

Desora Desora Desora Desora

“優生” 治敏樂 膜衣錠 5毫克 Desora F.C. Tablets 5 mg "Yu Sheng"

衛署藥製字第051197號
GMP G-10753

說明：

每顆Desora Tablet 含 5.0 毫克的 desloratadine。

作用：依文獻記載

Desloratadine 為無鎮靜作用、長效型的組織胺拮抗劑、對全身週邊組織的H1接受體有高選擇性的拮抗作用。此外desloratadine被證實有抗過敏、抗組織胺、以及抗發炎的作用。在許多體外試驗(主要是來自於人類的細胞)與人體內試驗中顯示, desloratadine除了有抗組織胺作用外, 另具有抗過敏、和抗發炎的作用。這些實驗顯示desloratadine能抑制許多誘發和增進持續性過敏性炎症反應的物質, 它可抑制的物質及反應如下:

- 促炎反應之介質的釋放, 包括: IL-4, IL-6, IL-8, IL-13
- 重要促炎反應之化學素的釋放, 例如 RANTES (活化後可調節, 正常T細胞的表現與分泌)
- 藉活化多形核嗜中性白血球產生之過氧化的陰離子
- 嗜伊性紅血球的黏著性和趨化性
- 黏著分子的表現, 例如 P-selection
- 經 IgE 媒介的組織胺、前列腺素 (PGD2) 和 leukotriene (LTC4) 之釋放
- 在動物模式中, 急性過敏性支氣管收縮反應和過敏性咳嗽。

臨床前毒理學：依文獻記載

Desloratadine 是 loratadine 主要的有效代謝產物。非臨床研究證實, desloratadine 和 loratadine 在可比較的劑量下, 在其藥物毒性上沒有定性或定量的差別。

根據非臨床資料顯示, 在 desloratadine 的傳統研究中針對安全性藥理學、重複劑量毒性、遺傳毒性及生殖毒性, 並未發現對人體有特殊的危害; 研究亦證實 loratadine 無致癌之危險性。

臨床藥理學：依文獻記載

藥效學

口服後, 因為 desloratadine 不會進入中樞神經系統, 因此, 這個藥物會選擇性地只阻斷週邊組織的組織胺 H1-接受體。

在一個多重劑量的臨床試驗中, 每日服用最高到20毫克的 desloratadine 共14天, 對心臟血管的功能沒有發現有統計或臨床上的影響。在一項臨床藥理學的試驗中, 每日服用 desloratadine 45毫克(相當於常用臨床劑量的九倍)共10天, 也並沒有出現 QT 峰間距延長現象。Desloratadine 不會通過中樞神經系統。每日服用建議劑量5毫克或安慰劑, 兩者相比較, 其睡眠狀況並沒有差別。許多每日服用7.5毫克的臨床試驗中, 精神運動(心理性肌肉運動)測驗的結果也並沒有改變。服用單次劑量desloratadine 5 毫克對於飛行表現的標準評估不會造成影響、包括加重主觀的睡意或影響飛行相關的任務。

與多重劑量的 ketoconazole、erythromycin、azithromycin、fluoxetine 與 cimetidine 藥物交互作用之臨床試驗中, desloratadine 血中濃度的改變不具臨床意義。在許多臨床藥理試驗, 與酒精併服並不會增加酒精引起的行為失能或昏睡。從精神運動的測試結果發現, 投與 desloratadine 和安慰劑兩組間, 單獨用藥物或與酒精同服時並沒有明顯差異。

對於過敏性鼻炎患者, desloratadine 能有效緩解諸多症狀長達24小時, 如: 打噴嚏、流鼻涕及鼻子瘙癢、鼻充血/鼻塞及眼部瘙癢、流淚及眼部發紅及上顎部瘙癢。

除了季節性、常年性等已建立分類的過敏性鼻炎, 依據症狀的持續時間可以選擇性地再分類為間歇性過敏性鼻炎和持續性過敏性鼻炎。間歇性過敏性鼻炎的定義為症狀的存在時間每星期少於四天或少於四個星期。持續性過敏性鼻炎的定義為症狀的存在時間每星期多於四天或多於四個星期。在兩項為期4週、針對有季節性過敏性鼻炎及氣喘患者所進行的試驗結果顯示, desloratadine 可有效減輕季節性過敏性鼻炎及氣喘的症狀, 並減少 beta 作用劑的用量且對 FEV1 無不良反應。在不減低肺功能下改善症狀, 均足以證明對季節性過敏性鼻炎並伴有輕至中度氣喘患者投予desloratadine 的安全性。

不考慮其病原學、由於病理學基礎的相似, 以慢性原發性蕁麻疹作為蕁麻疹症狀之一種臨床模式來研究, 預期較容易招收慢性病患。因為在所有類型的蕁麻疹疾病中, 組織胺的釋出是一個重要因素, 所以除了慢性原發性蕁麻疹之外, desloratadine 還能有效緩解其他蕁麻疹的症狀, 而作為臨床治療準則上的建議。

於慢性原發性蕁麻疹(CIU)患者所進行的試驗中, 本品最快能在開始治療1天之內有效緩解瘙癢, 並減少蕁麻疹的面積及數量。且每一項試驗發現, 24小時的給藥間隔皆可持續藥效。從降低睡眠及日常活動干擾的評估發現, 亦可改善睡眠及日常功能。透過鼻眼結膜炎相關的生活品質問卷總分得知, 本品能有效減輕季節性過敏性鼻炎的負擔, 最大的改善範圍於症狀所限制的實際問題及日常活動。

