

可蘇多錠 50毫克

Casodex Tablets 50mg

本藥須由醫師處方使用
衛署藥輸字第022803號

成分：

每錠含有 bicalutamide (INN) 50 毫克。

劑型：

白色膜衣錠。

適應症：

與LHRH類似劑療法或手術去勢療法併用於進展性攝護腺癌。

用法用量：

- 成人：
成年男子，包括老人：一天一錠 (50毫克)。“可蘇多”應與LHRH類似劑或手術去勢療法同時開始使用。
- 兒童：
“可蘇多”禁用於兒童。
- 腎功能損傷：
“可蘇多”用於腎功能損傷的病人不需調整劑量。
- 肝功能損傷：
“可蘇多”用於輕度肝功能損傷的病人不需調整劑量。中度或重度肝功能損傷的病人服用“可蘇多”可能會造成該藥在身體的蓄積量增加 (參閱特殊警語及使用時注意事項)。

禁忌：

“可蘇多”禁用於女性及兒童(參閱妊娠與授乳)。
“可蘇多”禁用於對本品有效成分或任何賦形劑過敏的任何病人。
“可蘇多”禁止與terfenadine、astemizole或cisapride併用(參閱與其他藥品的交互作用和其他型式的交互作用)。

特殊警語及使用時注意事項：

應在專科醫師的直接監督下起始治療。

“可蘇多”廣泛的由肝臟代謝。資料顯示，嚴重肝功能損傷的病人對於“可蘇多”的排除可能較慢，這會導致“可蘇多”在身體內的累積量增加。因此，對於中度或重度肝功能失調的病人服用“可蘇多”時應謹慎。

由於可能發生肝功能變化，故應考慮定期做肝功能之檢測。大部分的變化預期會在“可蘇多”治療的頭六個月內出現。

使用“可蘇多”曾被觀察到有極少數嚴重的肝功能變化及肝衰竭，也曾有致死的報告 (參閱不良反應)。故當有嚴重的肝功能變化時，則應停止“可蘇多”治療。

曾在接受LHRH作用劑的男性觀察到葡萄糖耐受性減少。這在已有糖尿病的患者可能表現為糖尿病或血糖失控。因此，對於併用“可蘇多”和LHRH作用劑的患者應當考慮監測血糖。

“可蘇多”已被證實會抑制細胞色素P450 (CYP 3A4)，故當與以CYP 3A4代謝為主的藥物併用時應謹慎 (參閱禁忌及與其他藥品的交互作用和其他型式的交互作用)。

患有罕見遺傳性疾病如半乳糖不耐症 (galactose intolerance)、Lapp乳糖酵素缺乏症 (Lapp lactose deficiency) 或葡萄糖-半乳糖吸收不良 (glucose-galactose malabsorption) 之病患不應使用本品。

雄性素去除療法(Androgen deprivation therapy)可能會延長QT間隔，雖然此與“可蘇多”之因果關係尚未被建立。使用“可蘇多”前，醫師應針對有QT間隔延長病史或危險因子，以及同時使用可能延長QT間隔藥物的病

患進行風險利益評估，其中應考量尖端扭轉型室性心搏過速(Torsade de Pointes)的可能性。[請參照交互作用]

與其他藥品的交互作用和其他型式的交互作用：

尚無“可蘇多”與LHRH類似劑之間有藥效作用學或藥物動力學之交互作用的證據。

體外試驗顯示，“可蘇多”之(R)-型異構物是CYP 3A4的抑制劑，其對於CYP 2C9、2C19及2D6活性的影響比較小。

雖然以antipyrine作為細胞色素P450 (CYP) 活性標記的臨床研究顯示與“可蘇多”沒有產生藥物交互作用的跡象，但與“可蘇多”併用28天之後，平均midazolam暴露量(AUC)增加多達80%。故對於治療指數狹窄的藥物來說，這種增加可能會有影響。因此，“可蘇多”禁止與terfenadine、astemizole及cisapride併用(參閱禁忌)；“可蘇多”與諸如cyclosporin及鈣離子通道阻斷劑等化合物併用時也應謹慎，可能需要減低這些藥物的劑量，特別是出現藥效增強或副作用的跡象時。就cyclosporin而論，建議在開始或停止“可蘇多”治療後，應密切監視cyclosporin的血漿濃度及病人的臨床狀況。

