كازوتاميد مضغوطات ملبسة بالفيلم

بيكالوتاميد 50 ملغ

التركيب و السواغات:

كل مضغوطة ملبسة بالفيلم تحوي بيكالوتاميد 50 ملغ.

السواغات: لاكتوز مونوهيدرات، شمعات المغنزيوم، صوديوم ستارش غليكولات، بوفيدون ك30.

سواغات التلبيس: بولي ايتيلين غليكول 400، هيبروميلوز، ثيتانيوم دي أوكسيد.

آلية التأثير:

بيكالوتاميد مثبط غير ستيرويدي لمستقبلات الأندروجين. يثبط بشكل كامل عمل الأندروجين من خلال الارتباط مع مستوزول المستقبلات الأندروجينية في الأنسجة الهدف.

الحرائك الدوائية:

الإمتصاص: يمتص بيكالوتاميد بشكل جيد بعد إعطائه فمويا .الإعطاء المشترك للبيكالوتاميد مع الطعام ليس له تأثير سريري ملحوظ على معدل أو حجم الامتصاص.

التوزع: يرتبط بيكالوتاميد بشكل كبير مع البروتين 96%

الإستقلاب/الإطراح: يخضع بيكالوتاميد لإستقلاب متنوع فراغي.كلا المركب الأم والمستقبلات الغلوكورونية تطرح في البول و البراز .

الاستطبابات:

تستطب مضغوطات بيكالوتاميد 50 ملغ يوميا كعلاج متشارك مع مضاهئات الهرمون المطلق للهرمون الملوتن لمعالجة سرطان البروستات النقيلي من المرحلة D .

مضادات الاستطبابات :

• يعد مضاد استطباب عند أي مريض لديه تفاعلات فرط حساسية تجاه الدواء أو أي من مكونات المستحضر .
سجلت تقارير عن تفاعلات فرط حساسية تتضمن ودمة وعائية عصبية و شرى.

• ليس له استطباب عند النساء ويجب أن لا يستخدم عند هؤلاء الأشخاص .

• يمكن أن يسبب ضرر مميت عندما يعطى للنساء الحوامل. يعد بيكالوتاميد مضاد استطباب عند النساء بما في ذلك الحوامل أو اللواتي من الممكن أن يصبحن حوامل.

التحذيرات:

التهاب الكبد: سجلت حالات من الموت أو دخول المشفى بسبب الأذية الكبدية الشديدة (فشل كبدي) بالترافق مع استخدام البيكالوتاميد . حصلت السمية الكبدية في تلك التقارير عموما خلال الأشهر الثلاث أو الاربع الأولى من المعالجة . يجب قياس مستويات أنزيمات الترانسفيراز في المصل قبل البدء بالمعالجة بالبيكالوتاميد بفاصل منتظم خلال الأشهر الأربعة الأولى من المعالجة ودوريا بعد ذلك . في حال ظهور الأعراض السريرية أو العلامات التي تشير إلى خلل الوظيفة الكبدية .يجب قياس تركيز أنزيمات الترانسامينار في المصل ، وخاصة تركيز أنزيم ال ALT على الفور . عند إصابة المريض بيرقان أو ارتفاع في قيمة أنزيم ال ALT ضعفي الحدود الطبيعية ، يجب إيقاف إعطاء البيكالوتاميد مع متابعة دقيقة لوظائف الكبد .

تندي الرجل و ألم الثدي: سجلت حالات من تثدي الرجل و ألم الثدي بنسبة 38 % و39 % من المرضى , على التوالي .

تحمل السكر: لوحظ عند الذكور الذين يتناولوا مضاهئات الهرمون المطلق للهرمون الملوتن انخفاض في تحمل السكر . وهذا من الممكن أن يتظاهر كداء السكري أو كفقدان بضبط نسبة السكر عند هؤلاء الذين لديهم داء سكري مسبقا .

التحاليل المخبرية: قد تكون القياسات المنتظمة للمستضد النوعي للبروستات في المصل (PSA) مفيدة في مراقبة استجابة المريض. إذا ارتفعت مستويات PSA خلال العلاج ببيكالوتاميد، يجب تقييم المريض للتقدم السريري. للمرضى الذين لديهم تقدم موضوعي للمرض مع ارتفاع PSA ، يؤخذ بعين الاعتبار فترة خالية من العلاج بمضادات الأندروجين أثناء الاستمرار بمضاهئات الهرمون المطلق للهرمون الملوتن.

