



抑癌特[®]膜衣錠1毫克，5毫克

INLYTA[®] Film-Coated Tablets 1 mg、5 mg

1 mg 衛署藥輸字第025853號
5 mg 衛署藥輸字第025854號

1 適應症與用途

INLYTA適用於治療已接受過sunitinib或cytokine治療失敗的晚期腎細胞癌(RCC)病患。

2 用法用量

2.1 建議劑量

INLYTA的建議起始口服劑量為5毫克每日兩次，兩次劑量間隔約12小時。INLYTA可與食物併服，亦可與食物併服[參見臨床藥理學(12.3)]。INLYTA應以一杯水整顆吞服。

如果患者嘔出藥物或漏服一劑藥物，不可額外多服用一劑。應按照平常的時間服用下一劑處方劑量。

2.2 劑量調整指引

建議依據個人的安全性與耐受性表現來提高或降低劑量。

對可耐受5毫克每日兩次之INLYTA起始劑量治療，未出現任何大於第2級之不良反應(根據通用不良事件毒性標準[CTCAE])至少連續兩週、血壓正常、且未使用抗高血壓藥物者，可將其劑量提高至7毫克每天兩次，之後，依據相同標準，對可耐受7毫克每日兩次之INLYTA劑量的患者，可進一步提高至10毫克每日兩次的最高劑量。

在處理某些藥物不良反應時，可能須暫時中斷或永久停用INLYTA及(或)降低INLYTA的劑量[參見警語及注意事項(5)]。當必須從5毫克每日兩次降低劑量時，建議劑量為3毫克每日兩次；若必須再進一步降低劑量時，建議劑量為2毫克每日兩次。

強效的CYP3A4/5抑制劑：INLYTA應避免與強效的CYP3A4/5抑制劑(如ketoconazole、itraconazole、clarithromycin、vorfenazole、nefazodone、nelfinavir、ritonavir、saquinavir、telithromycin及voriconazole)合併投予。建議選擇其它不具CYP3A4/5抑制作用或CYP3A4/5抑制作用極低的併用藥物。雖然目前尚未針對正在使用強效CYP3A4/5抑制劑的患者研究過INLYTA的劑量調整方式，但如果必須與強效的CYP3A4/5抑制劑併用，建議將INLYTA的劑量降低至一半，因為此劑量調降方式是用來調整axitinib的血漿濃度比上時間的曲線下面積(AUC)至沒有抑制劑的情況下所觀察到的範圍。後續劑量可依個人的安全性及耐受性調高或降低。要停止與這類強效的抑制劑併用時，應將INLYTA的劑量回復(在該抑制劑3-5個半衰期之後)到開始與該強效CYP3A4/5抑制劑併用之前所使用的劑量。[參見藥物交互作用(7.1)及臨床藥理學(12.3)]

肝功能受損：對輕度肝功能受損(Child-Pugh A級)的患者投予INLYTA時，並不須調整起始劑量。依據藥物動力學資料，對中度肝功能受損(Child-Pugh B級)的患者投予INLYTA時，應將起始劑量降低至一半。後續劑量可依個人的安全性和耐受性增加或調降。目前尚未針對嚴重肝功能受損(Child-Pugh C級)的患者進行過INLYTA的研究。[參見警語及注意事項(5.11)、特殊族群之使用(8.6)及臨床藥理學(12.3)]

3 劑型與含量

INLYTA 1毫克錠劑：紅色的橢圓形膜衣錠，一面印有「Pfizer」字樣，另一面印有「1 XNB」字樣。

INLYTA 5毫克錠劑：紅色的三角形膜衣錠，一面印有「Pfizer」字樣，另一面印有「5 XNB」字樣。

4 禁忌

無。

5 警語及注意事項

5.1 高血壓及高血壓危險

在一項使用INLYTA治療RCC患者的對照性臨床研究中，有145/359位(40%)接受INLYTA治療的患者及103/355位(29%)接受sorafenib治療的患者通報出現高血壓的現象。其中有56/359位(16%)接受INLYTA治療的患者及39/355位(11%)接受sorafenib治療的患者發生第3/4級高血壓。有2/359位(<1%)接受INLYTA治療的患者通報發生高血壓危險，在接受sorafenib治療的患者中則無此類病例。發生高血壓(收縮壓>150 mmHg或舒張壓>100 mmHg)的時間中位數都在開始使用INLYTA治療的第一個月內，且在開始使用INLYTA治療的4天後便使用觀察到血壓升高的現象。高血壓的處理採用標準的抗高血壓療法。有1/359位(<1%)接受INLYTA治療的患者因發生高血壓而停止使用INLYTA治療，在接受sorafenib治療的患者中則無此類病例。[參見不良反應(6.1)]