開立“可蘇多”和其他會抑制藥物氧化代謝之藥物如cimetidine及ketoconazole的處方時應謹慎；理論上，這會造成“可蘇多”的血漿濃度增加，以致副作用增多。

體外實驗顯示“可蘇多”能取代coumarin類的抗凝血藥warfarin的蛋白結合位置，因此建議已經服用coumarin類的抗凝血藥之病人，在開始服用“可蘇多”時，應密切監視其prothrombin time。

因為雄性素去除治療可能會延長QT間隔，合併使用“可蘇多”和已知會延長QT間隔或是造成尖端扭轉型室性心搏過速(Torsade de Pointes)的藥物應被審慎評估。[請參照警語及注意事項]

妊娠與授乳：

“可蘇多”禁用於女性，而且絕不可用於孕婦或授乳婦。

對於開車或使用機械能力的影響：

“可蘇多”不會影響病人的開車或操作機械的能力。但偶而可能會發生嗜睡情形。因此，有此症狀的患者須小心使用。

不良反應：

在本節中，不良反應的定義如下：很常見 (≥ 1/10)；常見 (≥ 1/100 至 <1/10)；不常見 (≥ 1/1,000 至 ≤ 1/100)；罕見 (≥ 1/10,000 至 ≤ 1/1,000)；非常罕見 (≤ 1/10,000)；不詳 (無法從現有的數據估計)。

表一 不良反應發生率

系統器官分類	頻率	事件
血液和淋巴系統的異常	很常見	貧血
免疫系統的異常	不常見	過敏，血管神經性水腫，蕁麻疹
代謝和營養方面的異常	常見	食慾減退
精神方面異常	常見	性慾減退，抑鬱
神經系統的異常	很常見	頭暈
	常見	嗜睡
心臟方面的異常	常見	心肌梗塞(曾有致死的報告) ⁴ ，心衰竭 ⁴
血管方面的異常	很常見	熱潮紅
呼吸道、胸部和縱膈異常	不常見	間質性肺部疾病 ⁵ 。曾有致死的報告
胃腸消化系統的異常	很常見	腹痛，便秘，噁心
	常見	消化不良，胃脹氣
肝膽方面異常	常見	肝毒性，黃疸，轉胺酵素的濃度升高
	罕見	肝衰竭 ² 。曾有致死的報告
皮膚和皮下組織異常	常見	禿髮，多毛症/頭髮重新生長，皮膚乾燥，搔癢。

		皮疹
	罕見	光敏感反應
腎臟和泌尿系統的異常	很常見	血尿
生殖系統和乳房方面異常	很常見	男性女乳症及乳房觸痛 ³
	常見	勃起功能障礙
全身性的障礙和投藥部位狀況	很常見	虛弱·水腫
	常見	胸痛
調查研究	常見	體重增加

1. 肝功能變化極少是嚴重的變化。並且這些變化往往是暫時性的，於繼續治療或停止治療之後便會消失或改善（參閱**特殊警語及使用時注意事項**）。
2. 依據上市後資料審查結果屬於一種藥品不良反應。頻率的大小來自於開放性標記之早期前列腺癌試驗中接受“可蘇多”150mg 治療的病人被報導有肝衰竭不良反應的發生率。
3. 可因伴隨的去勢療法而降低。
4. 在一項使用 LHRH 作用劑和抗雄性素治療攝護腺癌的藥理流行病學研究觀察到。當“可蘇多”50 mg 和 LHRH 作用劑併用時，風險似乎會增加，但當“可蘇多”150 mg 作為單一療法治療攝護腺癌時，風險未明顯增加。
5. 依據上市後資料審查結果屬於一種藥品不良反應。頻率的大小來自於早期前列腺癌試驗中接受“可蘇多”150mg 治療的病人被報導有間質性肺炎不良反應的發生率。