الحمل , الفئة x :

يمكن أن يسبب البيكالوتاميد ضررا مميتا عندما يعطى للنساء الحوامل . يعد بيكالوتاميد مضاد استطباب عند النساء بما في ذلك الحوامل أو اللواتي قد يحملن .

في حال استخدام الدواء أثناء الحمل , أو في حال أصبحت المريضة حاملا أثناء تناولها لهذا الدواء يجب إعلام المريضة بالأخطار المحتملة على الجنين .

النساء المرضعات :

لا يستطب بيكالوتاميد عند النساء .

الاستعمال عند الأطفال:

لم يتم إثبات أمان و فعالية البيكالوتاميد عند المرضى الأطفال.

الاستعمال عند المسنين:

في دراستين على المرضى الذين تناولوا 50 أو 150 ملغ يوميا، لم تظهر أي علاقة كبيرة بين العمر ومستويات الحالة الثابتة للبيكالوتاميد كاملا أو المصاوغ المراتي R الفعال.

الاعتلال الكبدي:

يجب استخدام بيكالوتاميد بحذر عند المرضى الذين يعانون من اعتلال كبدي متوسط إلى شديد. يستقلب البيكالوتاميد بشكل كبير من قبل الكبد. تشير البيانات المحدودة عند الأشخاص الذين يعانون من اعتلال كبدي شديد إلى أن إفراز البيكالوتاميد قد يتأخر ويمكن أن يؤدي إلى تراكم إضافي. يجب الأخذ بعين الاعتبار تحاليل وظائف الكبد الدورية لمرضى الاعتلال الكبدي بالعلاج على المدى الطويل.

الاعتلال الكلوي:

ليس للاعتلال الكلوي تأثير كبير على الإطراح على كامل البيكالوتاميد أو على المصاوغ المراتي R الفعال.

التداخلات الدوائية:

• لم تظهر الدراسات السريرية أية تداخلات بين بيكالوتاميد و مضاهئات الهرمون المطلق للهرمون الملوتن (كوزيرلين أو ليبرولايد) . لا يوجد أية دليل على أن بيكالوتاميد يحفز أنزيمات الكبد .

• أظهرت دراسات الارتباط بالبروتين في المختبر أن البيكالوتاميد يمكن أن يزيح مضادات التخثر الكومارينية من مواضع الارتباط . يجب مراقبة زمن البروترمبين بدقة عند المرضى الذين يتناولون مضادات التخثر الكومارينية بشكل مسبق و الذين بدأوا بالبيكالوتاميد وقد يكون ضروريا تعديل جرعة مضاد التخثر .

• أظهرت الدراسات في المختبر أن R – بيكالوتاميد يعد مثبط لل CYP 3A4 مع تأثير مثبط أقل لفعالية CYP 2C19 ,CYP 2C9 و 2D6. وبالتالي يجب أخذ الحذر عند الإعطاء المتزامن للبيكالوتاميد مع ركائز CYP 3A4.

الآثار الجانبية :

الآثار الجانبية التي تحدث بنسبة ≤ 5 %

ألام (عامة) , ألام الظهر , وهن , ألام الحوض , إنتان , ألام في البطن , ألام في الصدر، صداع ، أعراض إنفلونزا ، هبات ساخنة ، ارتفاع ضغط ، إمساك ،غثيان ، إسهال ، زيادة في تحاليل أنزيمات الكبد ، عسر هضم ، تعطل ، فقدان شهية ، إقياء ، فقر الدم ،ودمة محيطية ،فقدان الوزن ،فرط سكر الدم ، ارتفاع في الفوسفاتاز القلوية ، زيادة الوزن ، آلام العظام ،الوهن العضلي، التهاب المفاصل ،كسور مرضية ، دوخة ، مذل ، أرق ، قلق ، اكتئاب ،ضيق نفس ،زيادة السعال ،التهاب البلعوم ، التهاب الشعب الهوائية ،التهاب رئوي، التهاب الأنف, طفح, تعرق، بوال ليلي ، بيلة دموية, إنتان المسالك البولية، تثدي الرجل، عنانة ، آلام الثدي ، تردد بولي ،احتباس البول ، ضعف البول ، سلس البول.

