

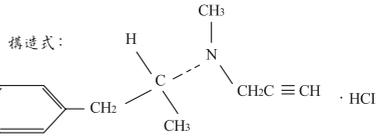
巴可癩 錠 (希利治林)

PARKRYL Tablets 5mg "LOTUS" (Selegiline)

【組成】：

Each tablet contains :

Selegiline Hydrochloride.....5mg



【賦形劑】：

Each tablet contains :

Povidone K29-32、Croscopovidone、Microcrystalline Cellulose PH102、Lactose Monohydrate USNF、Colloidal Silicon Dioxide、Stearic Acid

【臨床藥理學】：

關於 Selegiline 對巴金森症的有利作用機轉尚未完全被了解。B type 的 monoamine oxidase 活性抑制被認為是最重要的部分，所以 Selegiline 可能經由其他機轉來增加 dopamine 活性。Selegiline 以非可逆性 MAOI 著名，是一種與粒腺外膜聯合的一種細胞內酵素。Selegiline 以一種 "自殺型態" 的 Enzyme 代謝物來抑制 MAO，它被 MAO 轉換成活性的部位與 Enzyme 的 FAD 輔因子非可逆地結合。因為 Selegiline 對 B type 較 A type 活性部位具較大的親合力，所以在服用適當劑量，可提供為選擇性的 B type MAOI。

【服用指示】：

PARKRYL 對正在接受 Levodopa/carbidopa 治療但呈不良反應的巴金森症病人，可當作輔助藥，從監視研究證明 Selegiline 在缺乏 Levodopa 治療時並無有利之效果。此項證明是隨機取樣調查病患給付 Levodopa/carbidopa 治療，比較其服用 Selegiline 或安慰劑的條件下而得。Selegiline 非偶然地在以下三種結果表現出比代替品優秀，更改每日 Levodopa/carbidopa 劑量基準線，"off Time" 量及病患對治療成功的自我期許。有利的結果並出現在其成功的治療上，例如減少運動不能的末劑量，減少震顫及流涎，說話能力改進及著裝能力，穿衣不能的改進及與先前狀態比較的行走能力評估。

【配伍禁忌】：

對 Selegiline HCL 過敏者禁用。

【警語】：

Selegiline 每日劑量不可超過 10mg，否則會有 MAO 非選擇性抑制的危險，即使在每 10mg 的劑量下，Selegiline 對 MAOB 的選擇性並非是絕對的，並且選擇性會因增加而降低。MAOIs 通常不與 meperidine (DEMEROL) 併服，否則會有致命危險，甚至不可與其他 opioids 類同服，因為 MAOIs 與 meperidine 的作用機轉尚未得知，對其他 opioid、meperidine 均謹慎地避免同用。Selegiline 與 fluoxetine HCL (PROAC) 共用的決定性在臨床資料上仍未得知，但已有停服 fluoxetine 短暫時間內再服 non-selective MAOIs (NARDIL、PARNATE) 而致死的報告。Selegiline 至今仍無此種報告，雖然如此，但仍須小心避免同服，因為這反應的機轉不是充份了解。因 fluoxetine 具有長半衰期和活性代謝至少 5 週，才可開始 MAOI 的治療。基於 MAOIs 與三環抗抑鬱劑共同使用的經驗，應在停服一種 MAOI 至少 14 天後再開始用 fluoxetine。

【預防】：

A、一般：

有些病患在服用 Selegiline 後，可能會有 Levodopa 副作用增加的現象，這可能是因為 dopamine 量的增加與超敏感的 Post-synaptic receptors 作用的緣故。通常以逐漸減少約 Levodopa/carbidopa 劑量 10~30%，便能減緩這些作用。在開處方前，應考慮 Enzymes 的 MAO 系統是否完全，並明白目前只有有限的已被證實之 Selegiline 醫療經驗。因此，所有可能的反應還未完全被發掘。在上市前評估，對於服用 Selegiline 的病患，應密切觀察，是否有非典型的反應。

