

常見適應症 (藥物於 1995 年 FDA 允許上市)

- 轉移性去勢療法無效前列腺癌。
- 病人還應同時接受促性腺激素釋放激素類似物。

適應症	試驗結果	用法 劑量
Prostate cancer, metastatic: Oral: 50 mg once daily (in combination with an LHRH analogue)	<p>RTC : 813 pts (allocated 1:1)bicalutamide (50 mg qd) vs flutamide (250 mg tid) and (allocated 2:1)goserelin (3.6 mg every 28 days) and leuprolide acetate (7.5 mg every 28 days).</p> <ul style="list-style-type: none"> ■ Time to treatment failure: bicalutamide+ LHRH-A group better than flutamide + LHRH-A group.(hazard ratio of 0.749) ■ Survival, quality of life, and subjective response were similar between groups. <p>ADR : Diarrhea 24% vs 10% (P < 0.001).</p> <p>Urology 1995 May;45(5):745-52</p>	單用 50mg 口服

* mPFS: median progression free survival; ORR: Objective response rate; DOR: duration of response, CR :complete response, MDR : The median

duration of response, DC : Disease control OS :overall survival, mOS : median Survival RCT :Randomized controlled trial , ADR : adverse drug reaction

作用機轉

Bicalutamide 是一種純非類固醇抗男性荷爾蒙受體抑制劑，特別是 dihydrotestosterone 與 testosterone 結合的競爭性抑制劑；防止睾酮刺激前列腺癌中的細胞生長。

致吐性及骨髓方面副作用

- 致吐性：輕致吐風險（低於 10%的病人會發生嘔吐）
- 抑制血球生長程度：貧血 (11%)

注意事項及常見副作用

1. 心臟血管方面副作用：周邊水腫 (13%)、胸痛 (8%)、高血壓 (8%)、心絞痛 (2% 至 <5%)、心臟衰竭 (2% 至 <5%)、冠狀動脈疾病 (2% 至 <5%)、水腫 (2% 至 <5%)、心肌梗塞 (2% 至 <5%)、暈厥 (2% 至 <5%)
2. 中樞神經副作用：疼痛 (35%)、頭暈 (10%)、感覺異常 (8%)、頭痛 (7%)、失眠 (7%)、肌無力 (7%)、焦慮 (5%)、寒戰 (2%) 至 <5%)、意識模糊 (2% 至 <5%)、嗜睡 (2% 至 <5%)、肌張力亢進 (2% 至 <5%)、緊張 (2% 至 <5%)、神經病變 (2% <5%)、抑鬱症 (4%)
3. 皮膚方面副作用：皮疹 (9%)、出汗 (6%)、脫髮 (2% 至 <5%)、瘙癢 (2% 至 <5%)、乾皮病 (2% 至 <5%)
4. 代謝及內分泌方面副作用：熱潮紅 (53%)、男性女乳症 (9%；單一療法 [150 mg]：38% 至 73%、體重減輕 (7%)、高血糖 (6%)、體重增加 (5%)、性慾下降 (2% 到 <5%)、脫水 (2% 到 <5%)、痛風 (2% 到 <5%)、高膽固醇血症 (2% 到 <5%)
5. 胃腸方面副作用：便秘 (22%)、噁心 (15%)、腹瀉 (12%)、腹痛 (11%)、消化不良 (7%)、厭食 (6%)、脹氣 (6%)、嘔吐 (6%)，吞嚥困難 (2% 至 <5%)，疝氣 (2% 至 <5%)，黑便 (2% 至 <5%)，牙周膿腫 (2% 至 <5%)，口乾 (2% 至 <5%)

6. 肝臟方面副作用：肝臟指數升高 (7%) ，血清鹼性磷酸酶升高 (5%) 。
7. 肌肉骨骼方面副作用：背痛 (25%)、虛弱 (22%)、骨痛 (9%)、關節炎 (5%)、腿抽筋 (2% 至 <5%)、肌痛 (2% 至 <5%)、頸部疼痛 (2% 至 <5%) ，病理性骨折 (4%) 。可用普拿疼止痛。
8. 腎臟方面副作用：多尿 (6%) 、腎積水 (2% 至 <5%) 、血尿素氮升高 (2% 至 <5%) 、血清肌酐升高 (2% 至 <5%)
9. 泌尿生殖系統：乳腺痛 (6% ；單一療法 [150 mg] : 39% 至 85%) ，盆腔疼痛 (21%) ，血尿 (12%) ，夜尿 (12%) 尿路感染 (9%) ，陽痿 (7%)、排尿困難 (5%)、尿瀦留 (5%)、排尿困難 (2% 至 <5%)、尿急 (2% 至 <5%)、尿失禁 (4%)
10. 感染系統：感染 (18%) 帶狀皰疹 (2% 至 <5%)、敗血症 (2% 至 <5%)
11. 呼吸系統方面副作用：呼吸困難 (13%)、咳嗽 (8%)、咽炎 (8%)、流感樣症狀 (7%)、支氣管炎 (6%)、哮喘 (2% 至 <5%)、鼻出血 (2% 至 <5%)、鼻竇炎 (2% 至 <5%)、肺炎 (4%)、鼻炎 (4%)。
12. 視覺系統：白內障 (2% 至 <5%)

