

荷商葛蘭素史克藥廠股份有限公司台灣分公司 書函

機關地址：10018 台北市忠孝西路一段 66 號 23 樓
 聯絡人：張恭銘 (02)2381-8866
 電子郵件信箱：kenny.x.chang@gsk.com

受文者：裕利股份有限公司/吉程股份有限公司/裕翔藥品股份有限公司

發文日期：中華民國 113 年 4 月 25 日
 發文字號：GSK 113058 號

主旨：通知本公司產品衛署藥輸字第 023792 號「驅異樂膜衣錠 5 毫克(Xyzal Film-Coated Tablets 5mg)」產品外盒仿單相關變更事宜，並請協助轉知各使用之醫療單位、中華民國藥師公會全國聯合會、社團法人台灣臨床藥學會及台灣年輕藥師協會。

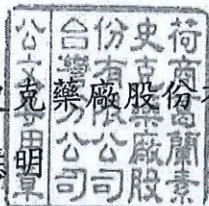
說明：

一、本產品產品外盒及仿單變更說明如下：

1. 更新外盒及仿單 GSK Logo
2. 仿單部分除依據食藥署仿單格式化規定要求移動段落及修改標題外，也另外更新下列安全性相關資訊：
 - A. 更新腎功能障礙相關參數(章節 3.1 用法用量及章節 4 禁忌處)
 - B. 加入操作機械能力注意事項(章節 5.3 操作機械能力)

二、敬請 貴單位協助轉知該產品仿單及外盒變更事宜，懇請繼續給予本公司支持為禱。

荷商葛蘭素史克藥廠股份有限公司台灣分公司
 負責人：余慧



驅異樂膜衣錠5毫克

Xyzal Film-Coated Tablets 5mg

衛署藥輸字第 023792 號
本藥須由醫師處方使用
廠商內部文件編號
NCDS08 (04 September 2022)

1 性狀

1.1 有效成分及含量
每錠含主成分 levocetirizine dihydrochloride 5毫克。

1.2 賦形劑

錠核:
Microcrystalline cellulose, Lactose monohydrate, Colloidal anhydrous silica, Magnesium stearate
藥衣:
Opadry® Y-1-7000 包含:
Hypromellose (E464), Titanium dioxide (E 171), Macrogol 400

1.3 劑型

膜衣錠
藥品外觀

白色至灰白色橢圓形膜衣錠，一面刻有Y字樣。

2 適應症

治療成人及六歲以上孩童因過敏性鼻炎、慢性蕁麻疹等所引起的各種過敏徵狀。
說明：包括持續性過敏性鼻炎所引起的各種過敏徵狀。

3 用法及用量

3.1 用法用量

本藥須由醫師處方使用。
服用時以水伴服吞入，飯前或飯後均可。建議每日單次服用。
• 成人及十二歲以上青少年：建議每日劑量為5毫克(一錠)。
• 老年病人：患有中度到嚴重腎功能障礙的老年病人，需調整其劑量，請參考下述有關“腎功能障礙病”之用量。
• 六歲至十二歲的孩童：建議每日劑量為5毫克(一錠)。六歲以下孩童尚不建議使用。
• 腎功能障礙病人：此類病人的服藥間隔應視其腎功能的狀況(eGFR、腎絲球過濾率)而做調整(如下表)。

腎功能障礙病人的劑量調整表：

腎功能狀況	eGFR (ml/min)	劑量、間隔時間
正常腎功能	≥90	每日一次
腎功能輕微下降	60 - <90	每日一次
腎功能中度下降	30 - <60	隔日一次
腎功能嚴重下降	15 - <30 (不需要透析)	每三天一次
腎疾末期(ESRD)	<15 (需要透析治療)	禁用

腎功能障礙的孩童病人，其使用劑量必須依據個別的腎臟清除率及體重做調整。目前無腎功能障礙孩童的數據資料。

- 肝功能障礙病人：毋需調整劑量。但若同時具肝功能障礙及腎功能障礙，則依照上表(腎功能障礙)調整劑量。
- 使用期間：

間歇性過敏性鼻炎(每週症狀發作少於四天，或每次症狀發作每年少於四週的過敏性鼻炎)應依疾病與其病史給予治療；症狀消失時可停止治療，復發時再予以治療。
持續性過敏性鼻炎(每週症狀發作多於四天，或每次症狀發作每年多於四週的過敏性鼻炎)建議可在週期間持續治療。
臨床上市已有使用 levocetirizine 至少達六個月的治療經驗。而 levocetirizine 的消旋物 cetirizine 的臨床使用經驗為：治療慢性蕁麻疹和慢性過敏性鼻炎可使用達一年。

4 禁忌

Levocetirizine 禁用於：

- 對 levocetirizine、cetirizine、hydroxyzine、piperazine 衍生物過敏，或對本藥中任何成分過敏者。
- 需要透析治療的末期腎臟疾病病人(eGFR < 15 ml/min)。

