

威克倦持續性藥效錠150毫克

Wellbutrin XL 150 mg Tablet “Canada”

Bupropion hydrochloride

本藥須由醫師處方使用
衛署藥輸字第025106號

【定性及定量成分】

WELLBUTRIN XL備有：

錠劑內含有150毫克之bupropion hydrochloride。

【劑型】

持續性藥效錠。

臨床特性

【適應症】

WELLBUTRIN XL用於治療憂鬱症。

【用法、用量】

WELLBUTRIN XL錠劑應整粒吞服，不可切、壓碎或嚼碎。

WELLBUTRIN XL錠劑空腹或隨餐服用均可。

● 成人之使用

WELLBUTRIN XL的最高單次劑量為 300 mg。

失眠為非常常見的副作用，常為暫時性的。透過避免於就寢時間服藥（連續兩次劑量之間至少必須間隔24小時），或是在臨床上必要時減低劑量，可減少失眠。

起始治療

WELLBUTRIN XL之起始劑量為150 mg每日一次，晨間服用。對於150 mg/日之劑量反應不充分的患者，提高劑量直到300 mg/日，每日一次的一般成人目標劑量，可能對其有益。

現已知bupropion的作用起始時間至早為開始治療後14天。如同所有的抗憂鬱劑，WELLBUTRIN XL可能需要治療數週之後，才會達到完全的抗憂鬱療效。

針對服用WELLBUTRIN SR錠的患者換服本藥

當服用WELLBUTRIN SR錠的患者換服WELLBUTRIN XL錠時，在可能情況下給予相同的每日總劑量。

目前正以WELLBUTRIN SR錠300 mg/日（例如：150 mg 每日兩次）治療中的患者，可令其換服WELLBUTRIN XL錠300 mg 每日一次。

維持療法

一般認為，憂鬱症之急性發作需要以抗憂鬱劑治療六個月或更久。現已顯示 bupropion (300 mg/日) 於長期 (長達一年) 治療是有效的。

● 兒童與青少年之使用

WELLBUTRIN XL錠並未核可用於18歲以下的兒童或青少年 (參閱注意事項)。

WELLBUTRIN XL錠用於18歲以下患者的安全性及有效性尚未確立。

● 肝功能不全患者之使用

肝功能不全的患者使用WELLBUTRIN XL應小心。

因為輕度到中度肝硬化患者在藥動學方面的差異性增大，應考慮降低給藥頻率 (參閱注意事項)。

WELLBUTRIN XL使用在嚴重肝硬化患者身上要極為小心。對於此類患者，劑量不可超過隔日服用150 mg (參閱注意事項)。

● 腎功能不全患者之使用

對腎功能不全的患者，開始治療時應降低投藥的頻率與(或)劑量，因為bupropion及其代謝物蓄積在此類患者體內的程度可能大於一般患者 (參閱注意事項)。

【禁忌症】

WELLBUTRIN XL禁用於對於bupropion或製劑中其他任何一種成分過敏者。

WELLBUTRIN XL禁用於癲癇患者。

WELLBUTRIN XL禁用於突然停止使用酒精或鎮靜劑的患者。

WELLBUTRIN XL錠中含有bupropion，不得給予正在接受其他含bupropion製劑治療之患者，因為癲癇發作的發生率與劑量有關。

WELLBUTRIN XL禁用於目前或先前被診斷罹患貪食症或神經性厭食症之患者，因為在此類患者群中，曾經觀察到服用bupropion立即釋出劑型後，癲癇發作之發生率比較高。

WELLBUTRIN XL不可與單胺氧化酶抑制劑 (MAOIs) 同時使用。停用MAOIs之後，至少必須相隔14天，才可開始使用WELLBUTRIN XL錠治療。