B、提供病患資訊：

1. 應通知病患要減少 Levodopa 劑量，在以 Selegiline 治療之初期。
2. 每日用量不可超過 10mg(2 錠)。
3. 向病患解釋服用過量的危險性。
4. 簡單的介紹 cheese reaction。
5. 引發高血壓反應之文獻資料未被報告並且極有限。
6. 對病患 (及其家屬) 講解 MAOI 導致高血壓反應的種種徵狀。
7. 鼓勵病患如有頭疼或其他不尋常反應時，應立即向醫師說明。

C、實驗室試驗：

對服用 Selegiline 的病患而言，認為勿須作特別的試驗，但定期對所有病患做評估，則是恰當的。

D、交互作用：

Selegiline 與其他已問世的藥併用，並無交互作用。然而，基於 Selegiline 醫療反應只有部份被證實，在缺乏有害評估時，無法做絕對之保證。

E、Carcinogenesis, Mutagenesis, and Impairment of Fertility 至今仍未 Selegiline HCL 致癌的報導。

F、懷孕：

Selegiline 對動物實驗結果顯示無產生畸胎的危險。一項老鼠試驗完成以人類劑量 180 倍的 Selegiline 卻無畸胎的影響。我們不知 Selegiline 是否對懷孕婦女有致命的傷害，或影響再生育的能力。Selegiline 應在孕婦有明顯需要時才給藥。

G、授乳婦：

Selegiline 是否會分泌在母乳中仍未知，由於許多藥品都會分泌在母乳內，應考慮對授乳婦停止所有給藥，絕對必須的藥品除外。

H、小孩：

對孩童使用 Selegiline HCL，仍未評估。

【副作用】：

類似 Levodopa 過量所引起之副作用，精神激昂、失眠、幻覺、妄想、血液循環過剩、胃腸不適。Levodopa 和 decarboxylase 抑制劑同時服用能減少副作用。

【過量】：

A、Selegiline

服用過量並無特例可尋，然而在 Selegiline 實驗階段得知，某些特例服用 Selegiline 達 600mg d, 1 患有低血壓及精神運動性興奮。既然治療巴金森病患，在適當範圍內 Selegiline 對 MAOB 的選擇性抑制決定於服用劑量，服用過量可能造成 MAO A 和 MAO B 同時抑制。其徵候可能與那些服用市面上 non-selective MAOI [如：tranylcypromin, (PAR-NATE), isocarboxazide(MARPLAN), 及 phenelzine(NARDIL)] 相似。

B、Non-Selective MAOI 過量

Non-Selective MAOI 服用過量的症狀，不會馬上顯現，而是在 12 小時後，下次服藥前，才有可能表現出來。重要的是，徵兆最強烈時是服藥過量後一天以上時出現，已有服藥過量致死的記錄，所以立即住院治療，並應持續觀察兩天。服用過量的徵狀可能是下列各項中之一種或兩種：困倦、頭昏眼花、易怒、活動過度興奮、嚴重頭疼、幻想、牙關緊閉、後弓反張、全身痙攣及昏迷、脈膊快而不規則、低血壓、高血壓、血管低陷、心口疼痛、呼吸困難、高熱、發汗、發冷及皮膚反白。

【注意】：

因尚無服用 Selegiline 過量的病例，推測服用過量的結果可能導致 Non-selective MAOI 中毒。中毒初期，誘發嘔吐，並用活性碳漿滴灌洗胃是很有幫助的，但須注意呼吸道以 "吸引術 (aspiration)" 預防阻塞。若有中樞神經刺激性症狀，如痙攣，則緩慢靜脈注射 Diazepam 避免用 phenothiazine 衍生物及中樞神經興奮劑！血壓過低、血管虛脫，則靜脈注射 fluids。除非必要時才以靜脈注射稀釋過的昇壓劑。因 Adrenergic Agent 會造成明顯的升壓。呼吸方面可提供氧氣、或施以人工呼吸來控制。體溫要隨時監控，以防體溫過高、電解質平衡及體液補充是必須的。

【劑量和給藥】：

每日 10mg，於早餐及午餐各服用 5mg。提高劑量並不會有更好的療效，應避免因提高劑量而增加副作用的危險。本藥須由醫師處方使用。

【包裝】：

4-1000 錠瓶裝、鋁箔片盒裝，請在 25°C 以下保存。



PIC/S GMP 藥廠

美時化學製藥股份有限公司

地址：南投縣南投市新興里成功一路 30 號

TEL:(02)2700-5908

040610