5 警語及注意事項

5.1 警語/注意事項

酒精

併用酒類時須特別小心(請見藥物交互作用)。

尿液滯留的風險

由於 levocetirizine 可能會增加尿液滯留的風險，具有尿液滯留誘發因子的病人(例如脊髓損傷、攝護腺肥大)必須謹慎使用本藥。

視力加劇的風險

由於 levocetirizine 可能會使癱瘓加劇，患有癱瘓和有抽搐風險的病人必須謹慎使用本藥。

皮膚過敏試驗反應

皮膚過敏試驗反應會被抗組織胺所抑制，因此在進行測試前需要有三天的藥品清除期(wash-out period)。

戒斷症狀

當停止治療時可能會發生癢癢，即使在開始使用 levocetirizine 治療之前不曾出現癢癢的症狀[參見副作用/不良反應]。症狀可能會自然消失。少數案例可能會較嚴重，並且需要充治療再開始使用本藥。重新開始使用本藥治療前，癢癢症狀必須先消除。

嬰兒及二歲以下幼兒

雖然有一些臨床使用於六個月至十二歲孩童的資料[參見副作用/不良反應]，然而這些資料並不足以證明 levocetirizine 可供嬰兒及二歲以下幼兒使用。因此不建議嬰兒及二歲以下幼兒使用 levocetirizine。

六歲以下孩童

由於服藥較不利於供六歲以下孩童調整劑量之用，建議使用孩童專用劑型。

賦形劑

乳糖：含乳糖成分，患有半乳糖不耐症、Lapp 乳糖酶缺乏症或葡萄糖糖-半乳糖吸收不良之罕見遺傳疾病病人應禁用本藥。
5.3 操作機械能力

由臨床試驗顯示，沒有證據可證明 levocetirizine 在建議劑量下會影響精神反應力、開車及操作機械能力。但有些病人服用 levocetirizine 後會產生嗜睡、疲勞和無力。因此若預期要開車、從事具危險性的活動、或操作機械時，必須要考量病人對本藥的反應。

5.5 其他注意事項

由於沒有相容性方面的研究，因此不可將本品與其他藥物混合使用。

6 特殊族群注意事項

6.1 懷孕

目前並無有限(少於300個懷孕案例)的孕婦使用 levocetirizine 的數據資料。然而，levocetirizine 的消旋物 cetirizine 則有大量(1000例以上)孕婦使用資料，顯示其無暫時性或胎兒/新生兒毒性。
如果必要的话，懷孕期間可以考慮使用 levocetirizine。
動物試驗顯示 levocetirizine 不會直接或間接對懷孕者、生長中的胚胎，及出生後的胎兒造成傷害。

6.2 哺乳

當處方本藥給授乳婦女使用時，須特別小心。

6.3 有生育能力的女性與男性

Cetirizine (levocetirizine 的消旋物)已顯示會被人體排泄，因此 levocetirizine 有可能會經由乳汁分泌。與 levocetirizine 有關的不良反應則可能會出現在哺餵母乳的嬰兒身上。



針對levocetirizine藥物交互作用的試驗(包括誘導CYP3A4的試驗)並未執行；然而由levocetirizine的消旋物cetirizine的試驗可證明本藥在臨床上不會與antipyrine、pseudoephedrine、cimetidine、ketoconazole、erythromycin、azithromycin、glipizide及diazepam引起交互作用。

Theophylline

在一個多劑量的臨床試驗中發現，與theophylline(每日一次400毫克)併服，會使cetirizine的清除率些微減低(16%)；然而theophylline的代謝與分布並未因與cetirizine併用而被影響。

Ritonavir

一項針對cetirizine與ritonavir的多劑量研究中發現，當一天服用兩次各600毫克的ritonavir和一次40毫克的cetirizine時，會增加cetirizine的暴露量約40%，ritonavir的分布與非消除也因與cetirizine併用而略微改變(-11%)。

食物不會降低levocetirizine的吸收程度，僅吸收速率稍減。

酒精類

對於較敏感的病人，若同時服用本藥(或cetirizine)及酒精類或中樞神經抑制劑，可能會導致加重等覺性降低和功效障礙。

8 副作用/不良反應

8.1 臨床重要副作用/不良反應

成人和12歲以上的青少年

在男性與女性年齡由12至71歲的治療試驗中顯示，levocetirizine 5毫克組中有15.1%的病人至少發生一種不良反應，而安慰劑組為11.3%。其中91.6%的不良反應屬於輕度到中度。

在治療試驗中，病人因為發生不良反應而退出試驗的比率，在levocetirizine 5毫克組為1.0%(9/935)，在安慰劑組則為1.8%(14/771)。這些臨床治療試驗的levocetirizine組共有935位受試者，建議劑量為5毫克。