【注意事項】

WELLBUTRIN XL錠劑應整粒吞服，不可切、不可壓碎或嚼碎，因為這樣可能會升高發生不良反應(包括癲癇發作)的風險。

癲癇

不可以超過WELLBUTRIN XL的建議劑量，因為bupropion會伴隨一種與劑量相關的癲癇發作危險。

於臨床試驗中，在高達每日450 mg 的WELLBUTRIN XL劑量下，癲癇發作的總發生率約為0.1%。

隨同bupropion之使用而發生癲癇發作的危險，似乎與危險因子之存在有強烈的關聯。

因此，具有一種或多種容易降低癲癇發作閥值之狀況的患者，給予WELLBUTRIN XL治療時必須極為小心，這些狀況包括：

— 頭部外傷之病史。

- 中樞神經系統（CNS）腫瘤。
- 癲癇之病史。
- 同時給予其他會降低癲癇發作閾值之藥物。

此外，用於會增加癲癇發作風險的臨床狀況下應謹慎。包括：過量使用酒精或鎮靜劑（參閱禁忌症）、用降血糖藥物或胰島素治療的糖尿病，以及使用興奮劑或減低食慾的產品。

若患者曾在使用**WELLBUTRIN XL**治療中發生過癲癇，應停藥且不建議再使用。

過敏反應

若患者在**WELLBUTRIN XL**治療期間發生過敏反應，應立即停藥（參閱副作用）。醫師應該了解，症狀在停止**bupropion**後可能還會持續，所以仍應提供臨床上的處置。

肝功能不全

Bupropion在肝臟中被廣泛代謝成活性代謝物，隨後進一步代謝。輕度到中度肝硬化患者使用**bupropion**，在藥物動力學方面與健康自願者沒有統計學上顯著的差異，但在不同患者間**bupropion**血漿濃度的差異較大。因此，肝功能不全的患者使用**WELLBUTRIN XL**應小心；而且對於輕度到中度肝硬化的患者，應考慮降低給藥頻率（參閱用法、用量和藥物動力學）。

WELLBUTRIN XL使用在嚴重肝硬化患者身上要極為小心。因為在此類患者身上**bupropion**的最高血漿濃度會顯著增加，而且蓄積在體內的程度可能大於一般患者，所以需要減少給藥的頻率（參閱用法、用量和藥物動力學）。

所有肝功能不全的患者，都要嚴密監測可能發生的副作用（例如：失眠、口乾、癲癇），可藉此了解是否藥物或代謝物的量過高。

腎功能不全

Bupropion在肝臟中被廣泛代謝成活性代謝物，隨後進一步代謝並由腎臟排出。因此，對腎功能不全的患者，開始治療時應降低投藥的頻率與(或)劑量，因為**bupropion**及其代謝物蓄積在此類患者體內的程度可能大於一般患者（參閱藥物動力學）。應嚴密監測可能發生的副作用（例如：失眠、口乾、癲癇），可藉此了解是否藥物或代謝物的量過高。

老年患者

Bupropion的臨床經驗尚未發現其耐受性在老年人與其他成年患者之間有任何差異。然而，不能排除某些老年人對**bupropion**的作用較為敏感的可能性；因此可能必須降低投藥的頻率與(或)劑量（參閱藥物動力學）。

18歲以下的兒童與青少年

罹患重度憂鬱症或其他精神疾病的兒童和青少年接受抗憂鬱劑治療時，可能有增加自殺念頭和行為的風險。

精神疾病相關的臨床上惡化和自殺的風險

憂鬱症患者無論是否有服用抗憂鬱藥物，都有可能感受到抑鬱症狀惡化，和/或出現自殺的念頭和行為。這些風險會持續，直到明顯的緩解現象發生之時。由於

在治療初期數週或更久可能都還不會有任何改善，所以需密切監視病人是否有臨床上惡化（包括出現新的症狀）和自殺念頭與行為，尤其在初始療程或改變劑量時（無論增加或減少）。根據使用所有抗憂鬱劑治療的一般臨床經驗，在復原的初期可能會增加自殺的風險。

曾出現過自殺行為或想法的病人、年輕成人，和那些在開始治療前曾出現明顯程度自殺念頭的患者，都是會產生自殺念頭跟企圖的高危險群，在治療中需接受仔細的監控。

此外，針對使用抗憂鬱藥物治療重鬱症及其它精神疾病成人患者之安慰劑對照性臨床試驗所進行的一項整合分析也顯示，在 25 歲以下的患者中，使用抗憂鬱劑治療時，出現自殺想法及行為的風險有較安慰劑組升高的現象。

