

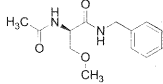
# 拉考沙胺口服溶液说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

## 【药品名称】

通用名称: 拉考沙胺口服溶液  
英文名称: Lacosamide Oral Solution  
汉语拼音: Lakaosha an Koufulongye  
【成份】本品主要成份为拉考沙胺。

化学名称: (R)-2-(乙酰氨基)-N-苯基-3-甲氧基丙酰胺  
化学结构式:



分子式: C<sub>12</sub>H<sub>17</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>

分子量: 250.30

辅料: 纯化水、甘油、羟甲基纤维素钠、聚乙二醇4000、山梨醇、羟苯甲酯、氯化钠、乙酸钠、无水枸橼酸、三氯蔗糖、液体薄荷香精、液体甜味香精。

## 【性状】

本品为无色至黄色或黄棕色的澄清液体, 有草莓气味。

## 【适应症】

本品适用于4岁及以上癫痫患者部分性发作的联合治疗。

## 【规格】

200ml, 2g

## 【用法用量】

口服, 可与或不与食物同服均可。

## 【用法用量】

**推荐剂量**  
1. 成人(17岁及以上)  
本品须每日服用二次(通常为早上一次, 晚上一次), 推荐起始剂量为每次50mg, 每日二次, 一周后应增加至每次100mg, 每日二次的初始治疗剂量。  
负荷治疗: 本品治疗的起始剂量也可以为200mg单次负荷剂量, 约12小时后采用每次100mg每日二次(200mg/日)维持剂量方案。当医生确定需要迅速达到拉考沙胺稳态血浆浓度及疗效时, 可以给予患者负荷剂量。考虑到严重心律失常和中枢神经系统不良反应发生率可能升高, 应在医疗监测下进行负荷剂量给药(参见【不良反应】)。尚未研究负荷剂量用于急性时的情况, 如癫痫持续状态。  
基于疗效和耐受性, 可每周增加维持剂量, 每次增加50mg, 每日二次(每周增加100mg), 直至增至最高推荐剂量400mg(每次200mg, 每日二次)。

表1: 成人(17岁及以上)患者联合治疗推荐的剂量

起始剂量	100mg/日
单次负荷剂量(如适用)	200mg
剂量调整(增量步骤)	每周调整(增量步骤)为50mg每日二次(100 mg/日)
最大推荐剂量	最高至400mg/日

## 2. 4岁及以上儿童和青少年人群

医生应根据患者的年龄、体重和服药剂量, 开具最合适的剂型和规格处方。

体重>50kg的儿童和青少年

体重>50kg的儿童和青少年的服药剂量与成人患者相同(请参照成人推荐剂量)。

体重<50kg的儿童和青少年

根据体重确定推荐剂量。如需要, 推荐使用口服溶液进行初始治疗, 随后转换为片剂治疗。当以口服溶液开始治疗时, 计量单位应以体积(ml)而不是重量(mg)。  
推荐起始剂量为2mg/kg/日, 一周后增至初始治疗剂量4mg/kg/日。  
基于疗效和耐受性, 可每周增加维持剂量, 每次增加2mg/kg/日, 逐步调整剂量直到获得最佳疗效。体重<30kg的儿童, 由于清除率随年龄增加, 推荐的最大剂量不超过12mg/kg/日。对于体重>30kg, 但<50kg的儿童, 推荐的最大剂量为8mg/kg/日。但在几项开放性研究(参见【不良反应】和【药代动力学】), 少数儿童使用了最高12mg/kg/日剂量。  
未在儿童中进行负荷剂量给药的研究。不推荐给予体重<50kg的儿童和青少年负荷剂量。

表2: 体重<50kg的儿童和青少年(4岁及以上)联合治疗推荐的剂量

起始剂量	2mg/kg/日
单次负荷剂量	不推荐
剂量调整(增量步骤)	每周2mg/kg/日
<30kg患者的最大推荐剂量	最高至12mg/kg/日
≥30kg且<50kg患者的最大推荐剂量	最高至8mg/kg/日