下列不良反應乃依MedDRA身體系統器官分類(System Organ Class)及頻率來表示：

很常見(very common)：≥1/10

常見(common)：≥1/100至<1/10

少見(uncommon)：≥1/1000至<1/100

罕見(rare)：≥1/10000至<1/1000

極罕見(very rare)：<1/10000

未知(not known)：目前資料尚不足以評定

神經系統障礙

常見：頭痛、嗜睡

消化道

常見：口乾

少見：腹瀉

常見：便秘

常見：疲勞

少見：無力感

有關嗜睡的副作用，例如嗜睡、疲勞和無力，整體來看兩組的發生率在levocetirizine 5毫克組(8.1%)較安慰劑組(3.1%)略高。

兒童病人

針對年齡6到11個月大以及1到6歲間之兒童病人曾進行兩項安慰劑對照研究，共有159位受試者分別接受每日1.25毫克劑量的levocetirizine連續2週，以及每日兩次1.25毫克的levocetirizine。下列為接受levocetirizine而被通報的不良反應(發生率≥1%者)。

精神疾病

常見：睡眠障礙

神經系統障礙

常見：嗜睡

消化道

常見：腹瀉、便秘

少見：嘔吐

在針對年齡6到12歲之兒童進行的雙盲安慰劑對照研究中，共有243名兒童接受每日5毫克的levocetirizine，用藥時間從1週內至13週不等。下列為被通報的不良反應發生率。

神經系統障礙

常見：嗜睡

少見：頭痛

需注意，雖然在本段中有六個月至十二歲孩童的臨床資料，然而尚不足以證明本藥可供嬰兒及二歲以下幼兒使用。

8.3 上市後經驗

上市後資料

免疫系統：未知：過敏反應，包括anaphylaxis

- 代謝及營養障礙：未知：體重增加、增加食慾
- 精神方面：未知：攻擊性、躁動、幻覺、抑鬱、失眠、自殺意念、惡夢
- 神經系統：未知：驚厥、感覺異常、眩暈、昏厥、顫抖、味覺障礙
- 眼睛視力方面：未知：視覺障礙、視力模糊、眼球旋轉
- 耳朵與內耳迷路疾患：未知：暈眩
- 心臟方面：未知：心悸、心跳過速
- 呼吸系統、胸膈及縱膈膜：未知：呼吸困難
- 胃腸系統：未知：嘔心、嘔吐、腹瀉
- 肝膽系統：未知：肝炎、肝功能檢測異常
- 皮膚及皮下組織：未知：血管神經性水腫、關節痛
- 肌肉和結締組織：未知：肌肉痛、尿流滯留
- 腎臟及泌尿系統：未知：排尿困難、尿滯留
- 全身性疾患與投藥部位症狀：未知：水腫
- 停止服用levocetirizine後發生皮膚反應：曾有停藥後發生搔癢的通報(參見學語及注意事項)。

9 過量

症狀：若服用過量時，成人會有嗜睡的現象，孩童則會先興奮不安，而後伴隨困倦。

處理：對於levocetirizine過量並無特殊的解毒劑。在處理服用過量的案例時，建議以徵狀治療。血液透析(Hemodialysis)對levocetirizine的排除無效。

應依照臨床必要的治療或國內毒藥物諮詢中心的建議做進一步的處理。

10 藥理特性

10.1 作用機轉

Levocetirizine為cetirizine的R型鏡像異構物，是周邊H₁-受體的一種強效具選擇性拮抗劑。

針對受體結合的研究顯示，levocetirizine對人體H₁-受體有極高的親和力(K_i=3.2 nmol/l)，其比cetirizine與H₁-受體的親和力(K_i=6.3 nmol/l)還要高出2倍。Levocetirizine與H₁-受體離離所需半衰期為115±38分鐘。單一投藥後，levocetirizine與受體結合率於4小時及24小時分別可達90%及57%。

針對健康志願者的藥效學研究顯示，服用二分之一劑量的levocetirizine，在受試者的鼻腔及皮膚，均能達到與cetirizine相似的藥效活性。

10.2 藥效藥理特性

藥理分類：全身性使用的抗組織胺，為piperazine的一種衍生物。ATC代碼：R06A E09。

Levocetirizine的藥效學活性已於隨機分布的對照試驗中被研究：

一項比較levocetirizine 5毫克、desloratadine 5毫克及安慰劑對於組織胺引起的疹疹及發紅反應療效之研究，相較於安慰劑組與desloratadine組，levocetirizine的治療能夠顯著的降低疹疹及發紅反應的形成，在12小時為高峯期，並可持續達24小時(p<0.001)。