過量：

無人類使用過量的經驗。無特定的解毒劑，應依症狀給予治療。由於“可蘇多”具高蛋白結合力，且於尿中不能收回原形藥，血液透析法可能沒用。有必要給予一般的支持照顧，包括時常監視其生命跡象。

藥理學特性：

藥效作用學特性：

抗雄性素，ATC碼：L02 B B03

“可蘇多”是一種非類固醇的抗雄性素，無其他內分泌激素的作用。“可蘇多”會結合到androgen receptors，而不活化基因的表現，因此可抑制雄性素的刺激。藉由此抑制作用而造成攝護腺腫瘤的消退。臨床上，在停止使用“可蘇多”後，某些病患會出現“雄性激素戒斷症候群”。“可蘇多”是一種消旋性異構物，其抗雄性素的作用幾乎完全來自(R)-型的異構物。

藥物動力學特性：

“可蘇多”口服後吸收良好，無證據顯示食物會影響其生體可用率。

(S)-型異構物的廓清比(R)-型異構物快速，(R)-型異構物的血漿排除半衰期約為1星期。

由於“可蘇多”的半衰期長，每天服用後，其(R)-型異構物在血漿內的累積量約為10倍。

每天服用“可蘇多”50mg，其(R)-型異構物之穩定性血漿濃度約為9 microgram/ml；於穩定期，活性(R)-型異構物約佔全部異構物的99%。

(R)-型異構物的藥物動力學特性不因年齡、腎功能損傷或輕度至中度肝功能損傷而改變。有證據顯示嚴重肝功能損傷的病人，其(R)-型異構物於血漿排除較慢。

“可蘇多”具有高蛋白結合力（消旋性異構物為96%(R)-型異構物 > 99%），且廣泛的被代謝（經氧化和葡萄糖醛基酸化）。其代謝物經由腎臟和膽汁以大約相等的比例排出。

一項臨床研究顯示服用“可蘇多”150毫克，男性精液中(R)-bicalutamide的平均濃度為4.9 mcg/ml。性交時可能傳遞到女性伴侶

的bicalutamide量很低，經推算可能大約為0.3 mcg/kg。而這樣低的濃度並不足以誘導實驗室動物的後代產生變化。

臨床前試驗的安全性資料：

在動物，“可蘇多”是一種強效的抗雄性素，而且是一個混合功能的氧化酵素誘導劑。於動物，作用器官的變化，包括腫瘤的誘導，與這些作用有關。故臨床前試驗的發現並不被認為與進展性攝護腺癌病人的治療有關。

賦形劑內容表：

“可蘇多”包含之賦形劑如下列：

Lactose Monohydrate (單水乳糖)
Magnesium Stearate (硬脂酸鎂)
Hypromellose (羥丙基甲基纖維素)
Macrogol 300 (聚乙二醇 300)
Povidone
Sodium Starch Glycolate (甘醇酸澱粉鈉)
Titanium Dioxide (E171)
Industrial Methylated Spirit

配伍禁忌：

目前無已知之配伍禁忌。

保存期限

請參閱藥品包裝或外盒上的有效期限。

儲藏的特殊注意事項：

儲存勿超過30°C以上。

使用、操作與處理說明：

無特殊注意事項。

包裝

包裝數量請參閱外盒。

修訂日期

2016年5月

‘Casodex’ 為阿斯特捷利康公司集團所有之商標

製造廠：Corden Pharma GmbH

製造廠廠址：Otto-Hahn-Strasse, 68723, Plankstadt, Germany

包裝廠：AstraZeneca UK Limited

包裝廠廠址：Silk Road Business Park, Macclesfield, Cheshire, UK
SK10 2NA

藥商：臺灣阿斯特捷利康股份有限公司

地址：台北市敦化南路二段207號21樓

電話：(02)23782390