表3和表4提供了根据处方剂量及体重, 每次服用的口服溶液体积的例子。精确的口服溶液体积应根据儿童的准确体重计算。

表3: 体重<30 kg的4岁以上儿童每日二次服用的联合治疗剂量

体重	0.1 ml/kg(1 mg/kg) 起始剂量	0.2 ml/kg (2 mg/kg)	0.3 ml/kg (3 mg/kg)	0.4 ml/kg (4 mg/kg)	0.5 ml/kg (5 mg/kg)	0.6 ml/kg(6 mg/kg) 最大推荐剂量
10kg	1 ml(10 mg)	2 ml(20 mg)	3 ml(30 mg)	4 ml(40 mg)	5 ml(50 mg)	6 ml(60 mg)
15kg	1.5 ml(15 mg)	3 ml(30 mg)	4.5 ml(45 mg)	6 ml(60 mg)	7.5 ml(75 mg)	9 ml(90 mg)
20kg	2 ml(20 mg)	4 ml(40 mg)	6 ml(60 mg)	8 ml(80 mg)	10 ml(100 mg)	12 ml(120 mg)
25kg	2.5 ml(25 mg)	5 ml(50 mg)	7.5 ml(75 mg)	10 ml(100 mg)	12.5 ml(125 mg)	15 ml(150 mg)

表4: 体重≥30 kg且<50 kg的4岁以上儿童和青少年每日二次服用的联合治疗剂量

体重	0.1 ml/kg(1 mg/kg) 起始剂量	0.2 ml/kg (2 mg/kg)	0.3 ml/kg (3 mg/kg)	0.4 ml/kg (4 mg/kg)
30kg	3 ml(30 mg)	6 ml(60 mg)	9 ml(90 mg)	12 ml(120 mg)
35kg	3.5 ml(35 mg)	7 ml(70 mg)	10.5 ml(105 mg)	14 ml(140 mg)
40kg	4 ml(40 mg)	8 ml(80 mg)	12 ml(120 mg)	16 ml(160 mg)
45kg	4.5 ml(45 mg)	9 ml(90 mg)	13.5 ml(135 mg)	18 ml(180 mg)

## 漏服

如果漏服一次剂量的拉考沙胺, 患者应立即补服, 然后按时服用下一次的剂量。如果患者在下一剂量的应服时间的6小时内发现漏服, 则无需补服, 只需按时服用下一次拉考沙胺即可。患者不应服用双倍剂量。

## 停药

根据目前的临床实践, 如果须停用拉考沙胺, 建议逐渐停药(例如, 按200mg/周逐渐降低剂量)。

对于出现严重心律失常的患者, 应进行临床获益/风险评估。如果需要, 应停用拉考沙胺。

## 特殊人群用药

老年患者(年龄≥65岁)

老年患者不需要降低剂量。对于老年患者, 应考虑年龄相关的肾脏清除率降低伴AUC水平升高(参见【药代动力学】)。老年癫痫患者接受(特别是≥400mg/日剂量)治疗的临床数据有限(参见【注意事项】、【不良反应】)。

## 肾功能受损

轻度和中度肾功能受损(C<sub>cr</sub>>30ml/分钟)的儿童及成人患者不需要调整剂量。轻度或中度肾功能受损且体重≥50kg的儿童及成人患者, 可考虑接受200mg负荷剂量, 但进一步剂量调整(每日≥200mg)时应谨慎。体重≥50kg的重度肾功能受损的儿童及成人患者(C<sub>cr</sub>≤30ml/分钟)及终末期肾病患者, 推荐的最高维持剂量为250mg/日, 调整这些患者的剂量时应谨慎。如果有负荷剂量指征, 应使用100mg起始剂量, 然后使用第一周每次50mg, 每日二次给药方案。对于重度肾损伤(C<sub>cr</sub>≤30ml/min)且体重<50kg的儿童和终末期肾病患者, 建议最大剂量降低25%。需要血液透析的患者, 建议在血液透析结束后直接补充不超过50%的分次剂量。用于终末期肾病患者时应谨慎, 因为相关临床经验很少, 且可能会出现代谢产物(具有未知的药理学活性)蓄积。

## 肝功能受损

轻至中度肝功能受损且体重≥50kg的儿童及成人患者的最高推荐剂量为300mg/日。  
对于合并存在肾功能受损的患者, 调整剂量时应谨慎。在体重≥50kg的儿童和成人中, 可考虑给予200mg的负荷剂量, 但应谨慎进行进一步的剂量调整(≥200mg/日)。基于成人数据, 在体重<50kg的儿童中度肝功能受损的患者中, 最大剂量应降低25%。未在重度肝功能受损患者中研究拉考沙胺的药代动力学(参见【药代动力学】)。仅当预期治疗获益大于可能的风险时, 才能给予重度肝功能受损成人和儿童患者拉考沙胺, 可能需要调整剂量, 同时应仔细监测患者疾病活动情况和潜在的副作用情况。