應該警告病人和他們的看護者，需要監控任何惡化的情況（包括產生新的症狀）和/或浮現自殺的念頭/行為，或傷害他們自己的想法，而且當這些症狀出現時要立刻尋求醫療上的建議。必須了解有些神經精神症狀的發生，與潛在的病況或是藥品治療有關（參閱神經精神方面包括躁狂症和躁鬱症的症狀；副作用）。

當病人有臨床上惡化（包括產生新症狀）和/或出現自殺的念頭/行為，尤其是這些症狀很嚴重、突然開始，或不是病患已有的症狀時，需考慮更換療程，包括停藥的可能。

神經精神方面包括躁狂症和躁鬱症的症狀

神經精神方面的症狀曾被報告（參閱副作用），特別在有精神病史的患者身上，觀察到精神病和躁狂症狀。另外，初期的躁鬱症可能主要以抑鬱呈現。一般相信（雖未經控制試驗確立），對有躁鬱症危險的患者，針對此抑鬱階段單獨使用抗憂鬱劑治療，可能會加速有躁鬱症危險的患者進入混合或躁狂階段。根據有限的臨床資料，對有躁鬱症病史的患者合併使用bupropion和情緒穩定劑，會有少許低轉變成躁狂症的機率。在使用抗憂鬱劑開始治療之前，應充分的篩檢患者確定他們是否有躁鬱的風險；此篩檢應包含詳細的精神病史，包括自殺、躁鬱症和憂鬱症的家族史。

心血管疾病

以bupropion治療有心血管疾病患者之憂鬱症的臨床經驗有限。給予這些患者WELLBUTRIN XL時須小心。然而，bupropion在對於戒煙並有缺血性心血管疾病患者的試驗中，通常有良好的耐受性（參閱臨床試驗）。

血壓

在一項非憂鬱症、未治療的第一期高血壓患者（包括抽煙和沒抽煙）的試驗中，bupropion未對血壓產生統計上有意義的影響。然而，曾有血壓升高（有時嚴重）的主動報告（參閱副作用）；而且若同時使用bupropion和尼古丁經皮貼片（Nicotine Transdermal System）可能會使血壓升高（參閱藥物交互作用）。

【藥物交互作用】

Bupropion主要被細胞色素P450 2B6（CYP2B6）（參閱藥物動力學）代謝為主要代謝物hydroxybupropion。因此，當WELLBUTRIN XL與其他會影響CYP2B6

同功酶之藥物(例如: orphenadrine、cyclophosphamide、ifosfamide、ticlopidine、clopidogrel)同時投予時,必須很小心。

雖然bupropion不會被CYP2D6同功酶代謝,人類P450的體外研究卻已證實,bupropion及hydroxybupropion是CYP2D6途徑的抑制劑。一項人體藥物動力學研究顯示,投予bupropion使得desipramine的血漿濃度升高。直到投予最後一劑bupropion後至少7天,仍然有這種作用。因此,WELLBUTRIN XL與主要由這種同功酶代謝的藥物併用時(例如某些乙型阻斷劑、抗心律不整劑、選擇性血清素回收抑制劑(SSRIs)、三環抗憂鬱劑、抗精神病劑),這些併用的藥物必須由最低劑量開始。如果將WELLBUTRIN XL加入原先已經接受由CYP2D6代謝之藥物治療的患者,則必須考慮降低既有藥物的劑量,特別是治療指數狹窄之藥物(參閱藥物動力學)。

藥物須藉由CYP2D6代謝活化為具有有效性的(如tamoxifen),當此類藥物與CYP2D6抑制劑(如bupropion)併用時可能會降低其有效性。

雖然citalopram(一種SSRI)並非主要由CYP2D6代謝,但在一試驗中,bupropion仍增加citalopram的C_{max}及AUC各30%及40%。