針對以安慰劑對照，在過敏原刺激室所進行的控制花粉誘發症狀之臨床研究顯示，levocetirizine 5毫克的起始作用時間為服藥後一小時。

體外研究(Boyden chamber及細胞分層技術)顯示，levocetirizine能透過皮膚及肺臟細胞，抑制leotaxin引起的嗜酸性細胞穿越內皮間的移動。

體內藥效實驗性研究(skin chamber技術)顯示，相較於安慰劑組，對於14位成人病人投予5毫克levocetirizine，經過花粉誘發反應後的最初6小時所表現的三項主要抑制作用為：抑制VCAM-1的釋放、調節血管的通透性、及降低嗜嗜酸性白血球的遷移。

10.3 臨床前安全性資料

根據傳統安全性藥理學、重複劑量毒性、生殖毒性、基因毒性及致癌性研究等非臨床性資料顯示，levocetirizine對於人體並無特別危險性。

11 藥物動力學特性

Levocetirizine的藥物動力學呈現個體間差異性低之線性低劑量與劑量時間影響的特性；藥物動力學則與其鏡像異構物或cetirizine的數據相同。在藥物的吸收及排泄期間，未曾發生過對掌性反轉(chiral inversion)的現象。

吸收

Levocetirizine經口服後，可被迅速及完全的吸收。成人於給藥後約0.9小時，可達血藥最高濃度。給藥兩天後可達體內濃度穩定狀態。單次劑量5毫克及重複給予每日5毫克的levocetirizine，體內血藥最高濃度分別為270 ng/ml及308 ng/ml。本藥的吸收程度與給藥劑量的劑量無關，且不受食物所影響，但是進食可能會導致藥物的血藥最高濃度降低且延遲藥物達血藥最高濃度的時間。

分布

目前並無levocetirizine在人體組織的分布及有關通過血腦屏障的資料。針對大鼠及狗所做的研究，levocetirizine在肝臟及腎臟中濃度分布最高，而在中樞神經系統內分布最低。Levocetirizine在人體內與血漿蛋白質結合率約為90%。體內分布非常有限，分佈體積約為0.4 l/kg。

代謝

Levocetirizine在人體內的代謝率小於投藥劑量的14%，因此推測基因多形性引起的差異或併服酵素抑制劑

對其影響甚微。本藥的代謝途徑包括苯環氧化作用 (aromatic oxidation)、N-及O-脫羧基作用 (N- and O-dealkylation) 及 taurin 結合作用 (taurine conjugation)。脫羧基作用的主要代謝產物為 CYP3A4，而苯環氧化作用則為多種及 (或) 未知的 CYP 異構體。口服 5 毫克 levocetirizine 後，在遠高於體內最高濃度下，levocetirizine 並不會對 CYP 異構體 1A2、2C9、2C19、2D6、2E1 及 3A4 的活力有所作用。由於 levocetirizine 的低代謝率及無抑制代謝的能力，不太會與其他成分產生藥物交互作用。

排泄

本藥於成人體內的血漿半衰期為 7.9 ± 1.9 小時。於小孩體內的血漿半衰期則更短。成人平均身體總清除率為 0.63 ml/min/kg 。Levocetirizine 及其代謝產物主要經由尿液排泄，平均約占給藥劑量的 85.4%。給藥劑量的 12.9% 經由糞便排泄。Levocetirizine 是以腎絲球過濾及腎小管主動分泌的方式排泄至尿液中。

特殊病人族群

兒童族群
針對 14 位年齡 6 到 11 歲，體重介於 20 到 40 公斤間的兒童，口服使用單劑 5 毫克 levocetirizine 的兒童藥物動力學研究，結果指出血中最高濃度 (C_{max}) 與曲線下面積 (AUC) 都比較在跨研究比較中健康成人受試者的數據高出大約 2 倍。平均血中最高濃度為 450 ng/ml ，達到時間平均為 1.2 小時。

兒童族群的體內總清除率較成人高出 30%，且排出半衰期較成人短少 24%。目前尚未針對未滿 6 歲的兒童進行藥物動力學研究。針對 323 位接受單劑或多劑 levocetirizine 1.25 毫克至 30 毫克不等的受試者 (181 位年齡 1 到 5 歲、18 位年齡 6 到 11 歲的兒童以及 124 位年齡 18 到 55 歲的成人)，進行回溯性族群藥物動力學分析。分析資料顯示，年齡 6 個月到 5 歲的兒童每日使用一次 1.25 毫克藥物後，被認為與成人每日使用一次 5 毫克藥物達到相似的血漿濃度結果。

【老年病人】
老年受試者的藥物動力學資料仍屬不足。9 位老年受試者 (65 到 74 歲) 在每日口服一次 30 毫克 levocetirizine 連續 6 天後，其體內總清除率較年輕成人低 33%。其總清除率與 cetirizine 的清除率已知與腎功能有關而與年齡無關。這項結果也適用於 levocetirizine，因為 levocetirizine 和 cetirizine 主要均是透過尿液排出體外。因此，老年病人應根據其腎功能狀況，調整 levocetirizine 的劑量。