الاثار الجانبية التي تحدث بنسبة ≤ 2٪ ، و لكن أقل من 5٪:

ورم ، ألم رقبة ، حرارة ، قشعريرة ، إنتان , فتق ، كيسة ، ذبحة صدرية ، فشل القلب الاحتقاني ، احتشاء العضلة القلبية ،توقف القلب , اضطراب الشريان التاجي ، غشي ، تغوط أسود ، نزف بالمستقيم ، جفاف الفم ، عسر بلع ، خراج دواعم السن ، سرطان معدي معوي ، ودمة ، ارتفاع نتروجين يوريا الدم ، زيادة في الكرياتينين ، تجفاف ، نقرس ، ارتفاع كوليسترول الدم ، ألم عضلي ، معصلات في الساق ، فرط الضغط ، تخليط ، نعاس ، انخفاض الشبق ، اعتلال اعصاب ، عصبية ، اضطرابات في الرئة ، ربو ، رعاف ، التهاب جيوب انفية ، جفاف جلد ، ثعلبة ، حكة ، هربس نطاقي ، ساد معين ، عسر التبول ،إلحاح بولي ، موه الكلية ، اضطرابات المسالك البولية .

الجرعة و طريقة الاستعمال:

الجرعة الموصى بها للمعالجة لمضغوطات البيكالوتاميد بالمشاركة مع مضاهئات الهرمون المطلق للهرمون الملوتن هي مضغوطة واحدة 50 ملغ يوميا (صباحا أو مساء) مع أو بدون طعام . من المفضل أن يؤخذ بيكالوتاميد بنفس الوقت من كل يوم .

يجب أن تبدأ المعالجة ببيكالوتاميد بنفس وقت المعالجة بمضاهئات الهرمون المطلق للهرمون الملوتن. عند نسيان جرعة البيكالوتاميد تؤخذ الجرعة التالية حسب الجدول الجرعي , لا تؤخذ الجرعة المنسية ولا تضاعف الجرعة التالية .

تعديل الجرعة في حالة الاعتلال الكلوي: لايوجد حاجة لتعديل الجرعة عند مرضى الاعتلال الكلوي .

تعديل الجرعة في حالة الاعتلال الكبدي: لايوجد حاجة لتعديل الجرعة .

فرط الجرعة:

لم يتم تسجيل أن جرعة وحيدة من البيكالوتاميد تؤدي إلى أعراض فرط جرعة تعتبر مهددة للحياة . لايوجد ترياق نوعي ويجب أن تكون معالجة فرط الجرعة عرضية . بما أن البيكالوتاميد يرتبط بقوة بالبروتين ويستقلب بشكل كبير لا يمكن أن يكون التحال فعال.

شروط الحفظ:

يحفظ في درجة حرارة تحت 25° مئوية.

التعبئة: شريطين من البليستر PVC-Alu تحتوي كل منها على 10 مضغوطات ملبسة بالفيلم معبأة ضمن عبوة كرتونية.

إن هذا دواء
- الدواء مستحضر ولكن ليس كغيره من المستحضرات. - الدواء مستحضر يؤثر على صحتك، واستهلاكه خلافا للتعليمات يعرضك للخطر. - اتبع بدقة وصفة الطبيب وطريقة الاستعمال المنصوص عليها، وتعليمات الصيدلاني الذي صرفها لك. فالطبيب والصيدلاني هما الخبيران بالدواء ونفعه وضرره. - لا تقطع مدة العلاج المحددة من تلقاء نفسك. - لا تكرر صرف الدواء بدون استشارة الطبيب.
لا تترك الأدوية أبدا في متناول أيدي الأطفال (مجلس وزراء الصحة العرب) (اتحاد الصيادلة العرب)

إنتاج: IDM الدولية للدواء - حلب - سوريا

ISO 9001 ISO 14001 ISO 45001

U1017-LFH-169rev01

Casotamide Film coated tablets

Bicalutamide 50 mg

Composition and Excipients:
Each Film coated tablet contains bicalutamide 50 mg.
Excipients: lactose monohydrate, magnesium stearate, sodium starch glycolate, PVP k30.
Coating Excipients: PEG 400, Hypromellose, titanium dioxide.