因為bupropion被廣泛的代謝,所以同時投予會誘發代謝(如carbamazepine、phenobarbitone、phenytoin、ritonavir、efavirenz)或抑制代謝的藥物,都可能會影響它的臨床活性。

一系列針對健康志願者所進行的研究顯示,ritonavir (100 mg每天兩次或600 mg每天兩次)或ritonavir 100 mg加lopinavir 400 mg (Kaletra[®])每天兩次會使bupropion及其主要代謝物的曝藥量依劑量依賴模式降低約20至80%。同樣地,連續兩週每天投予一次efavirenz 600 mg會使bupropion的曝藥量降低約55%。一般認為ritonavir/Kaletra[®]及efavirenz的這種作用乃是其對bupropion的代謝作用產生誘導作用所致。對正在使用其中任一藥物治療的患者,投予bupropion時可能必須提高bupropion的劑量,但不可超過bupropion的最高建議劑量。

雖然臨床資料並沒確定bupropion和酒精之間的藥物動力學交互作用,仍有極少的神經精神方面副作用,或患者在bupropion治療期間喝酒,對酒精的耐受性降低的報告。在WELLBUTRIN XL治療期間,酒精的飲用應減到最低或避免。

有限的臨床資料顯示,bupropion與levodopa或amantadine併用時,患者的神經精神方面副作用發生率較高。無論患者正在服用levodopa或amantadine,給予WELLBUTRIN XL都必須很謹慎。

多劑量的口服bupropion,在12個受試者中對單一劑量的lamotrigine藥動性質並無統計上有意義的影響,且僅有lamotrigine glucuronide的AUC些微增加。

同時使用WELLBUTRIN XL及尼古丁經皮貼片(NTS)可能會使血壓升高。

與實驗室檢查的交互作用

WELLBUTRIN XL已被通報會干擾某些使用在快速尿液藥物篩檢檢驗上,造成假陽性的反應,尤其是針對安非他命。如 gas chromatography/mass spectrometry 可區分 bupropion 及安非他命。

【懷孕與授乳】

生育力

一項大鼠生育力研究顯示本藥不會損害生育力。

懷孕

人類在懷孕期間使用bupropion的安全性尚未確立。

只有在預期的好處遠大於可能的風險時，才可在懷孕時使用bupropion。

在一回溯性的管理醫療資料庫分析（n=7005嬰兒），懷孕第一期接觸bupropion（n=1213嬰兒）產生先天性畸形（2.3%）或心血管畸形（1.1%）的比率，與在懷孕第一期使用其他抗憂鬱劑（n=4743嬰兒：2.3%先天性畸形，1.1%心血管畸形），或是在第一期以外時間使用bupropion（n=1049嬰兒，各2.2%及1.0%）相比，並沒有增加的情形。

試驗動物研究之評估並未指出，它對胚胎或胎兒的發育、懷孕過程、出生前後及出生後的發育等方面有直接或間接的害處。動物生殖研究並無法有效預測人體反應。

授乳

由於bupropion及其代謝物會分泌至人類乳汁中，所以必須勸告母親在服用WELLBUTRIN XL期間不要授乳。

【對駕駛及操作機器能力之影響】

如同其他作用於中樞神經系統（CNS）的藥品，bupropion可能會影響執行需要判斷力或運動及認知技巧之任務的能力。因此，患者在駕駛或操作機器前必須很小心，直到有理由確定WELLBUTRIN XL錠對他們的能力沒有不良影響為止。

【副作用】

下表以身體的器官系統分類，提供臨床經驗發現的副作用。

全身（一般性）：

發燒、胸痛、無力

心血管：

心搏過速、心悸、血管擴張、姿勢性低血壓、血壓升高（有時嚴重）、潮紅、昏厥

中樞神經系統：

癲癇（參閱注意事項）、失眠、震顫、肌張力異常、運動失調、帕金森氏症、肌肉抽搐、動作不協調、注意力不集中、頭痛、頭暈、抑鬱、精神紊亂、被害或其他妄想、幻覺、激動、不安、焦慮、易怒、敵意、侵略性、人格解體、異常夢境、記憶障礙、感覺異常