腎功能障礙
Levocetirizine 的身體清除率與肌酐清除率相關。中度及嚴重腎功能障礙病人應視其肌酐清除率，調整服藥間隔。腎疾末期之無尿症病人，相較於正常受試者，藥物的身體總清除率約下降 80%。一般標準 4 小時的血流透析過程，可移除 levocetirizine 的量為低於 10%。

肝功能不全

目前尚未針對肝動力學不全的受試者進行 levocetirizine 藥物動力學檢測。針對慢性肝病病人 (肝細胞、膽汁鬱積和膽道性肝硬化) 給予單劑 10 或 20 毫克 cetirizine (levocetirizine 的鏡像化化合物) 後，顯示相較於健康受試者，半衰期清除率分別增加 50% 以及減少 40%。

其他病人特性

性別

針對 77 位病人 (40 位男性、37 位女性) 所做的藥物動力學結果，用以評估潛在的性別效應。女性的半衰期 (7.08 ± 1.72 小時) 比男性 (8.62 ± 1.84 小時) 稍短；然而，女性經體重校正後的口服清除率 (0.67 ± 0.16 毫升/分鐘/公斤) 顯示與男性相當 (0.59 ± 0.12 毫升/分鐘/公斤)。腎功能正常的男性與女性，適用相同的每日劑量與給藥間隔。

種族

目前尚未研究種族對 levocetirizine 的影響。Levocetirizine 主要係經由腎臟排出。在其鏡像化合物 cetirizine 的動力學中，並未觀察到與種族有關的差異。

12 臨床試驗資料

Levocetirizine 已經由數個以雙盲、安慰劑對照的臨床試驗證實其對於患有季節性過敏性鼻炎、常年性過敏性鼻炎或持續性過敏性鼻炎的成人病人之有效性及安全性。在一些試驗中顯示 levocetirizine 明顯改善過敏性鼻炎 (包括鼻塞) 的徵狀。

一項針對 551 位患有持續性過敏性鼻炎 (每星期有四次出現徵狀，持續至少四星期) 及對家塵蟎和花粉過敏的成年病人 (其中有 276 位以 levocetirizine 治療) 進行為期 6 個月的臨床試驗，證實 levocetirizine 5 毫克在臨床試驗上及統計上均明顯比安慰劑在整個試驗期間對於緩解過敏性鼻炎 (症狀總評分) 的效果為佳，且無藥效漸減性。在整個試驗期間，levocetirizine 明顯改善病人的生活品質。

一項以安慰劑對照，針對 166 位患有慢性原發性蕁麻疹病人的臨床試驗，其中 85 位服用安慰劑，81 位服用 levocetirizine 每日 5 毫克，為期六星期。其結果為與安慰劑比較，levocetirizine 組在第一個星期及在整個療程中，對於搔癢性原發性蕁麻疹，嚴重程度均顯著降低。同時，與安慰劑比較，levocetirizine 亦大幅改善與健康狀況相關的生活品質，此乃依據皮膚學生活品質量表 (Dermatology Life Quality Index) 所做的評估結果。

慢性原發性蕁麻疹乃為觀察蕁麻疹症狀的模式。由於組織胺的釋放為蕁麻疹的形成因素，levocetirizine 除了可緩解慢性原發性蕁麻疹，對於提供蕁麻疹其他症狀的改善亦有預期效果。

心電圖結果顯示，levocetirizine 不會對 QT 間隔時間造成相關影響。

藥物動力學/藥效學關係：

組織胺引起的皮膚反應與血漿濃度並無直接關係。

兒童族群

Levocetirizine 錠劑使用於六歲至十二歲孩童的安全性和有效性，分別由兩個以安慰劑對照的臨床試驗執行，其中一個試驗乃針對季節性過敏性鼻炎，另一個針對常年性過敏性鼻炎。在這兩個臨床試驗中均可見 levocetirizine 明顯改善症狀及增加與健康狀況相關的生活品質。

13 包裝及儲存

13.1 包裝
10, 100 錠鋁箔盒裝。

13.2 效期

五年。請於包裝上所標示的有效期限內使用。

13.3 儲存條件

請保存於 30°C 以下乾燥的場所，並置於幼兒不易取得處。

製造廠

製造廠：UCB Farchim S.A.	Z.I. De Planchy, Chemin de Croix Blanche 10, CH-1630 Bulle, Switzerland
包裝廠：Aesica Pharmaceuticals S.r.l.	Via Praglia 15, 10044 Pianezza, Italy
二級包裝廠 (委託貼標及置入仿單)：	桃園市大園區和平里 1 新開和路 91 號
裕利股份有限公司	

