

"美時"

歇靜®錠 10 公絲

Nonsed® Tablets 10mg "LOTUS"

衛署藥製字第 043659 號 G-7029

「成份」:每錠含主成份

cetirizine dihydrochloride 10mg

「藥理」:

cetirizine 是抗組織胺藥物 hydroxyzine 的代謝物，屬 H₁-受體拮抗劑，作用乃選擇性抑制末梢之 H₁-受體，與其他 H₁-拮抗劑不同之處乃具有 carboxylic acid 作用，此亦與其選擇性及獨特藥動學性質有關。在 H₁-拮抗效果比擬其他製劑的同時，其動物試驗顯示較低的抗膽鹼與抗血清緊素作用；實驗室中試驗亦顯示對 H₁-受體以外的受體鍵結親和力極弱。大鼠之放射線攝影研究顯示本藥穿透至腦內之濃度極低。小鼠之體內試驗亦顯示本藥全身性吸收後並無明顯占據腦內之 H₁-受體。

「藥動學」:

本藥口服吸收迅速，投與 10mg 之最高血中濃度約為 300ng/ml，到達最高血中濃度時間約一小時，食物會稍延緩其吸收，然不影響生體可用率與曲線下面積，血漿蛋白結合率 93%，分佈體積 0.45L/kg(顯示相當程度之血管外分佈)，血漿排除半生期約八小時(多次劑量亦不改變)，超過 5-20mg 建議劑量時，血中濃度與劑量呈正比。與其他抗組織胺相反，本藥代謝程度較低，給藥劑量約 60%以原型由尿液排出，此致較高生體可用率與較低之個體內一個體間血中濃度差異。C₁₄ 追蹤顯示血漿之放射線活性多與原型藥相關。本藥僅確認有一種人體代謝物，即末端碳氧甲基之氧化去烷基化合物，其不具抗組織胺活性。腎功能不良者本藥廓清率會減少，然肌氨酸清除率低於 30-50ml/min 時，則少有再進一步變化。血液透析不影響本藥之血中濃度，洗腎病人本藥之血漿排除半生期約二十小時，因而血漿線下面積會提高約三倍。老年人本藥之廓清率會降低，但僅與肌氨酸清除率之減少呈比例，半生期可能延長至 12 小時，而血中濃度監測並無蓄積現象。

「適應症」:

季節性鼻炎、結合膜炎、過敏性鼻炎、蕁麻疹、過敏性搔癢等過敏現象。

「禁忌症」:

對本藥或其原型化合物 hydroxyzine 過敏者禁用。

「注意事項」:

1. 職能損害方面:本藥對智能、運動功能、入睡期並無影響，然仍有中樞神經系統副作用;如嗜眠被報告，駕車或操作危險機器仍應注意。

2. FDA 懷孕分級 B: 鼠兔試驗在投與人類極大建議劑量之 40, 180 與 216 倍時並無致畸性。本藥僅在明確臨床需要下才應用於孕婦。

3. 授乳期:狗之試驗有 3%劑量會分泌至乳汁;人類情況未知，仍不建議授乳婦使用。

4. 老年人:65 歲以上老年人對本藥耐受性仍佳。

5. 肝功能指數偶有升高案例(短期用藥者約 1.6%，長期用藥半年者約 4.4%)，通常多為 SGPT 升高，而此現象為可逆。臨床上並無黃疸或肝炎之證據，然既有肝病者仍宜小心使用。在雄性小白鼠兩年期的致癌性研究發現，長期餵食 16mg/kg(約為成人每日口服最大劑量之 6 倍)cetirizine，會造成良性肝腫瘤增加的趨勢;然而在 4mg/kg(約為成人每日口服最大劑量之 2 倍)的劑量下，則無此現象。

6. 藥物交互作用:(1)臨床上與低劑量的 theophylline、azithromycin、pseudoephedine、ketoconazole 以及 erythromycin 併用，並無明顯的交互作用產生。僅於 theophylline 400mg 之劑量下，對 cetirizine 的清除率造成輕微的減少;在更大劑量 theophylline 時，可能會有更大的影響。(2)與 diazepam 或酒精併用並無明顯加成作用，但仍須避免併用中樞神經抑制劑或酒類。(3)與 cimetidine 並無交互作用。

「副作用」:

口乾(5.8%)、疲倦 4.7%)、嗜眠 5mg:11%;10mg:14%)等，極少有因副作用停藥者。其他與安慰劑發生機率相似(≥0.4%)而曾被報告之副作用，包括：食慾增加、頭疼心悸、味覺改變、視力不佳、腹痛、胃腸不適、腹瀉、少尿、眩暈、失眠、緊張、支氣管痙攣、咳嗽、咽炎等。

「過量之處理」：

本藥之過量徵候：在成人僅呈現嗜睡；在幼兒初期則呈現不安靜、興奮，隨後亦呈現嗜睡。本藥無特定拮抗劑，如有急性服用過量時，前數小時內可以洗胃，加以症狀與支持療法，同時須考量意外發生時有無其他藥物同時服用。透析對本藥之排除無效。本藥在小白鼠與大鼠之口服急性最小致死劑量分別為 237mg/kg(約為成人每日口服最大劑量之 95 倍)及 562mg/kg(約為成人每日口服最大劑量之 270 倍)。在啮齒類動物，其急性毒性主要發生於中樞神經系統；而慢性毒性則主要發生於肝臟。

「劑量」：

成人及 6 歲以上孩童：起始劑量每日 5-10mg 單次給藥，最大劑量每日 20mg。

3 至 6 歲孩童：起始劑量每日 5mg 單次給藥或分 2 次給藥。

老年人由最低劑量每日 5mg 起始給藥；肌氨酸清除率降低、血液透析患者及肝功能不良者也須由每日 5mg 起始給藥。

「貯存」：

室溫(15-30°C)下貯存



「包裝」：

2-1000 錠瓶裝，2-1000 錠鋁箔盒裝

GMP 藥廠

美時化學製藥股份有限公司

南投縣南投市南崗工業區成功一路 30 號

經銷商：友瑞股份有限公司

台北市復興南路一段 200 號 7 樓之 1

TEL: (02)2778-5188