

可蘇多錠 50公絲

Casodex Tablets 50mg

本藥須由醫師處方使用

衛署藥輸字第022803號

外觀：

白色膜衣錠，每錠含有 bicalutamide (INN) 50 公絲。

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：

1. 成人：

成年男子，包括老人：一天一錠 (50公絲)。“可蘇多”應與LHRH類似劑或手術去勢療法同時開始使用。

2. 兒童：

“可蘇多”禁用於兒童。

3. 腎功能損傷：

“可蘇多”用於腎功能損傷的病人不需調整劑量。

4. 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**警語/注意事項**)。

禁忌：

“可蘇多”禁用於女性及兒童。

“可蘇多”禁用於對該藥過敏的任何病人。

“可蘇多”禁止與terfenadine、astemizole或cisapride併用。

警語/注意事項：

“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 (參閱**可能的藥物不良反應**)。故當有嚴重的肝功能變化時，則應停止“可蘇多”治療。“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**禁忌及交互作用**)。

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；“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。

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。

可能的藥物不良反應：

一般而言，“可蘇多”具有良好的耐受性，非常少的病人因該藥的副作用而停用。

表一 不良反應發生率

頻率	系統器官分類	事件
極常見 (≥10%)	生殖系統及乳房	乳房觸痛 ¹
		男性女乳症 ¹
常見 (≥1% - <10%)	全身性障礙	熱潮紅 ¹
		腹瀉
	胃腸	噁心
	肝膽	肝臟功能變化 (轉胺酵素的濃度升高及黃疸) ²
	全身性障礙	虛弱
不常見 (≥0.1% - <1%)	免疫系統	搔癢
		過敏反應，包括血管神經性水腫及蕁麻疹
罕見 (≥0.01% - <0.1%)	呼吸、胸腔及縱膈	間質性肺部疾病
	胃腸	嘔吐
	皮膚及皮下組織	皮膚乾燥
	肝膽	肝衰竭 ³

1. 可因伴隨的去勢療法而降低。
2. 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**警語/注意事項**）。
3. 曾有極少數接受“可蘇多”治療的患者發生肝衰竭，但其間的因果關係尚未確立。故應考慮定期做肝功能檢測（參閱**警語/注意事項**）。

此外，臨床試驗顯示併用“可蘇多”及LHRH類似劑期間，曾發現以下的不良反應（以研究醫師的觀點，可能的不良藥物反應，其機率為 $\geq 1\%$ ），這些不良反應與藥品治療兩者之間的因果關係尚未有結論，而且其中某些不良反應是老年病人常見的現象：

1. 心血管系統：心衰竭。
2. 胃腸道系統：食慾喪失、口乾、消化不良、便秘、脹氣。
3. 中樞神經系統：暈眩、失眠、嗜睡、降低性慾。
4. 呼吸系統：呼吸困難。
5. 泌尿系統：陽痿、夜尿。
6. 血液系統：貧血。
7. 皮膚和四肢：禿髮、皮疹、出汗及多毛症。
8. 代謝及營養：糖尿病、高血糖、水腫、體重增加、體重減輕。
9. 全身：腹痛、胸痛、頭痛、疼痛、骨盆痛、寒顫。

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：

“可蘇多”是一種非類固醇的抗男性素，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，因此可抑制男性素的刺激。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，其抗男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，也因此“可蘇多”適合每天服用一次。

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 $\mu\text{g/ml}$ ；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”具有高蛋白結合率(消旋性異構物為96%，(R)-型異構物為99.6%)，且廣泛的被代謝(經氧化和葡萄糖醛苷酸化)。其代謝物經由腎臟和膽汁以大約相等的比例排出。

臨床前試驗的安全性資料：

在動物，“可蘇多”是一種強效的抗男性素，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。於人類並無發現酵素誘導的作用。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。

儲藏的特殊注意事項：

儲存勿超過30°C以上。

保存期限

請參閱藥品包裝或外盒上的有效期限。

包裝

包裝數量請參閱外盒。

修訂日期

2004年8月

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

07/JC/TW.ONC.000-044-614.7.0

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