藥商

符商 葛蘭素史克藥廠股份有限公司	台北市中正區忠孝西路一段 66 號 23 樓
台灣分公司	



驅異樂膜衣錠5毫克

Xyzal Film-Coated Tablets 5mg

衛署藥輸字第 023792 號
本藥須由醫師處方使用
廠商內部文件編號
NCDS#2128 (4/04) ~~Sanmeibao January 2022~~

- 1 性狀
 - 1.1 有效成分及含量
每錠含至成分 levocetirizine dihydrochloride 5 毫克。
 - 1.2 賦形劑
錠劑：
Microcrystalline cellulose, Lactose monohydrate, Colloidal anhydrous silica, Magnesium stearate
膠衣：
Opadry® Y-1-7000 包衣；
Hypromellose (E464), Titanium dioxide (E 171), Macrogol 400
 - 1.3 劑型
膜衣錠
 - 1.4 藥品外觀
白色至灰白色橢圓形膜衣錠，一面刻有 Y 字樣。
- 2 適應症
治療成人及六歲以上孩童因過敏性鼻炎、慢性鼻竇炎等所引起的各種過敏症狀。
- 3 用法及用量
 - 3.1 用法用量
本藥須由醫師處方使用。
服用時以水吞服吞入，飯前或飯後均可。建議每日單次服用。
成人及十二歲以上青少年：建議每日劑量為 5 毫克(一次)。
老年病人：患有中度到嚴重腎功能障礙的老年病人，需調整其劑量，請參考下述有關「腎功能障礙病人」之用量。
六歲至十二歲之孩童：建議每日劑量為 5 毫克(一次)，六歲以下孩童尚不建議使用。
腎功能障礙病人：此類病人的監理應視其腎功能的狀況(GFR)而做調整(如下表)，~~老年病人及患有中度到嚴重腎功能障礙的老年病人，需調整其劑量，請參考下述有關「腎功能障礙病人」之用量。~~

格式化調整至: 15 公分, 出血: 1.42 字元, 項目行距: 1 間隔: 1 + 對齊: 0 公分 + 間隔: 0.5 公分

$$Cl_{cr} = \frac{[140 - age(years)] \times weight (kg)}{72 \times serum\ creatinine (mg/dl)} \quad \text{for women}$$

腎功能障礙病人的劑量調整表：

腎功能狀況	Creatinine clearance (ml/min)	劑量、間隔時間
正常腎功能	>90/80	每日一次
腎功能輕度下降	60 - <90/50	每日一次
腎功能中度下降	30 - <60/40	隔日一次
腎功能嚴重下降	15 - <30 (不需透析)	每三至一次
腎深末期-透析病人(ESRD)	<15 (不需透析)	禁用

腎功能障礙的孩童病人，其使用劑量必須依據個別的腎臟清除率及體重做調整，目前無腎功能障礙

童的數據資料。
肝對能藥賦病人：每需調整劑量，但若同時肝腎功能障礙及腎功能障礙，則依照上表(腎功能障礙)調
使用劑量。
劑量性過敏性鼻炎(每週症狀每作少於四次，或每次症狀每作每少於四週的過敏性鼻炎)應依循病發
其病發後予治療；症狀消失時可停止治療，症狀時再予以治療。
持續性過敏性鼻炎(每週症狀每作多於四次，或每次症狀每作每多於四週的過敏性鼻炎)建議可在過
敏期開始治療。
臨床上市已有使用 levocetirizine 至少達六個月的治療經驗，而 levocetirizine 的清除物 cetirizine 的臨床使用
經驗為：治療慢性鼻敏感及慢性過敏性鼻炎可使用達一年。

4 禁忌

- Levocetirizine 禁用於：
- 對 levocetirizine、cetirizine、hydroxyzine、piperazine 衍生物過敏，或對本藥中任何成分過敏者。
 - 患有最新治療的**嚴重過敏反應及嚴重低血壓病人**($epinephrine\ clearance\ GFR < 15-40\ ml/min$)。

5 警語及注意事項

5.1 警語及注意事項

酒精
服用時須特別小心(請見藥物交互作用)。
由於 levocetirizine 可能會增加尿酸保留的風險，具有尿酸濃度保留因素的病人(例如骨關節痛、攝護腺肥大)必須謹慎使用本藥。
由於 levocetirizine 可能會使反應增加，患有癲癇和有抽搐風險的病人必須謹慎使用本藥。
皮膚過敏測試
皮膚過敏測試應在服用本藥前進行，因此在進行測試前需有 3 天的藥品清除期(wash-out period)。
戒斷性症狀
當停止治療時可能會發生戒斷，即使在開始使用 levocetirizine 治療之前不曾出現戒斷的症狀(多見於作用不足及反復)，症狀可能會自然消失，少數病例可能需先消除。
本藥治療前，據藥理學必須先消除。
嬰兒至十二歲以下幼兒
雖然有一些臨床使用於六個月至十二歲孩童的資料(多見於作用不足及反復)，然而這些資料不足以證明 levocetirizine 可安全用於二歲以下幼兒使用。因此不建議嬰兒及二歲以下幼兒使用 levocetirizine。
由於不致致效不利於六歲以下孩童調整劑量之用，建議使用孩童專用劑型。

