• 計畫中文名稱	改善 Cetirizine 口服以降低昏睡指數之緩解劑型開發及生體可用率研究		
• 計畫英文名稱	Design and Bioavailability Study of Ceterizine Tablets with Minimization of Side Effects		
• 系統編號	PG8911-0009	• 研究性質	基礎研究
• 計畫編號	DOH89-TD-1201	• 研究方式	委託研究
• 主管機關	行政院衛生署	• 研究期間	8811 ~ 8912
• 執行機構	台北醫學院藥學研究所		
• 年度	89 年	• 研究經費	1000 千元
• 研究領域	藥學		
• 研究人員	許明照		
• 中文關鍵字	Cetirizine；控釋劑型；生體可用率		
• 英文關鍵字	Cetirizine；Controlled Dosage Form；Bioavailability		
• 中文摘要	本研究的目的在於改善 10mg 的 Cetirizine 錠劑（原廠藥品爲 Zyrtec）的口服吸收，使其仍保留臨床療效但使其 嗜睡副作用降低或消除。本研究主要分爲兩部份：第一部份爲 10mg 的 Cetirizine 錠劑的處方製備，利用體外 溶離篩選出三種處方錠劑，其溶離速率不相同且均小於原廠藥品，以改善 Cetirizine 的吸收動態，而降低嗜 睡的副作用。第二部份則爲篩選出的三種錠劑其各別的生體可用率研究，同時並評估其嗜睡副作用發生的 情形，以作爲評估藥動學參數與昏睡副作用發生率之間的關係。Cetirizine 錠劑的處方組成乃利用不同黏度 規格的 HPMC（hydroxypropylmethylcellulose）及其他賦型劑以不同比例混合，採直接壓錠法壓製成含 10 毫克 的間質性（Matrix Type）Cetirizine 錠片，並藉由體外溶離試驗篩選出三種處方錠片其溶離速率皆不相同且均 低於 Zyrtec（原開發藥廠）。篩選出的處方錠片以口服投予進行生體可用率試驗，共 24 位我國健康成年男性 隨機分成三組進行平行試驗。進行生體可用率試驗的同時藉由視覺模擬級數（Visual Analogue Scale）來評 估此藥物所引起的昏睡情形。受試者口服投予 10mg Cetirizine 錠劑後，將於適當抽血時間點由手臂靜脈抽血 ，血液檢品經適當處理後以高效液相層析法定量出 Cetirizine 在各時間內的血中濃度值。所得數據經整理分 析比較其藥物動力學參數。執行生體可用率的同時並記錄其昏睡程度或其他副作用的發生情形。經上述的 處方錠劑篩選及生體可用率試驗，可以預期得到一低副作用（或無副作用）且有效的 10mg Cetirizine 錠劑， 並進而解析藥動學參數與嗜睡副作用發生率之間的關係，以作爲開發臨床有效且低或無昏睡副作用的產品 ，相對地也提高了此藥在市場的競爭潛力。		

• 英文摘要	Cetirizine was mostly used in clinic contributed to its high efficacy and safety among the second generation H1-antihistamines. Though it has no severe adverse effect, nevertheless it does make some patients somnolence in clinical therapy. The purpose of this study is to design a formulation of 10-mg cetirizine table expected with minimization of side effects. The study includes two major parts: preparation of modified release 10-mg cetirizine tablet and oral bioavailability study. In the formulation design, three formulations of 10-mg cetirizine tablets will be prepared that have different release rates and slower release than pioneer product (Zyrtec) in vitro dissolution tests. Twenty-four healthy Taiwanese male volunteers will participate in the oral bioavailability of three modified release cetirizine tablets study by three-group parallel design. Each subject will receive only one formulation of single dose of 10-mg cetirizine tablet of each three formulations. For the purpose of comparison, following the administration of the drug, blood samples will be drawn at an appropriate interval according to the schedule plan. These samples will be analyzed for cetirizine concentration using a validated HPLC method. This study also measures the drug- induced somnolence with a visual analogue scale (VAS) score of the subjects concomitantly with bioavailability test. The in vitro dissolution data, in vivo pharmacokinetic data, and VAS scores will be evaluated statistically by ANOVA, power analysis and 90% confidence intervals. Relationship among them will be assessed by canonical correlation analysis or perason correlation analysis.