

施洛得

ISOBIDE

(Isosorbide 內服液劑)

儲存法：室溫保存(儘可能冷所保存)
使用期限：標示於瓶標籤、外箱

本藥須由醫師處方使用

【禁忌】(下列之患者請勿使用)

急性頭蓋內血腫之患者〔疑似急性頭蓋內血腫患者及不能確認有無頭蓋內血腫之存在，使用本劑時，由於腦壓，雖然一時止血但頭蓋內壓減少之同時開始再出血，因此，處理出血源，在無法確認是否有可能再出血之限度時，不要使用本劑。〕

*【成分、性狀】

主成分：本劑100mL中含有Isosorbide 70g。

賦形劑	Propyl P-hydroxybenzoate、D-Sorbitol、Perfume、Butyl P-hydroxybenzoate、Sodium Saccharin、Lactic acid、Water Purified
劑型	內服液劑
色	無色~淡黃褐色
味	起初有甜與酸味，後來稍有苦味
嗅覺	有芳香氣

【適應症】

利尿、降眼壓、梅尼爾氏病之改善。

【用法、用量】

以腦壓下降、眼壓下降及利尿為目的時，通常成人一日量70~140mL分2~3次口服。視症狀適宜增減之。Meniere's 病時，標準用量一日相當於體重1.5~2.0mL/kg，但在急性症狀惡化期或初開始治療之一星期內，可將劑量增至120mL/天。上述劑量分每日三次於餐後口服，而在使用一個月之後，則視症狀之改善酌減其劑量。必要時可用兩倍量冷水稀釋後口服。

**【使用上之注意】

1. 審慎使用(下列患者應審慎使用)

- (1) 脫水狀態之患者〔由於本劑之利尿作用，有使症狀惡化之可能〕。
- (2) 有難尿或腎機能障礙之患者〔由於本劑之利尿作用，有使症狀惡化之可能〕。
- (3) 有鬱血性心不全之患者〔因滲透壓利尿作用循環血液量增大，有使心臟增加負擔之可能〕。

2. 重要之基本的注意

由於用其他之利尿藥(Loop利尿藥)與Terfenadine 併用而有QT延長，引起室室性不整脈之報告，因此本劑使用中不能併用Terfenadine。又，本劑與Astemizol 併用時，有可能引起室室性不整脈、QT延長之可能，因此本劑使用中不能與Astemizol 併用。

3. 副作用

依據在日本取得許可時之臨床試驗，市售後之副作用頻率調查及有關 Meniere's 病效能追加時之臨床試驗之報告病例1,126例中，認定於83例(7.4%)有88件之副作用。其主要的有嘔氣16件(1.4%)，噁心13件(1.2%)，下痢13件(1.2%)，嘔吐11件(1.0%)等之消化器症狀。(效能追加時)

本項是包含由於無法算出之頻率而主動的報告之副作用。

	0.1~5%未滿	頻率不明
消化器	嘔氣、噁心、下痢、嘔吐、食慾不振	
精神神經系	失眠、頭痛	
過敏症		發疹、紅斑

長期連用：有可能引起電解質異常(頻率不明)。

如此副作用出現時應進行減量、停藥等適當之處置。當發疹、紅斑之副作用時應停止服用。

4. 給高齡者之服用

在一般高齡者生理機能正低落著，所以應注意減量等事宜。

5. 給孕婦、產婦、授乳婦等之服用

對於孕婦或有懷孕可能性的婦人，僅能在被判斷在治療上之有益性大於危險性時始可服用。〔尚未確定有關懷孕中服用之安全性。〕

【藥物動態】¹⁾

予健康人3名單次服用30mL Isobide，檢討Isosorbide之藥物動態。半減期(T_{1/2})為6.84±0.17小時，體內平均滯留時間(MRT)為10.68±0.80小時，分佈容積(V_d)為0.66±0.03ℓ/kg。又，在服用24小時後，服用量的約81%為未變化體從尿中排泄出來¹⁾。

