醇，mometasone furoate 對啮齒類和兔子皆會致畸胎。致畸胎試驗是以口服、皮膚給藥及/或皮下注射投以大鼠、小鼠和兔子。大鼠皮膚給藥超過 600 mcg/kg 會發生臍帶脫出(umbilical hernia)，小鼠 180 mcg/kg 皮下注射會發生顎裂，兔子皮膚給藥超過 150 mcg/kg 曾發生膽囊發育不全、臍帶脫出以及前掌曲折。在這些致畸胎試驗中也曾出現母體體重增加不足，並影響大鼠、兔子和小鼠的胎兒生長(體重較輕及/或骨化作用延遲)，並在小鼠造成子代存活率下降。

Mometasone furoate 並沒有獨特的毒性作用報告。所有觀察到的效應皆為此類化合物典型的作用，也是醃皮質類固醇藥理作用加劇後的效應。

吸入的 mometasone furoate 潛在致癌性(以 CFC 氣化推動劑及界面活性劑)在劑量 0.25-2.0 mcg/kg 曾於小鼠及大鼠 24 個月試驗研究過，包括有些非腫瘤性損害，典型醃皮質類固醇相關作用被觀察到。無統計意義劑量反應關係在任何腫瘤被測得。

臨床藥理學：

藥動學特性：Mometasone furoate 作為鼻噴劑劑型，其血漿中的全身性生體可用率<1%，在所使用的敏感性檢定法之定量下限(LLOQ)為 0.25 pg/ml。Mometasone furoate 懸浮液只有少量可在胃腸道中被吸收，即使能被吞嚥並吸收的微量也會多經由首渡效應代謝，多數代謝物經由膽汁排除，少量由尿液排除。

藥效學特性：在以鼻過敏原刺激而進行的試驗中，本品在過敏反應早期或晚期均有抗發炎作用。此發炎反應的抑制相較於安慰劑之下，組織胺及嗜伊紅血球的活性降低，以及嗜伊紅血球、嗜中性球和上皮細胞附著蛋白(epithelial cell adhesion protein)的減少。

在鼻息肉臨床試驗，本品與安慰劑組比較，最終結果呈現改善充血、鼻息肉大小及嗅覺流失。

適應症：成人、青少年及二歲以上兒童之季節性或常年性過敏性鼻炎。

亦用於治療 18 歲及以上成年人輕度到中度鼻息肉之相關症狀。

用法：如果病人有中度或嚴重的季節性過敏性鼻炎症狀病史，建議在花粉季節開始前二至四個禮拜期間使用本品作預防性治療。

劑量以及給藥方式：

每一次擠壓可以噴出約 100 mg 的 mometasone furoate 懸浮液，其中含有 mometasone furoate monohydrate，相當於 50 mcg 的 mometasone furoate。在使用本品第一劑之前，將容器充分搖勻，並擠壓幫浦 10 次（直到得到均勻噴霧）。如果幫浦 14 天或 14 天以上未曾使用，請將幫浦重新擠壓 2 次，直到觀察到均勻噴霧。

使用前需充分振搖容器。

季節性或常年性過敏性鼻炎：

成人(包括年老病人)以及青少年：

一般預防及治療建議使用劑量，是一邊鼻腔使用兩個噴霧，每日一次(50 mcg/每次噴霧，總劑量 200 mcg)，一旦症狀得到控制，可降低劑量至每邊鼻腔噴一次(總劑量 100 mcg)就可以有效的維持。

如果病狀不能完全的被控制，則使用劑量可以增加至每日最大劑量，每一鼻腔 4 次噴霧(全部劑量是 400 mcg)，每日一次。同時建議症狀一旦受到控制，便降低使用劑量。

臨床上明顯地起始作用時間，出現在第一次劑量使用後的 12 小時之內。

二至十一歲兒童：

一般建議劑量為一邊鼻腔使用一個噴霧，每日一次(50 mcg/每次噴霧，總劑量 100 mcg)