內分泌與代謝：

厭食、體重減輕、血糖控制障礙

腸胃：

口乾、胃腸障礙，包括噁心及嘔吐、腹痛、便秘

泌尿生殖：

頻尿及/或尿液滯留

肝膽：

肝酵素過高、黃膽、肝炎

皮膚/過敏反應：

皮疹、搔癢、出汗。過敏反應依嚴重性可由蕁麻疹至血管性水腫、呼吸困難/支氣管痙攣及罕見的過敏性休克。也有關節痛、肌痛及發燒伴隨皮疹及其他暗示遲發性過敏症狀出現的報告。這些症狀可能很像血清病。也曾有多形性紅斑及史蒂文斯-強生氏症候群（Stevens Johnson syndrome）等罕見副作用報告。

特殊感覺：

耳鳴、視覺障礙、味覺異常

【過量】

症狀與徵兆：

除了在副作用項目下所報告的事件之外，服藥過量所導致的症狀包括嗜睡、喪失意識及ECG變化如傳導障礙（包括QRS延長）或心律不整。

曾有驟然吞服超過10倍最高治療劑量之報告。

治療：

發生過量時，應讓患者住院。應監控ECG及生命徵象。

確保呼吸道暢通，以及充分的氧氣供給與換氣。建議使用活性炭。**Bupropion**沒有特定的解毒劑。應視臨床需要或依照國家毒物中心的建議(如果有的話)進行進一步的處置。

【藥理性質】

藥效學

ATC代碼：

藥物治療分類：其它抗憂鬱劑，ATC代碼：N06 AX12。

作用機轉：

Bupropion是一種兒茶酚胺（catecholamines：[正腎上腺素noradrenaline]及[多巴胺dopamine]）的神經元回收之選擇性抑制劑，對於吲哚胺（indolamines：[血清素serotonin]）回收的影響相當微弱，也不會抑制單胺氧化酶。雖然bupropion和其他抗憂鬱劑一樣，作用機轉還不明，但一般認為，這種作用是由正腎上腺素激性（noradrenergic）及/或多巴胺激性（dopaminergic）機轉所媒介。

在一健康志願者試驗中，給予bupropion持續性藥效錠(extended release bupropion)（450 mg/天）14天達到穩定態後，與安慰劑組相比，對QTcF間距在臨床上沒有顯著的影響。

藥物動力學

吸收：

健康志願者口服 WELLBUTRIN XL 後，大約 5 小時達到 bupropion 的最高血漿濃度。

當 bupropion 持續性藥效錠與食物併用時，對其吸收並沒有顯著影響。

長期投予每日 150 至 300 mg 之劑量後，bupropion 及其代謝物具有線性動力學性質。

分佈

Bupropion 廣泛分佈在體內，擬似分佈體積約 2000 公升 (L)。Bupropion 及 hydroxybupropion 適度與血漿蛋白質結合（分別為 84% 及 77%）。

Threohydrobupropion 代謝物的蛋白質結合程度約為 bupropion 的一半。

代謝

Bupropion 在人體內進行廣泛代謝。至今已在血漿中鑑定出三種具有藥理活性的代謝物：hydroxybupropion 及其胺基醇異構物（amino-alcohol isomers）、threohydrobupropion、及 erythrohydrobupropion。這些代謝物在臨床上可能相當重要，因為它們的血漿濃度和 bupropion 一樣高，甚至更高。

在投予 WELLBUTRIN XL 單次劑量之後，並無法於血漿中測得 erythrohydrobupropion。活性代謝物進一步代謝成不具活性的代謝物之後，由尿液排出體外。

體外研究指出，bupropion 主要被 CYP2B6 代謝成主要的活性代謝物 hydroxybupropion；然而，細胞色素 P450 與 threohydrobupropion 的形成無關（參閱藥物交互作用）。

Bupropion 及 hydroxybupropion 都是 CYP2D6 同功酶相對微弱的競爭性抑制劑， K_i 值分別為 21 及 13.3 μM 。在已知是 CYP2D6 同功酶廣泛代謝型同功酶