【臨床成績】^{2~8)}

在日本國內之35個設施實施臨床試驗。

1. 對於腦腫瘍時之腦壓亢進認定其有效性²⁾。
2. 對於伴隨頭部外傷之腦壓亢進認定其有效性³⁾。
3. 對於青光眼之眼壓亢進有效率為有效以上54.8%(80眼/146眼)，稍微有效率以上82.2%(120眼/146眼)⁴⁾。
4. 從腎、尿道結石時之利尿，對於症狀改善(結石之移動)之有效率為有效以上51.2%(65/127)，稍微有效以上63.8%(81/127)⁵⁾。

在日本國內之17個設施實施了臨床試驗(包括二重盲檢及一般臨床)。

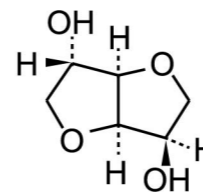
1. 對於Meniere's 病有效率為有效以上40.2%(86/214)，稍微有效以上66.8%(143/214)^{7~8)}。

【藥效藥理】^{9~12)}

1. 利尿作用
用狗作實驗，口服(1~2g/kg)後30分鐘尿量增大了。顯示Isosorbide是明確的利尿作用⁹⁾。
2. 腦壓下降作用
用狗作實驗，口服(3g/kg)後腦脊隨壓平均降低36%，於1~1.5小時後達到最低值。顯示Isosorbide之頭蓋內壓下降作用¹⁰⁾。
3. 眼壓下降作用
用家兔作實驗，口服(2g/kg)後眼壓在45分鐘後達到最低值。顯示Isosorbide之眼壓下降作用¹¹⁾。
4. 內淋巴壓下降作用
用水腫土撥鼠作實驗，頸動脈投與(1.6mL/kg(50v/v%))後內淋巴壓在5~10分鐘顯示幾乎接近0之低下。顯示Isosorbide之內淋巴壓下降作用¹²⁾。

**【關於有效成分理化學之知見】

一般名：Isosorbide
化學名：1,4：3,6-二氫-D-葡萄糖醇
分子式：C₆H₁₀O₄
分子量：146.14
構造式：



性狀：本品係白色之結晶或者塊狀，沒有氣味，或者是少許特異之氣味，味是苦的。
極易溶於水或甲醇，易溶於乙醇，難溶於乙醚。
本品有吸濕性。

【取用上之注意】

1. 應儘可能冷所保存。
2. 開封後應密栓。
3. 本劑依保存條件，雖可見到多少顏色之變化，但對藥效並無影響。

【包裝】

500mL 瓶、500mL × 6 瓶
20~30mL 鋁箔包、10~100 包/盒裝

【主要文獻】

- | | | | |
|-----------------------------------|----------------------------|------|-------------|
| 1)脇屋 義文 他 | : 病院藥學 | 22, | 145 (1996) |
| 2)長谷川 弘 他 | : 新瀉醫學會雜誌 | 82, | 11 (1968) |
| 3)明石 勝興 他 | : 新藥與臨床 | 17, | 887 (1968) |
| 4)行德 勝明 他 | : 眼科臨床醫報 | 62, | 25 (1968) |
| 5)大北 健逸 他 | : 診療與新藥 | 11, | 213 (1974) |
| 6)山崎 勤 他 | : 耳鼻與臨床 | 27, | 559 (1981) |
| 7)北原 正章 他 | : 藥理與治療 | 14, | 1055 (1986) |
| 8)北原 正章 他 | : 藥理與治療 | 15, | 2975 (1987) |
| 9)Shinaberger, J. H. <i>et al</i> | : J. Pharmacol. Exp. Ther. | 158, | 460 (1967) |
| 10)Wise, B. L. <i>et al</i> | : J. Neurosurg. | 25, | 183 (1966) |
| 11)Becker, B. <i>et al</i> | : Arch. Ophthalmol. | 78, | 147 (1967) |
| 12)松原 秀春 | : 藥理與治療 | 13, | 5087 (1985) |

製造廠：Kowa Company, Ltd.

Mohka Plant No.21-1, Matsuyama-Cho, Mohka, Tochigi, Japan

藥商：宜泰貿易有限公司
台北市重慶南路3段36巷12號