在開始使用INLYTA之前，應使血壓獲得良好的控制。應監視患者是否出現高血壓的現象，並視需要以標準的抗高血壓療法治療。如果血壓在使用抗高血壓藥物之後仍持續偏高，則應降低INLYTA的劑量。對已接受標準的抗高血壓療法治療且INLYTA的劑量已調降，但仍持續嚴重高血壓的患者，應停用INLYTA。若有證據顯示為高血壓危險，應停用INLYTA。正在使用抗高血壓藥物治療的患者如果停用INLYTA，應小心監視是否有出現低血壓的現象。[參見用法用量(2.2)]

5.2 動脈血栓栓塞事件

在臨床試驗中，有動脈血栓栓塞事件(包括死亡的案例)被通報。在一項使用INLYTA治療RCC患者的對照性臨床研究中，有4/359位(1%)接受INLYTA治療的患者及4/355位(1%)接受sorafenib治療的患者通報發生第3/4級動脈血栓栓塞事件。有1/359位(<1%)接受INLYTA治療的患者通報發生致死性腦血管意外事件，在接受sorafenib治療的患者中則無此類病例。[參見不良反應(6.1)]

在INLYTA的臨床研究中，有17/715位(2%)受試者通報發生動脈血栓栓塞事件(包括暫時性缺血性心臟病發作、腦血管意外、心肌梗塞及視網膜動脈阻塞)，而有2例因為腦血管意外而死亡。

對有發生這類事件之風險或病史的患者，使用INLYTA時應謹慎。目前尚未針對在過去12個月內曾發生動脈血栓栓塞事件的患者進行過INLYTA的研究。

5.3 靜脈血栓栓塞事件

在臨床研究中，有靜脈血栓栓塞事件(包括死亡的案例)被通報。在一項使用INLYTA治療RCC患者的對照性臨床研究中，有11/359位(3%)接受INLYTA治療的患者及2/355位(1%)接受sorafenib治療的患者通報發生靜脈血栓栓塞事件。其中有9/359位(3%)接受INLYTA治療的患者及2/355位(1%)接受sorafenib治療的患者發生第3/4級靜脈血栓栓塞事件(包括肺栓塞、深部靜脈血栓、視網膜靜脈阻塞及視網膜靜脈血栓)。有1/359位(<1%)接受INLYTA治療的患者發生致命的肺栓塞，在接受sorafenib治療的患者中則無此類病例。在INLYTA的臨床研究中，有22/715位(3%)受試者通報發生靜脈血栓栓塞事件，而有兩例因為肺栓塞而死亡。

對有發生這類事件之風險或病史的患者，使用INLYTA時應謹慎。目前尚未針對在過去6個月內曾發生靜脈血栓栓塞事件的患者進行過INLYTA的研究。

5.4 出血

在一項使用INLYTA治療RCC患者的對照性臨床研究中，有58/359位(16%)接受INLYTA治療的患者及64/355位(18%)接受sorafenib治療的患者通報發生出血事件。在使用INLYTA治療的患者中，最常見的出血事件包括鼻出血(6%)、血尿(3%)、咳血(2%)及直腸出血(2%)。其中有5/359位(1%)接受INLYTA治療的患者及11/355位(3%)接受sorafenib治療的患者發生第3/4級的出血事件(包括腦出血、血尿、咳血、下胃腸道出血及黑便)。有1/359位(<1%)接受INLYTA治療的患者(胃出血)及3/355位(1%)接受sorafenib治療的患者發生致命的出血事件。目前尚未針對已證實發生未治療之腦轉移或最近曾發生活動性胃腸出血的患者進行過INLYTA的研究，因此不可用於這些患者。有任何出血事件須介入治療時，應暫時中斷投予INLYTA。

5.5 胃腸穿孔與瘻管形成

在一項使用INLYTA治療RCC患者的對照性臨床研究中，有1/359位(<1%)接受INLYTA治療的患者通報發生胃腸穿孔，在接受sorafenib治療的患者中則無此類病例。在INLYTA的臨床研究中，有5/715位(1%)患者發生胃腸穿孔，包括一死亡病例；此外，有4/715位(1%)患者發生瘻管。

在整個使用INLYTA治療的過程都應定期監視是否出現胃腸穿孔或瘻管的症狀。

5.6 甲狀腺功能障礙

在一項使用INLYTA治療RCC患者的對照性臨床研究中，有69/359位(19%)接受INLYTA治療的患者及29/355位(8%)接受sorafenib治療的患者通報出現甲狀腺機能低下的現象。有4/359位(1%)接受INLYTA治療的患者及4/355位(1%)接受sorafenib治療的患者通報出現甲狀腺機能亢進的現象。在治療前甲狀腺刺激素(TSH) <5 µU/mL的患者中，有79/245位(32%)接受INLYTA治療的患者及25/232位(11%)接受sorafenib治療的患者出現TSH升高至≥10 µU/mL的現象。[參見不良反應(6.1)]

在開始使用INLYTA治療之前應先檢測甲狀腺功能，在整個治療期間亦應定期監測。甲狀腺機能低下與甲狀腺機能亢進的現象應依據標準醫療常規予以治療，使甲狀腺功能維持正常狀態。