

# 宏恩藥訊

108 年 10月號

## Country Hospital Drug Bulletin

發行人：沈國樑 出版：台北宏恩綜合醫院藥劑科 網址：www.country.org.tw  
總編輯：朱紀洪 地址：台北市仁愛路四段 61 號 電話：(02)2771-3161  
主編：邵志輝 e 址：country\_pharm@country.com.tw  
副主編：邱聖友 編輯：邱聖友

### 新藥介紹－BELVIQ® F.C. Tablets 10mg

邱聖友藥師

#### 成份：

Lorcaserin hydrochloride hemihydrate

#### 中文名稱：

沛麗婷膜衣錠 10 毫克

#### 劑型和含量：

本品為藍色圓形膜衣錠，錠劑一面刻字凹痕標記為A，另一面為10。每錠BELVIQ F.C. Tablets 含 Lorcaserin hydrochloride 10mg。

#### 適應症：

BELVIQ 是血清素5-HT<sub>2C</sub> 受體致效劑，對成人身體質量指數(BMI)過高者於飲食和運動控制後之長期體重輔助管理。適用之身體質量指數為：(1) BMI  $\geq$  30 kg/m<sup>2</sup> 或 (2) BMI  $\geq$  27 kg/m<sup>2</sup> 且有一項與體重相關之疾病 (例如：高血壓、血脂異常或第二型糖尿病)。

#### 作用機轉：

Lorcaserin 被認為是透過選擇性活化作用位於腦部下視丘負責控制食慾減退的原嗎啡黑色素皮質神經元上的5-HT<sub>2C</sub> receptor，以增加飽足感並降低食物消耗。惟目前還不知道其確切的作用機轉。

#### 藥物動力學：

吸收：

Lorcaserin 從胃腸道吸收，並在口服給藥後1.5~2 小時後達到最高血中濃度。Lorcaserin 的絕對生體可用率尚未被確定。每日兩次給藥持續3 天後達到穩定血中濃度，大約70%藥物蓄積於體內。

**食物影響：**12 位成年之志願受試者（6 男6 女），在禁食狀態和食用高脂肪（佔約50%的膳食總熱量）高卡路里（大約800-1000 卡路里）餐的不同條件下，分別口服單劑量10 毫克的BELVIQ。結果顯示，BELVIQ 受到食物影響，其最高血中濃度(Cmax)約增加9%，暴露量（AUC）約增加5%，Tmax 約延遲1小時。由於影響不顯著，故BELVIQ與食物併用，或不與食物併用皆可。

#### **分佈：**

Lorcaserin 會分佈到人類的腦脊髓液和中樞神經系統。約有70%的Lorcaserin HCl 會與人血漿蛋白結合。

#### **代謝：**

Lorcaserin 主要是經由肝臟中多個酵素途徑代謝，口服BELVIQ 後，血中的主要代謝產物是Lorcaserin sulfamate(M1)，M1的Cmax 約為Lorcaserin Cmax 之 1 到 5 倍。N-carbamoyl glucuronide lorcaserin (M5)是尿中的主要代謝產物、M1 則是尿中的次要代謝產物，尿液中代謝物的量約佔口服劑量的3%。由尿中排出的其他少量代謝產物為氧化代謝產物的glucuronide或sulfate conjugates。主要代謝產物對於血清素receptor是無藥理活性的。

#### **排泄：**

Lorcaserin 主要是經由肝臟代謝，而代謝物會經由尿液排泄。在人類質量平衡臨床試驗中，健康人攝取放射性Lorcaserin 後，94.5%的放射性物質可以被回收，其中在尿液和糞便之回收量分別為92.3%及2.2%。Lorcaserin 的排除半衰期約為11-12 小時。

#### **用法用量：**

建議劑量為一天兩次，早、晚各服用一錠，不可超過建議劑量。BELVIQ 可單獨服用，亦可與食物併服。使用達12 週時，需進行療效的評估，如果體重減少未超過5%，則建議停止服用BELVIQ。

#### **不良反應：**

有關重要的不良反應，如血清素症候群(Serotonin Syndrome)或精神病藥物惡性症候群(Neuroleptic Malignant Syndrome)、心臟瓣膜疾病、認知損傷、精神疾病、低血糖、心跳速率降低、血液檢查數值改變、泌乳素升高等。在非糖尿病患者中，