註釋：當癌症藥物進行臨床試驗時，所收載的副作用，包括：藥物本身的副作用、原本疾病表現的症狀，或是當下併用的其他藥物的可能副作用。藥物副作用的定義是由美國癌症研究院制訂的常見毒性標準 (Common Terminology Criteria for Adverse Events, CTCAE)，常使用來描述病人接受化學治療後，所發生器官毒性的嚴重度分級。毒性分級由器官系統的特別分類，分為輕微 (1 級)、中級 (2 級)、嚴重 (3 級)、致命 (4 級) 或死亡 (5 級)。當發生 3 級以上的副作用時，需醫療介入處理且進行劑量調整或停藥；若發生 4 級情形，大多需要住院介入醫療處理。

劑量調整

- 腎功能不全者：不需調整
- 肝功能不全者：
 - 輕度、中度 重度(Child-Pugh class A、B、C)：不需要調整劑量
- 依據副作用調整：
 - 治療中肝功能不全: ALT >2 times ULN (正常上限值),或黃疸:直接停藥

警告/注意事項與不良反應有關的處理

副作用	處理
血液方面：睾酮抑制可能會導致貧血	請按照指示定時監測 CBC。
<p>肝毒性</p> <ul style="list-style-type: none"> ■ 目前已出現因嚴重肝損傷導致死亡或住院的相關報告（藥品上市後）； ■ 肝毒性通常發生在治療的前 3 至 4 個月內。中度至重度肝功能不全者請慎用。 ■ 請監測肝功能（基礎值和定期檢驗） ■ 可能出現肝功能障礙的臨床徵兆/症狀（例如，噁心、嘔吐、腹痛、疲勞、厭食、流感樣症狀、尿色深、黃疸、右上腹痛） 	及時監測肝功能檢查；如果出現黃疸或 ALT > 2 × ULN，則必須停藥。
超敏反應：據報導會出現血管神經性水和蕁麻疹。	
間質性肺炎：大多發生於高於建議劑量，但發生報導很少（包括死亡）。	及時評估呼吸道症狀（如呼吸困難、咳嗽和發燒）的任何惡化情況。
<p>心血管疾病：</p> <ul style="list-style-type: none"> ■ 雄激素去勢療法可能會增加心血管疾病的風險。 ■ 雄激素去勢治療可能導致 QT/QTc 間距延長；評估 QT 間期延長症候群、心臟衰竭的病人、經常性電解質異常的病人、「服用已知可延長 QT 間距藥物」的病人使用 bicalutamide 的風險與好處。 	於使用藥物前，維持電解質平衡，並考慮定期監測電解質和心電圖

<p>骨礦物質密度降低：</p> <ul style="list-style-type: none"> ■ 長期使用抗雄性激素治療造成骨礦物質密度降低、以及骨質疏鬆症，和增加骨折風險； ■ 酗酒、具骨質疏鬆症家族史和/或長期使用能夠減少骨量的藥物（如皮質類固醇）的病人，可能會增加風險。 	<p>在開始治療前仔細評估風險。補充鈣與維他命 D3。</p>
<p>糖尿病：</p> <ul style="list-style-type: none"> ■ 當與促性腺激素釋放激素聯合使用時，出現糖尿病患者出現血糖控制失控和葡萄糖耐量降低的相關報告。 	<p>定時監控血糖。</p>
<p>肝功能不全：</p> <ul style="list-style-type: none"> ■ 中度至重度功能障礙者慎用； ■ bicalutamide 經肝臟代謝。有限的數據顯示，當肝功能嚴重受損時可能會延遲代謝，導致進一步的藥物蓄積。 	<ul style="list-style-type: none"> ■ 考慮在長期治療的同時定期監測肝功能。

藥物交互作用

- Inhibits CYP3A4 (weak)
- 存在潛在的顯著藥物交互作用，需要調整劑量或頻率，附加監測和/或選擇替代療法。請查閱藥物交互作用資料庫以取得更多詳細訊息。