（extensive metabolisers）的志願者中，同時投予 bupropion 及 desipramine，會使 desipramine 的 C_{max} 及 AUC 分別增加 2 倍及 5 倍。至少在投予最後一劑 bupropion 之後 7 天內，仍然有這種影響。由於 bupropion 不經 CYP2D6 途徑代謝，所以預料 desipramine 不會影響 bupropion 的藥物動力學。同時投予 WELLBUTRIN XL 與 CYP2D6 途徑的受質時，應當謹慎（參閱藥物交互作用）。

亞慢性給藥之後，bupropion 已被證實會在動物體內誘發它本身的代謝。在志願者或患者服用 bupropion 建議劑量長達 10 至 45 天的人體試驗中，並未得到 bupropion 或 hydroxybupropion 具有酵素誘發作用的證據。

人體試驗結果顯示，投與 WELLBUTRIN XL 後，約 7 小時，會達 hydroxybupropion 最高血漿濃度。穩定期時，hydroxybupropion 最高血漿濃度約為 bupropion 的七倍。Hydroxybupropion 的半衰期約為 20 ± 5 小時，其穩定期之 AUC 約為 bupropion 的 13 倍。Erythrohydrobupropion 與 threohydrobupropion 到達最高血漿濃度的時間與 hydroxybupropion 相似，然而他們的半衰期較長，分別為 33 ± 10 小時與 37 ± 13 小時，穩定期之 AUC 分別約為 bupropion 的 1.4 倍與 7 倍。

一項健康志願者研究顯示，100 mg 每天兩次之劑量的 ritonavir 會使 bupropion 的 AUC 與 C_{max} 分別降低 22% 與 21%。Bupropion 之代謝物的 AUC 與 C_{max} 則會降低 0 至 44%。另一項健康志願者研究顯示，600 mg 每天兩次之劑量的 ritonavir 會使 bupropion 的 AUC 與 C_{max} 分別降低 66% 與 62%。Bupropion 之代謝物的 AUC 與 C_{max} 則會降低 42 至 78%。

另有一項健康志願者研究顯示，Kaletra® (lopinavir 400 mg/ritonavir 100 mg 每天兩次)會使 bupropion 的 AUC 與 Cmax 降低 57%。Hydroxybupropion 的 AUC 與 Cmax 則會分別降低 50%與 31%。

排除

人體口服 200 mg ¹⁴C-bupropion 之後，可以從尿液及糞便中分別回收 87%及 10% 的放射活性。Bupropion 以原型排出的比率僅佔口服劑量的 0.5%，這個發現與 bupropion 的廣泛代謝相符。尿液中只有不到 10% 的 ¹⁴C 劑量被證明是活性代謝物。口服之後，bupropion 的平均擬似總廓清率約為 200 公升/小時 (L/hr)，平均排除半衰期約為 20 小時。

Hydroxybupropion 的排除半衰期為 20 小時，它在穩定狀態下的藥物血中濃度-時間曲線下面積 (AUC) 約為 bupropion 的 17 倍。Threohydrobupropion 及 erythrohydrobupropion 的排除半衰期比較長(分別為 37 及 33 小時)，穩定狀態 AUC 值也分別為 bupropion 的 8 倍及 1.6 倍。Bupropion 及其代謝物可在 8 天之內達到穩定狀態。

持續性藥效錠的錠殼為不溶解的，可能會在胃腸道移行時 (gastrointestinal transit) 維持完整無缺並排除於糞便中。

腎功能不全患者

Bupropion 及其主要代謝物的排除可能因腎功能變差而減弱 (參閱注意事項)。在患有末期腎衰竭或中至重度腎功能不全的受試者中，bupropion 及(或)其代謝物的曝藥量有升高的現象。