## 使用方法

拉考沙胺口服溶液, 在使用前摇匀。

本品包装内包含一个带刻度标记的量杯(对于体重≥50kg的患者)和一个带转接头的口服给药器(对于体重<50kg的患者)。

## 量杯

1. 适用于体重≥50kg的儿童、青少年及成人。

2. 每个刻度标记(5ml)对应于50mg拉考沙胺, 将口服溶液倒至量杯中与处方剂量相对应的毫升(ml)量刻度标记处。

3. 吞下口服溶液, 然后喝一些水。

## 口服给药器

1. 适用于体重<50kg的儿童和青少年。

2. 在首次使用之前, 医生会告诉您如何使用口服给药器。如有任何问题, 请咨询医师或药师。

3. 带转接头的口服给药器(10ml, 每个刻度0.25ml), 整套口服给药器(10ml)的剂量对应于100mg拉考沙胺, 最低可抽取体积为1ml, 对应于10mg拉考沙胺。从1ml刻度标记处起, 每个刻度对应于0.25ml, 对应于2.5mg拉考沙胺。

4. 本品可用于鼻饲管或胃造瘘术同管给药。

5. 具体使用方法如下:

## • 首次服用拉考沙胺口服溶液时遵循这些步骤:

(1) 按压瓶盖同时逆时针旋转, 打开瓶盖(图1)。



(2) 从口服给药器上取下转接头(图2)。



(3) 将转接头放入药瓶顶部(图3), 确保转接头适当固定, 使用后不需要取下转接头。



## • 每次服用拉考沙胺口服溶液时遵循这些步骤:

(4) 将口服给药器放入转接头开口内(图4)。



(5) 倒置药瓶(图5)。



(6) 一只手倒置药瓶, 另一只手充填口服给药器, 向下拉动活塞, 用少量药液充填口服给药器(图6)。



(7) 向上推动活塞, 去除任何气泡(图7)。



(8) 将活塞下拉至与处方剂量相对应的毫升(ml)量刻度标记处(图8)。



(9) 采用正确方式翻转药瓶使瓶颈朝上(图9)。



(10) 将口服给药器从转接头中取出(图10)。



## • 有两种方式可以喝下本药品:

(1) 通过将活塞推到口服给药器的底部, 将口服给药器的药液全部倒至少量水中(图11), 然后您需要喝下所有的水(加入适量的水, 使药液容易喝下), 或不需要水, 直接喝下口服给药器中的全部药液(图12)。



(12) 用塑料螺旋盖盖紧药瓶(不需要取下转接头), 只能用水清洗口服给药器(图13)。



## 【不良反应】

### 安全性特征概述

根据在1308例癫痫部分性发作患者中开展的联合治疗安慰剂对照临床试验的汇总分析结果, 在随机分配接受本品或安慰剂的患者中, 分别有61.9%和35.2%的患者报告了至少1例不良反应。本品治疗组最常报告的不良反应(≥10%)为头晕、头痛、恶心和复视。这些反应通常为轻度至中度。一些反应与剂量相关, 减少剂量后能够缓解。中枢神经系统和胃肠道不良反应的发生率和严重程度通常随时间延长而下降。

在所有对照研究中, 随机分配接受本品的患者出现不良反应导致的停药率为12.2%, 随机分配接受安慰剂的患者为1.6%。导致停止本品治疗的最常见不良反应为头晕。

在给予负荷剂量后, 头晕等中枢神经系统不良反应的发生率可能升高。

基于拉考沙胺与卡马西平缓释剂进行比较的非劣效单药治疗临床试验数据的分析, 拉考沙胺的最常报告的不良反应(≥10%)为头晕和头痛, 接受拉考沙胺治疗的患者中因不良反应导致的停药率为10.6%, 而接受卡马西平缓释剂治疗的患者中因不良反应导致的停药率为15.6%。

### 不良反应列表

表5列出了临床试验及上市后使用经验中报告的不良反发生率。发生率定义如下: 非常常见(≥1/10), 常见(≥1/100至<1/10), 不常见(≥1/1000至<1/100), 未知(根据可获得的数据, 无法估计发生率)。在每个发生率组内, 不良反应按严重性降序列出。