Mechanism of Action:
Bicalutamide is a nonsteroidal androgen receptor inhibitor. It competitively inhibits the action of androgens by binding to cytosol androgen receptors in the target tissue.

Pharmacokinetics:
Absorption: Bicalutamide is well absorbed following oral administration. Coadministration of Bicalutamide with food has no clinically significant effect on rate or extent of absorption.
Distribution: Bicalutamide is highly protein bound (96%).
Metabolism/Elimination: Bicalutamide undergoes stereospecific metabolism. Both the parent and metabolite glucuronides are eliminated in the urine and feces.

Indications:
Bicalutamide tablets 50 mg daily is indicated for use in combination therapy with a luteinizing hormone releasing hormone (LHRH) analog for the treatment of Stage D metastatic carcinoma of the prostate.

Contraindications:
• It is contraindicated in any patient who has shown a hypersensitivity reaction to the drug or any of the components. Hypersensitivity reactions including angioneurotic edema and urticaria have been reported.
• It has no indication for women, and should not be used in this population.
• It may cause fetal harm when administered to a pregnant woman. Bicalutamide is contraindicated in women, including those who are or may become pregnant.

Warnings:
Hepatitis: Cases of death or hospitalization due to severe liver injury (hepatic failure) have been reported in association with the use of Bicalutamide. Hepatotoxicity in these reports generally occurred within the first three to four months of treatment.
Serum transaminase levels should be measured prior to starting treatment with Bicalutamide, at regular intervals for the first four months of treatment, and periodically thereafter. If clinical symptoms or signs suggestive of liver dysfunction occur, the serum transaminases, in particular the serum ALT, should be measured immediately. If at any time a patient has jaundice, or their ALT rises above two times the upper limit of normal, Bicalutamide should be immediately discontinued with close follow-up of liver function.
Gynecomastia and Breast Pain: gynecomastia and breast pain have been reported in up to 38% and 39% of patients, respectively.
Glucose Tolerance: A reduction in glucose tolerance has been observed in males receiving LHRH agonists. This may manifest as diabetes or loss of glycemic control in those with preexisting diabetes. Consideration should therefore be given to monitoring blood glucose in patients receiving Bicalutamide in combination with LHRH agonists.
Laboratory Tests: Regular assessments of serum Prostate Specific Antigen (PSA) may be helpful in monitoring the patient's response. If PSA levels rise during Bicalutamide therapy, the patient should be evaluated for clinical progression. For patients who have objective progression of disease together with an elevated PSA, a treatment free period of anti-androgen, while continuing the LHRH analog, may be considered.

Pregnancy, CATEGORY X:
Bicalutamide may cause fetal harm when administered to a pregnant woman. Bicalutamide is contraindicated in women, including those who are or may become pregnant. If this drug is used during pregnancy, or if the patient becomes pregnant while taking this drug, the patient should be apprised of the potential hazard to a fetus.

Nursing Mothers:
Bicalutamide is not indicated for use in women.

Pediatric Use:
The safety and effectiveness of Bicalutamide in pediatric patients have not been established.

Geriatric Use:
In two studies in patients given 50 or 150 mg daily, no significant relationship between age and steady state levels of total Bicalutamide or the active R-enantiomer has been shown.

Hepatic Impairment:
Bicalutamide should be used with caution in patients with moderate to severe hepatic impairment. Bicalutamide is extensively metabolized by the liver. Limited data in subjects with severe hepatic impairment suggest that excretion of Bicalutamide may be delayed and could lead to further accumulation. Periodic liver function tests should be considered for hepatic impaired patients on long term therapy.

Renal Impairment:
Renal impairment had no significant effect on the elimination of total Bicalutamide or the active R-enantiomer.