肝功能不全患者

在輕微至中度肝硬化患者，bupropion 及其活性代謝物的藥動性質與健康受試者間並無統計上的差異，然而患者個體間的變異較大。在嚴重肝硬化的患者，bupropion 的 Cmax 及 AUC 顯著增加 (平均差異分別為約 70% 及 3 倍)，且變異較健康受試者大；平均半衰期也較長 (約 40%)。至於代謝物方面，與健康受試者相較，患者的平均 Cmax 偏低 (約 30 至 70%)，平均 AUC 偏高 (約 30 至 50%)，中位 Tmax 延後 (約 20 小時)，平均半衰期延長 (約 2 至 4 倍) (參閱注意事項)。

老年人

老年人的藥物動力學研究結果並不一致。一項單次劑量研究顯示，bupropion 及其代謝物在老年人體內的藥物動力學與年輕成人相同。另一項包含單次劑量及多劑量的藥物動力學研究則暗示，bupropion 及其代謝物蓄積在老年人體內的程度可能比較大。臨床經驗尚未發現 bupropion 的耐受性在老年人與年輕患者之間有任何差異；然而，不能排除某些老年人的敏感性可能比較高。

【臨床試驗】

Bupropion XL 的療效與耐受性也已經過七個雙盲試驗的檢測。

在兩個相同的彈性劑量試驗之一 (WXL101497, n=576) 中，每日給予 bupropion XL 150-300 mg 於 8 週後主要療效指標，Montgomery-Asberg Depression Rating Scale (MADRS) 總分由基線的改變方面在統計學上雖顯著優於安慰劑 (p=0.006)。

但在絕對數值上本品僅較安慰劑多減了2.5分而活性對照品venlafaxine則多減少了3.6分（MADRS為0~60分之憂鬱量表，分數越高越嚴重。所收錄之各組病患之baseline MADRS約在30分左右，而placebo便已可降約13.5分）。在第二個試驗（AK130939, n=591）中，bupropion XL於主要療效指標，MADRS總分由基線的改變方面與安慰劑並無顯著區別（ $p=0.146$ ），然而卻觀察到venlafaxine有統計上顯著的療效（與安慰劑相較， $p<0.001$ ）。

在一個以安慰劑對照的彈性劑量試驗（AK130940, n=420）中，於每日給予150-300mg的劑量範圍下。雖在MADRS反應者、Clinical Global Impressions (CGI) 整體改善度評分、Sheehan失能量表、MEI，以及Q-LES-Q發現了若干統計上有意義之效果；然而在主要療效指標，即MADRS總分由基期的改變上，卻無法達到與安慰劑具有顯著統計意義之差別（ $p=0.085$ ）。

【臨床前安全性資料】

對老鼠及大鼠的致癌性研究已證實，bupropion對這些物種不具致癌性。動物研究可以見到肝臟的變化，但這些變化是反映肝臟酵素誘發劑的作用。Bupropion在人體的臨床劑量下，並沒有任何酵素誘發作用的證據，這暗示在實驗動物所發現的肝臟變化，對於評估bupropion之危險性或許僅具有有限之重要性。

【藥劑學特性】

賦形劑

Polyvinyl Alcohol
Glycerol Dibehenate
Ethylcellulose
Povidone K-90
Macrogol 1450
Ethyl Alcohol 95%
Isopropyl Alcohol
Methacrylic Acid-Ethyl Acryl Copolymer (1:1)
Silicon Dioxide
Triethyl Citrate
Purified Water
Black Printing Ink (可食用)

【不相容性】

未曾報告。

【貯架期】

保存期限標示於外包裝。

【儲存特別注意事項】

儲存於25°C以下。需儲存於陰涼乾燥處。請勿儲存於冰箱內。

【包裝】

2~1000錠塑膠瓶裝。

【使用說明】

無。

在某些國家可能僅提供部分規格。

版本編號：GDS20/IPI05

版本日期：24 August 2011

製造廠：Biovail Corporation

廠址：100 LifeSciences Parkway Box 21390 Steinbach, Manitoba, Canada R5G 1Z7

包裝廠：Aspen Bad Oldesloe GmbH

廠址：Industriestrasse 32-36, 23843 Bad Oldesloe, Germany

藥商：荷商葛蘭素史克藥廠股份有限公司台灣分公司

地址：台北市忠孝西路一段66號24樓