乳糖
乳糖對成人乳糖成分，患有半乳糖不耐症、Lapp 乳糖酶缺乏症或腸胃腸半乳糖吸收不良之罕見遺傳疾病病人應慎用本藥。
5.5 操作機械能力
由臨床試驗顯示，沒有證據可證明 levocetirizine 在建議劑量下會影響精神反應力。然而，levocetirizine 的清除物 cetirizine 則有少量(1000 納克以上)的藥物作用資料，顯示其無嗜睡或胎兒新生兒毒性。
如果治療顯示 levocetirizine 不會直接或間接對懷孕者、生長中的胚胎，或出生後的胎兒造成傷害。
6.2 哺乳
當處方本藥給與乳母婦女服用時，須特別小心。
Cetirizine (levo) 的藥物作用資料已顯示會被人類乳汁分泌，因此 levocetirizine 有可能經由乳汁分泌，與 levocetirizine 有關的不良反應則可能出現於直接或間接對乳母者、生長中的胚胎，或出生後的胎兒造成傷害。

由於沒有相容性方面的研究，因此不可將本品與其他藥物混合使用。

6 特殊族群注意事項

6.1 懷孕
目前並無高劑量(少於 300 個母孕藥物)的孕婦服用 levocetirizine 的數據資料。然而，levocetirizine 的清除物 cetirizine 則有少量(1000 納克以上)的藥物作用資料，顯示其無嗜睡或胎兒新生兒毒性。
如果治療顯示 levocetirizine 不會直接或間接對懷孕者、生長中的胚胎，或出生後的胎兒造成傷害。

6.2 哺乳
當處方本藥給與乳母婦女服用時，須特別小心。
Cetirizine (levo) 的藥物作用資料已顯示會被人類乳汁分泌，因此 levocetirizine 有可能經由乳汁分泌，與 levocetirizine 有關的不良反應則可能出現於直接或間接對乳母者、生長中的胚胎，或出生後的胎兒造成傷害。

6.3 有生育能力的女性與男性
生型



levocetirizine在肝臟及腎臟中濃度分佈最高，而在中樞神經系統內分佈最低。Levocetirizine在人體內與血漿蛋白結合率均為90%。體內分佈非常廣泛，分佈體積均為0.4 l/kg。

Levocetirizine在人體內的代謝率小於脫羧劑量的14%，因此推測基因多形性引起的差異或能顯著抑制劑對其影響等。本藥的代謝途徑包括採集其七作用(automatic oxidation) N-及O-脫羧作用(N- and O-dealkylation)及與β-葡萄糖苷酶作用(taurine conjugation)。脫羧作用的主要代謝產物為levocetirizine。levocetirizine在人體內與β-葡萄糖苷酶作用(taurine conjugation)的代謝產物為levocetirizine。levocetirizine在人體內與β-葡萄糖苷酶作用(taurine conjugation)的代謝產物為levocetirizine。levocetirizine在人體內與β-葡萄糖苷酶作用(taurine conjugation)的代謝產物為levocetirizine。

排注
本藥於成人體內的血漿半衰期為7.9 ± 1.9小時。於小童體內的血漿半衰期則更短。成人平均身體總清除率為0.63 ml/min/kg。Levocetirizine及其代謝產物主要經由尿液排出，平均約占給藥劑量的85.4%。給藥劑量的12.9%經由糞便排出。Levocetirizine是以腎臟排泄過量及腎小管主動分泌的方式排泄至尿液中。

特殊病人族群
兒童族群
針對14位年齡6到11歲，體重介於20到40公斤的兒童，口服使用單劑5毫克levocetirizine的兒童藥物動力學研究，結果指出血中最高濃度(C_{max})與曲線下面積(AUC)都低於在研究比較中能聽成人受試者的數據高出大約2倍。平均血中最高濃度為450ng/ml，達到時間平均為1.2小時。

兒童族群的體內總清除率較成人高出30%，且指出半衰期較成人短少24%。目前尚未針對未滿6歲的兒童進行藥物動力學研究。針對323位接受單劑或多劑levocetirizine 1.25毫克至50毫克的成人，進行劑量與藥物動力學分析。分析資料顯示，年齡6到11歲的兒童每日使用一次1.25毫克藥物後，推測為與成人每日使用一次5毫克藥物達到相似的血漿濃度及持效。