Drug interactions:
• Clinical studies have not shown any drug interactions between Bicalutamide and LHRH analogs (goserelin or leuprolide). There is no evidence that Bicalutamide induces hepatic enzymes.
• In vitro protein binding studies have shown that Bicalutamide can displace coumarin anticoagulants from binding sites. Prothrombin times should be closely monitored in patients already receiving coumarin anticoagulants who are started on Bicalutamide and adjustment of the anticoagulant dose may be necessary.
•In vitro studies have shown that R-Bicalutamide is an inhibitor of CYP 3A4 with lesser inhibitory effects on CYP 2C9, 2C19 and 2D6 activity. Hence, caution should be exercised when Bicalutamide is coadministered with CYP 3A4 substrates.

Adverse reactions:
Incidence of Adverse Reactions ≥ 5%:
Pain (General), Back Pain, Asthenia, Pelvic Pain, Infection ,Abdominal Pain, Chest Pain ,Headache ,Flu Syndrome ,Hot Flashes ,Hypertension ,Constipation ,Nausea ,Diarrhea , Increased Liver Enzyme Test ,Dyspepsia ,Flatulence ,Anorexia, Vomiting , Anemia , Peripheral Edema ,Weight Loss ,Hyperglycemia , Increased Alkaline Phosphatase ,Weight Gain , Bone Pain, Myasthenia ,Arthritis ,Pathological Fracture ,Dizziness, Paresthesia, Insomnia ,Anxiety ,Depression ,Dyspnea , Increased Cough ,Pharyngitis ,Bronchitis, Pneumonia ,Rhinitis , Rash ,Sweating , Nocturia ,Hematuria, Urinary Tract Infection ,Gynecomastia ,Impotence , Breast Pain ,Urinary Frequency ,Urinary Retention , Impaired Urinary, Urinary Incontinence.
Incidence of Adverse Reactions greater than or equal to 2%, but less than 5%:
Neoplasm; Neck Pain; Fever; Chills; Sepsis; Hernia; Cyst, Angina Pectoris; Congestive Heart Failure; Myocardial Infarct; Heart Arrest; Coronary Artery Disorder; Syncope ,Melena; Rectal Hemorrhage; Dry Mouth; Dysphagia; Periodontal Abscess; Gastrointestinal Carcinoma, Edema; Increased BUN ; Increased Creatinine ; Dehydration; Gout; Hypercholesterolemia, Myalgia; Leg Cramps, Hypertonia; Confusion; Somnolence; Decreased Libido ; Neuropathy; Nervousness, Lung Disorder; Asthma; Epistaxis; Sinusitis ,Dry Skin; Alopecia; Pruritus; Herpes Zoster; Specified Cataract, Dysuria; Urinary Urgency; Hydronephrosis; Urinary Tract Disorder.

Dosage and administration:
The recommended dose for Bicalutamide tablets therapy in combination with an LHRH analog is one 50 mg tablet once daily (morning or evening), with or without food. It is recommended that Bicalutamide tablets be taken at the same time each day. Treatment with Bicalutamide tablets should be started at the same time as treatment with an LHRH analog. If a dose of Bicalutamide is missed, take the next dose at the scheduled time. Do not take the missed dose and do not double the next dose.
Dosage Adjustment in Renal Impairment: No dosage adjustment is necessary for patients with renal impairment.
Dosage Adjustment in Hepatic Impairment: No dosage adjustment is necessary

Overdosage:
A single dose of Bicalutamide that results in symptoms of an overdose considered to be life threatening has not been established.
There is no specific antidote. Treatment of an overdose should be symptomatic.
Dialysis is not likely to be helpful since Bicalutamide is highly protein bound and is extensively metabolized.

Storage conditions:
Store below 25° C.

Packaging: Two PVC-Alu blisters each contain 10 film coated tablets packed in a cardboard box.

THIS IS A MEDICAMENT

- A medicament is a product but unlike any other products
- A medicament is a product which affects your health, and its consumption contrary to instructions is dangerous for you.
- Follow strictly the doctor's prescription, the method of use and the instructions of the pharmacist who sold the medicament. The doctor and the pharmacist are experts in medicine, its benefits and risks.
- Do not by yourself interrupt the period of treatment prescribed for you.
- Do not repeat the same prescription without consulting your doctor.

KEEP MEDICAMENTS OUT OF REACH OF CHILDREN
(Council of Arab Health Ministers) (Arab Pharmacists Association)

Produced by: International Drug Manufacturig - Aleppo - Syria

U107-LFH-150Wrev01