與安慰劑相比，使用BELVIQ 最常見的不良反應（大於5%，較安慰劑更常發生）為頭痛、頭暈、乏力、噁心、口乾、便秘等。在糖尿病患者中，最常見的不良反應為低血糖、頭痛、背痛、咳嗽、乏力。

### **禁忌症：**

- (1) 懷孕婦女禁用BELVIQ。
- (2) 對本藥品過敏者。對活性成分或任何賦形劑過敏。目前或過去曾經發生靜脈

### **懷孕用藥分類：X**

懷孕期間禁用BELVIQ，因為減重對於孕婦沒有任何潛在的益處，並可能對胎兒造成傷害。臨床前之動物試驗結果顯示，對懷孕後期的大鼠投與Lorcaserin，將會導致其後代持續維持較低的體重直到成年。如果患者在服用此藥期間發現懷孕，應告知懷孕患者，減重對於胎兒的潛在危害。

### **授乳婦女：**

目前尚不清楚BELVIQ 是否會分泌到人類乳汁中，因為許多藥物都會被分泌到乳汁中，是否終止哺乳或停用藥物，需考慮到藥物對母親的重要性再做決定。

### **兒童使用：**

BELVIQ 在18歲以下兒童的安全性和有效性尚未建立，不建議使用在兒科患者。

### **老年人使用：**

在BELVIQ 臨床試驗中，共有135 位（2.5%）受試者之年齡高於等於65 歲，但人數尚不足以確定老年人與年輕人是否具有不同的藥物反應。但是有一些老年人使用BELVIQ 後發現更有效果，這是不能排除的。由於老年患者有較高的腎功能損傷機率，老年人使用BELVIQ 前，基本上應先了解其腎功能是否正常。老年患者如腎功能正常，則無須調整劑量。

### **腎損傷：**

如為輕度的腎功能損傷，則無須調整BELVIQ 劑量；如為中度的腎功能損傷，則必需謹慎使用BELVIQ。不建議重度腎功能損傷或末期腎病患者使用BELVIQ。

### **肝損傷：**

如為輕度的肝功能損傷(Child-Pugh score 5-6)，或中度的肝功能損傷(Child-Pugh

score 7-9) ，則無須調整BELVIQ 劑量。目前尚未研究重度肝功能損傷對Lorcaserin 的影響，故此類患者須謹慎使用。

### 注意事項：

基於BELVIQ 的作用機轉和理論上有發生血清素症候群的潛在可能，應特別小心併用其他會影響血清素作用途徑之藥物，包括但不限於：triptans、單胺氧化酶抑製劑（包括linezolid，一種抗生素，可逆的非選擇性單胺氧化酶抑製劑）、選擇性血清素再回收抑製劑（SSRIs）、選擇性血清素正腎上腺素再回收抑製劑（SNRIs）、dextromethorphan、三環抗憂鬱藥(TCAs)、bupropion、鋰劑、tramadol、tryptophan 和聖約翰草。

BELVIQ 與其他血清素或抗多巴胺藥物併用的安全性尚未被系統性的評估及建立，包括精神病藥物、影響血清素的藥物或MAOIs。如果在臨床上，BELVIQ 必須併用會影響血清素神經傳遞物質系統之藥物，建議應極端小心，並仔細觀察病人，特別是在治療開始初期和增加劑量之時。如果BELVIQ 併用任何血清素相關藥物或抗多巴胺藥物時，包括治療精神病的藥物，發生上述不良反應事件，應立即停藥，並開始給予支持性的症狀治療。

### 參考資料：

1. Belviq 仿單

2. 藥品查詢系統

<https://www.rxlist.com/belviq-drug.htm>

3. "*BELVIQ (lorcaserin hydrochloride) tablet [Eisai, Inc]*". DailyMed. Eisai, Inc. August 2012. *Archived from the original on 21 October 2013. Retrieved 21 October 2013.*

4. "*FDA approves Arena obesity drug; first in 13 years*". Reuters. 27 June 2012. *Archived from the original on 24 September 2015.*