藥物動力學

在服用 desloratadine 30分鐘內, 即可測得血中濃度, 並且吸收良好, 大約3小時可達最高血中濃度; 半衰期約27小時。藥物在體內的蓄積程度和它的半衰期(約27小時)及每天一次的給藥頻率有一致的相關性; 生體可用率在5毫克至20毫克的劑量範圍內與劑量成正比。

Desloratadine 與血漿蛋白有中等程度(83%-87%)的結合, 而臨床無證據顯示連續14天每天服用一次(5毫克至20毫克)後體內會有藥物蓄積。

尚未區別出負責代謝的酵素, 因此無法完全排除本品與其他藥物的交互作用。由CYP3A4及CYP2D6的特定抑制劑的活體試驗顯示; 這些酵素對 desloratadine 的代謝並不重要。本品不會抑制 CYP3A4或CYP2D6, 也不是P-糖蛋白的受質或抑制劑。

在使用7.5毫克desloratadine單一劑量試驗中, 食物(高脂、高熱量的早餐)不影響藥物分佈; 而另一研究發現, 葡萄柚汁亦不影響藥物的分佈。

適應症：

過敏性鼻炎(常年性及季節性)引起的相關症狀, 緩解成人及12歲以上兒童之慢性蕁麻疹相關症狀。

說明：

本品用於緩解過敏性鼻炎引起的相關症狀, 如: 打噴嚏、流鼻涕及鼻子瘙癢、鼻充血/鼻塞、眼部瘙癢、流淚及眼部發紅, 上顎部瘙癢及咳嗽。及用於緩解蕁麻疹相關症狀, 以改善瘙癢症狀, 並減少蕁麻疹面積及數目。

用法與用量：

成人及12歲以上的兒童: 每日一次, 每日一顆 desloratadine 5毫克膜衣錠。可空腹或隨餐口服使用。間歇性過敏性鼻炎(症狀的存在時間每星期少於四天或少於四個星期)應根據評估病患的病史來治療。治療應在症狀緩解後停止, 若症狀又發生再重新開始治療。持續性過敏性鼻炎(症狀的存在時間每星期多於四天或多於四個星期)在病患曝露於過敏原期間建議持續治療。腎或肝功能損傷之成人病患, 依據藥物動力學資料建議起始劑量為每二天一顆 desloratadine 5毫克膜衣錠。尚無研究資料說明腎或肝功能損傷之兒童病患的建議劑量。

本藥須由醫師處方使用。

藥物交互作用：依文獻記載

在許多臨床試驗中, 沒有發現有與 desloratadine 相關的交互作用發生(可參考藥效學部份)。葡萄柚汁不會影響本品的分佈, 且和酒精一起服用時, 不會加強酒精的行為失能作用(可參考藥效學部份)。

不良反應：依文獻記載

在針對包括過敏性鼻炎及慢性原發性蕁麻疹在內的適應症之臨床試驗中, 使用每日 5mg desloratadine 的建議劑量下, 患者的副作用發生率較服用安慰劑者高出3%。較安慰劑組常發生的副作用為疲倦(1.2%)、口乾(0.8%)及頭痛(0.6%)。

Desloratadine 上市後有極少數的下列案例報告: 過敏反應(包括過敏反應及皮疹)、心跳過速、心悸、精神運動性活動過度、癲癇、肝臟酵素升高、肝炎及膽紅素升高。依行政院衛生署食品藥物管理局100年1月11日函FDA藥字第0991415782號辦理, 加註暈眩(dizziness)及皮疹(rash)。

禁忌：依文獻記載

對本品有效成份或賦形劑會產生過敏反應者均不適合投與使用。

警語：依文獻記載

12歲以下兒童使用 desloratadine 的有效性與安全性, 尚未建立。

對開車與操作機械能力之影響：依文獻記載

沒有發現對開車及對操作機械能力會產生影響。(可參考藥效學部份)

懷孕與授乳婦的使用：依文獻記載

投與高於人類臨床建議劑量34倍之desloratadine, 發現對老鼠的受孕能力並沒有整體性的影響。

在動物試驗中投與desloratadine, 沒有發現會有致畸胎性與致基因突變性的情形。(可參考臨床前安全性部份)。因為沒有懷孕時期使用desloratadine之臨床數據, 所以懷孕婦女使用desloratadine的安全性尚未被建立。除非潛在效益高於潛在風險, 否則不建議懷孕婦女使用desloratadine。Desloratadine會分泌至母乳中, 因此不建議使用於授乳婦女。

藥物過量資訊：依文獻記載

發生服藥過量時, 標準的處置方法是先移除尚未被吸收之有效成份, 接著用症狀療法與支持療法。根據一項以成人及青少年為對象的多重劑量臨床試驗, 服用最高達45毫克(臨床劑量的9倍)的desloratadine, 並未發生臨床上的作用。血液透析法不能移除 desloratadine, 而腹膜透析法是否能移除則尚未可知。

貯存方法: 貯存於攝氏溫度25度以下, 避免過度潮濕的環境。請放在兒童拿不到之處。

包裝: 2-1000錠鋁箔盒裝, 塑膠瓶裝。

賦形劑: 錠劑本身:

DI-TAB, Avicel 102, Starch, Lactose(Super Tab 11SD), Talc, Mag. Stearate
膜衣部分:
Kollicoat IR, Talc, Titanium Dioxide, Indigo Carmine Blue Aluminum Lake



優生製藥廠股份有限公司
台中市南屯區工業區21路14號

MM 201511