輕度到中度鼻息肉：

18 歲及以上成年人(包括年老病人)：一般建議劑量為每次每一鼻腔 2 次噴霧，每天兩次(每天總劑量 400 mcg)；一旦症狀適當控制，建議劑量可減少到每一鼻腔 2 次，每天一次(每天總劑量 200 mcg)。

藥物交互作用：本品可與 loratadine 合併給藥，並不會影響 loratadine 及其主要代謝物的血漿中濃度。在這些研究中，即使所使用之檢定法的定量下限(LLOQ)到 50 pg/ml，mometasone furoate 在血漿濃度也沒有測到。二者的合併治療有良好的耐受性。

Mometasone furoate 由 CYP3A4 所代謝。

與 CYP3A4 強效抑制劑(例如 ketoconazole、itraconazole、clarithromycin、ritonavir、含 cobicistat 的產品)合併使用可能導致皮質類固醇(corticosteroids)的血漿濃度升高，並可能增加全身皮質類固醇副作用的風險。應考慮合併使用的益處與全身性皮質類固醇效應的潛在風險，在這種情況下，應監測患者的全身皮質類固醇副作用。

不良反應：

季節性或常年性過敏性鼻炎：

在成人及青少年的臨床研究中，與治療相關的局部副作用證據，包括頭痛(8%)、鼻腔出血(Epistaxis)(例如明顯地出血，帶血絲的黏液以及小血片(fleck))(8%)，咽頭炎(4%)，鼻腔灼傷(2%)，鼻腔刺激(2%)及鼻潰瘍(1%)，以上均是使用皮質類固醇鼻腔噴劑典型的觀察結果。

鼻腔出血通常是有限度且嚴重性屬輕微程度的，與安慰劑(5%)比較有較高的發生率，但與鼻腔給藥皮質類固醇組(可達 15%)比較則發生率相當或較低。

其他所有作用的發生率皆與安慰劑相當。

在兒童的使用，副作用發生率與安慰劑相當，分別為頭痛(3%)、鼻出血(6%)、鼻腔刺激(2%)、打噴嚏(2%)。

在很少的情況下，使用 mometasone furoate monohydrate 鼻內給藥後會發生立即性的過敏反應。在極少的情況下，曾有急性過敏以及血管水腫(angioedema)的報告。

味覺及嗅覺的干擾亦鮮少被報導。

鼻息肉：在病人治療鼻息肉時，不良反應的整體事件與安慰劑相當，並相似於過敏性鼻炎病人所觀察到的。

禁忌：對本品之任何成份產生過敏者。

注意事項：對於鼻腔黏膜局部感染且未經治療者，不應使用本品，因為皮質類固醇對於傷口癒合有抑制的作用，病人最近有鼻腔手術或外傷經驗者，不能使用鼻腔給藥皮質類固醇，須等到傷口癒合為止。經過 12 個月以本品治療後，沒有證據顯示會造成鼻腔黏膜萎縮，同時 mometasone furoate 會逆轉鼻腔黏膜的緊縮，使其達到組織學上的正常狀態，對於任何長期治療，病人使用本品超過幾個月或更長，必須定期檢查鼻腔黏膜可能的改變。如果有局部的鼻腔或喉部的黴菌感染發生，可能需要中止給藥或對症治療。持續性的鼻咽部刺激是一個中止本品的警訊。用於呼吸道活動性或靜止性的肺結核菌感染或未經治療的黴菌、細菌、全身性病毒感染或眼睛

的單純性疱疹，此類病人必須小心注意。

並無證據顯示長期使用，會導至下視丘 - 腦下垂體 - 腎上腺(HPA)軸線的抑制，然而對於從長期給予全身性的皮質類固醇病人轉為使用本品時，需特別小心注意。像這類使用全身性作用皮質類固醇的病人，藥物的移除可能會造成腎上腺素的不足達數月之久，直至HPA 軸線的功能完全恢復。如果這類病人表現出腎上腺素不足的症狀及徵候群，則全身性皮質類固醇給藥必須再繼續，併用其他模式的治療，並確立適當的偵測。