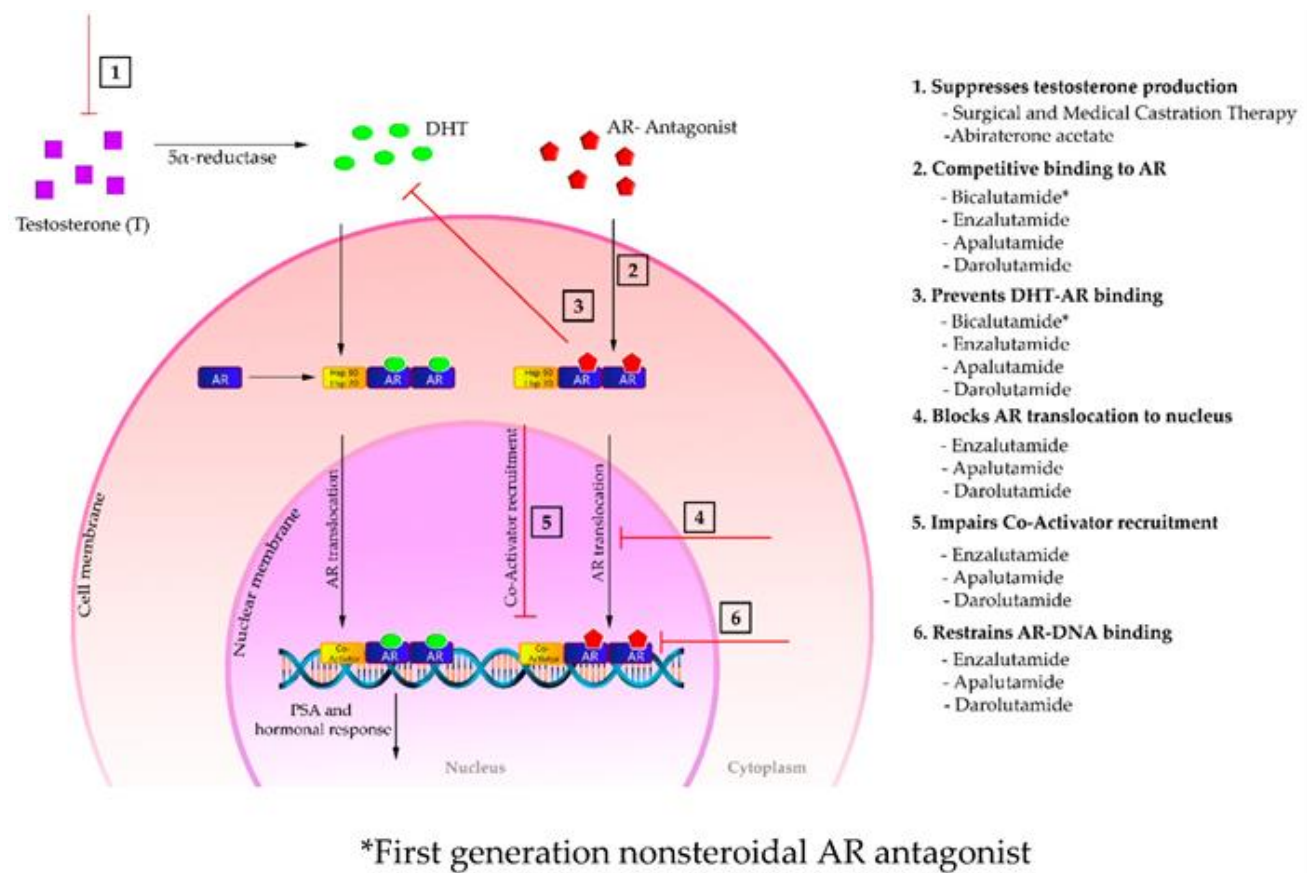
臨床監測項目

- 監控醫囑遵從性。
- CBC 血球計數、肝功能(基礎值、定期)、INR
- 血壓(基礎值、定期監測)
- 心電圖、心臟超音波、血清睾酮素(testosterone)、促黃體激素、PSA

- 肝功能檢查基礎值與常規檢查，並在治療的前 4 個月內定期複檢，此後定期進行；
- 監測糖尿病人的血糖。
- 如果在服用 warfarin 病人中開始使用。

機轉

Bicalutamide 是一種純非類固醇抗男性荷爾蒙受體抑制劑，特別是 dihydrotestosterone 與 testosterone 結合的競爭性抑制劑；防止睾酮刺激前列腺癌中的細胞生長。



藥師小叮嚀

1. 一天一次，固定時間服用（飯前飯後皆可）。整粒吞服、勿咬碎，或打開膠囊。若錯過服藥時間，直接在下次服藥時間吃藥即可，不需補吃遺漏的劑量。
2. 接受 bicalutamide 治療的病人還應同時接受促性腺激素釋放激素類似物（或接受過雙側睪丸切除術）。
3. bicalutamide 與許多藥物有交互作用，請與藥師確認您目前所服用的藥物之間是否有相關的藥物交互作用。
4. bicalutamide 可能引起精子形態變化、抑制精子產生和損害男性生育能力。此藥可能會影響生育能力及胎兒發育，病人於服藥期間至停藥後 130 天應採有效避孕措施。
5. 可能會使血壓上升，增加心血管疾病的風險。請監測血壓。
6. 副作用等級 3/4 級即表示該副作用需要入院接受治療。
7. 臨床監測項目: 定期監測心電圖和電解質。