【老年病人】
老年受試者之藥物動力學資料尚屬不足。9位老年受試者(65到74歲)在每日口服一次30毫克levocetirizine連續6天後，其體內總清除率較年輕人低35%。其總清除率與levocetirizine的清除率已見顯著性開關與年齡無關。這項結果也適用於levocetirizine與levocetirizine的清除率。Levocetirizine的清除率若開關與年齡無關，老年病人應根據其腎功能狀況，調整levocetirizine的劑量。

肝功能不全
目前尚未研究肝功能不全對levocetirizine的影響。中區及嚴重腎功能障礙病人應視其肌肌群清除率，調整levocetirizine的劑量。腎功能不全對levocetirizine的影響尚不明確。目前尚未研究肝功能不全對levocetirizine的影響。中區及嚴重腎功能障礙病人應視其肌肌群清除率，調整levocetirizine的劑量。腎功能不全對levocetirizine的影響尚不明確。目前尚未研究肝功能不全對levocetirizine的影響。中區及嚴重腎功能障礙病人應視其肌肌群清除率，調整levocetirizine的劑量。腎功能不全對levocetirizine的影響尚不明確。

其他病人特征
針對77位成人(40位男性、37位女性)所做的藥物動力學結果，用以評估其在性別別別。女性的半衰期(7.08 ± 1.72小時)比男性(8.62 ± 1.84小時)稍短；然而，女性的體重較男性正後的口服清除率(0.67 ± 0.16 升/分鐘/公斤)顯示與男性相當(0.59 ± 0.12 升/分鐘/公斤)。腎功能正常的男性與女性，服用相同的每日劑量與給藥間隔。

目前尚未研究腎臟對levocetirizine的影響。Levocetirizine主要是經由腎臟排出。在其緩慢化合物 cetirizine 的動力學中，並未觀察到與腎臟有關的差異。

臨床試驗資料
Levocetirizine已由數個以雙盲、安慰劑對照的臨床試驗證實其對於患有季節性過敏性鼻炎、常年性過敏性鼻炎及特應性過敏性鼻炎的成人病人之有效性及安全性。在一些試驗中顯示levocetirizine明顯改善過敏性鼻炎(包括鼻癢)的症狀。

一項針對551位患有特應性過敏性鼻炎(每星期有四次出現症狀，持續至少四星期)及對受塵蟎和花粉過敏的成人病人(其中有276位以levocetirizine治療)進行四個月臨床試驗。levocetirizine 5毫克在臨床試驗中，對於改善的嚴重度均顯著降低。同時，顯示levocetirizine亦大幅改善與皮膚狀況相關的皮膚症狀。此外，此項試驗亦顯示levocetirizine對改善皮膚症狀(如皮膚瘙癢)亦具有顯著效果。

一項以安慰劑對照、針對166位患有慢性皮膚性濕疹病人的臨床試驗，其中85位服用安慰劑，81位服用levocetirizine每日5毫克，為期六星期。其結果為與安慰劑比較，levocetirizine組在第一星期或在整個試驗期中，對於改善的嚴重度均顯著降低。同時，顯示levocetirizine亦大幅改善與皮膚狀況相關的皮膚症狀。此外，此項試驗亦顯示levocetirizine對改善皮膚症狀(如皮膚瘙癢)亦具有顯著效果。

慢性皮膚性濕疹患者應注意，對於改善皮膚症狀(如皮膚瘙癢)亦具有顯著效果。此外，此項試驗亦顯示levocetirizine對改善皮膚症狀(如皮膚瘙癢)亦具有顯著效果。

心電圖結果顯示，levocetirizine不會對QT間隔時間造成相關影響。藥物動力學與藥效學關係：
組織胺引起的皮膚反應與血漿濃度並無直接關係。

兒童族群
Levocetirizine適用於六歲至十二歲兒童的安全性均有致性，分別由兩個以安慰劑對照的臨床試驗執行，其中一個試驗乃針對季節性過敏性鼻炎，另一個針對常年性過敏性鼻炎。在這些臨床試驗中均可見levocetirizine明顯改善症狀及增加其健康狀況相關的生活品質。

13 包裝及儲存
13.1 包裝
10、100錠鋁箔盒裝。

13.2 效期
五年。請於包裝上所標示的有效期限內使用。

13.3 儲存條件
請保存於30°C以下乾燥的場所，並置於幼兒不易取得處。

製造廠
製造廠：UCB Farchim S.A.
地址：Z.I. De Planchy, Chemin de Croix Blanche 10, CH-1630 Bulle, Switzerland

包裝廠：Aestica Pharmaceuticals S.r.l.
地址：Via Prugini 15, 10044 Pinerazzo, Italy
一級包裝廠(委託包裝及運入仿單)：桃園市大園區和平里1期開和路91號
裕利股份有限公司

總經銷
裕利股份有限公司
地址：台北市中正區忠孝西路一段66號23樓