在對照組控制的兒童臨床試驗中，病人接受本品每日 100 mcg 持續一年，並未觀察到生長速率減緩的現象。

尚未實驗在兒童及低於 18 歲青少年治療鼻息肉之安全性及有效性。

從全身性的皮質類固醇轉而使用本品時，有些病人除了鼻腔症候群的解除外，會有移除全身性皮質類固醇而導致的症候群(如關節及/或肌肉痛、疲倦，以及初期的沮喪)，此時需要鼓勵繼續治療。同時這種給藥方式的轉移，並不能遮蔽先前全身性皮質類固醇治療所抑制之已存在的過敏狀況，例如過敏性結膜炎及濕疹。

接受皮質類固醇的病人可能免疫能力會被抑制，必須警告病人暴露在特定感染疾病(如水痘、麻疹)的危險性，以及類似暴露發生後獲得醫療建議的重要性。

使用鼻內噴霧劑皮質類固醇後，立刻造成鼻中膈膜穿孔或增加眼內壓的報告非常稀少。

懷孕及哺乳期使用：並沒有對懷孕婦女作適當或良好控制的研究報告。

正如使用其他鼻腔皮質類固醇製劑一樣，懷孕婦女，授乳婦女或分娩期的婦女只有在評估過使用的利益勝於對母親，胎兒，新生兒的危險性後，才可以給予本品。

對於母親曾在懷孕期使用皮質類固醇的新生兒，必須小心地觀察是否有腎上腺功能不足。

過量：因為全身性生體可用率<1%(使用定量下限(LLOQ)為 0.25 pg/ml 的敏感性檢定法)，因此過量時不太需任何治療，只要小心觀察後重新給予適當的劑量即可。

包裝：每噴次 50 mcg 的 mometasone furoate，100 公撮以下瓶裝。

儲存：儲存於 25°C 以下，遠離熱源。不可冷凍。

放置於孩童不能取得之處。

廠名：Schering-Plough Labo N.V.

廠址：Industriepark, 30, B-2220, Heist-Op-Den-Berg, Belgium

藥商：美商默沙東藥廠股份有限公司台灣分公司

地址：台北市信義路五段 106 號 12 樓

使用說明

為達到最大的藥效及最低的併發症風險，必須正確使用 Nasonex。為使病人有最好的用藥順應性，在開始治療前應再次強調 Nasonex 的用法及用量。使用方法如下：

使用前充分搖動 Nasonex 藥瓶，並仔細閱讀使用方法，按照指引用藥。



1. 拔開防塵蓋(圖 A)。
2. 第一次使用時，以大拇指支撐瓶底，食指和中指壓住瓶身白色的頸部往下壓，以將幫浦引流(圖 B)。壓—放幫浦約 6~7 次，直到均勻的噴霧產生。此時噴霧幫浦已可使用。如果已有 14 天或更久未曾使用，下次使用前應重新引流。
3. 使用前應充分振搖容器。



4. 輕輕擤出鼻涕以清潔鼻孔。壓住一邊鼻孔。頭部向前微傾，持瓶身向上，小心將噴頭伸進鼻孔(圖 C)。
5. 以大拇指支撐瓶底，食指和中指壓住瓶身白色的頸部充分一次壓到底是一個噴劑量，噴完後自此鼻孔輕輕吸氣。
6. 另一邊鼻孔重覆上述動作。
7. 將防塵蓋蓋回。



請勿穿刺噴頭

清潔噴頭時，拔下防塵蓋，輕輕自白色頸部將噴頭拔起，與防塵蓋一起用冷水沖洗。待乾後將其裝回原位。