

處方訊息要點

這些要點不包括安全且有效使用 Albendazole 錠劑所需的所有信息，查看 Albendazole 錠劑的完整處方訊息。

Albendazole 錠劑，口服

美國首次批准：1996

適應症和用法

Albendazole 錠劑是一種驅蟲藥，適用於：

- 豬絛蟲、有鈎絲蟲幼蟲引起的 Parenchymal Neurocysticercosis 病變的治療。(1,1)
- 治療由鈎絲蟲、單包絲蟲幼蟲引起的肝、肺和腹膜囊性包蟲病。(1,2)

劑量和給藥

體重 60 公斤或以上的患者，每天 2 次 400 毫克；小於 60 公斤，15 毫克/公斤/天，分次服用，每天兩次(每日最大總劑量 800 毫克)，Albendazole 錠劑應與食物一起服用。(2)

Hydatid Disease: 28 天為一療程，共三個療程，每個療程間隔 14 日。(2)

Neurocysticercosis: 8-30 天。(2)

請參閱完整處方訊息中的其他重要訊息。(2)

劑型和劑量

錠劑，200 mg/tablet。(3)

禁忌

Albendazole 藥用於已知對 Benzimidazole 類的化合物或對本藥任何成份過敏的患者。(4)

警告和注意事項

骨髓抑制：曾經報導因骨髓抑制而導致死亡；所有患者在每 28 天的治療週期開始、治療期間須每 2 週監測血液細胞計數。如果臨床發現血液細胞計數發生顯著變化，請停用 Albendazole 錠劑。(5.1, 5.4)

胚胎-胎兒毒性：可能對胎兒造成傷害。建議對具有生殖潛力的女性在治療前進行妊娠試驗。對具有生殖潛力的女性說明對胎兒的潛在風險，並建議使用有效的避孕措施。(2,3, 5.2, 8.1, 8.3)

神經系統症狀的風險：Neurocysticercosis 患者開始治療後可能會出現腦高血壓、局部神經功能受損、進行適當的類固醇和抗癲癇治療。(5.3)

視網膜囊性病的視網膜損傷風險：已報導有視網膜受累病例；Neurocysticercosis 患者在開始治療前檢查是否有視網膜病變。(5.4)

肝臟效應：肝酶可能升高。每個治療週期開始前監測肝酶，並且在 Albendazole 錠劑治療期間至少每 2 週一次，如果臨床發生顯著升高則停止治療。(5.5)

不良反應

1% 或更高的 Hydatid Disease 不良反應：肝功能檢查異常、腹痛、噁心/嘔吐、可逆性脫髮、頭痛、頭暈/眩暈、發熱。(6.1)

1% 或更高的 Neurocysticercosis 不良反應：頭痛、噁心/嘔吐、顱內壓升高、癲癇病發。(6.1)

要報告疑似不良反應，請致電 1-877-381-3336 聯繫 Edenbridge Pharmaceuticals, LLC 或聯繫 FDA

1-800-332-1088 或 www.fda.gov/medwatch。

藥物交互作用

Dexamethasone: Dexamethasone 與 Albendazole sulfoxide 聯合給藥時，Albendazole sulfoxide 總濃度高出約 56%。(7.1)

Praziquantel: 約 50% 健康受試者在進食狀態下，Albendazole sulfoxide 最大平均血漿濃度和曲線下面積增加。(7.2)

Cimetidine: 包蟲囊腫患者的膽汁和囊液中 Albendazole sulfoxide 濃度增加約 2 倍。(7.3)

Theophylline: albendazole 在人肝細胞中誘導細胞色素 P450 1A；因此，建議在治療期間和治療後監測 Theophylline 的血漿濃度。(5.5, 7.4)

有關患者諮詢訊息，請參見 17。

修訂日期：2020 年 7 月

完整的處方信息

適應症和用法

1.1 Neurocysticercosis

Albendazole 錠劑治療豬絛蟲、有鈎絲蟲幼蟲引起的 Parenchymal Neurocysticercosis 病變。

1.2 Hydatid Disease

Albendazole 錠劑治療由鈎絲蟲(Echinococcus granulosus)、單包絲蟲幼蟲引起的肝、肺和腹膜囊性包蟲病

2 劑量和給藥

2.1 劑量

Albendazole 錠劑的劑量將根據適應症而有所不同。Albendazole 錠劑可以壓碎或咀嚼，然後喝水吞服。Albendazole 錠劑應與食物一起服用[見臨床藥理學(12.3)]

表 1: Albendazole 錠劑劑量

適應症	體重	劑量	療程
Hydatid Disease	≥ 60 公斤	400mg 一天兩次，隨餐服用。	28 天為一療程，共三個療程，每個療程間隔 14 日。
	< 60 公斤	15 mg/kg/day 分為一天兩次，隨餐服用。(每日最大劑量:800mg)	
Neurocysticercosis	≥ 60 公斤	400mg 一天兩次，隨餐服用。	8-30 天
	< 60 公斤	15 mg/kg/day 分為一天兩次，隨餐服用。(每日最大劑量:800mg)	

2.2 避免不良反應的併發用藥

接受 Neurocysticercosis 治療的患者應根據需要接受適當的類固醇和抗癲癇治療，在治療的第一週內應考慮口服或靜脈注射皮質類固醇以預防腦高血壓發作[見警告和注意事項(5.3)]。

2.3 治療前和治療期間的安全監測

所有患者在 Albendazole 錠劑每 28 天的治療週期開始、治療期間須每 2 週監測血液細胞計數[見警告和注意事項(5.1)]。

所有患者在 Albendazole 錠劑每 28 天治療週期開始前監測肝酶(轉氨酶)，並且在治療期間至少每 2 週一次[見警告和注意事項(5.5)]。

女性在治療前進行妊娠試驗[見警告和注意事項(5.2)]。

3 劑型和劑量

錠劑：200 mg。

4 禁忌症

Albendazole 藥用於已知對 Benzimidazole 類的化合物或對本藥任何成份過敏的患者。

5 警告和注意事項

5.1 骨髓抑制

報告有使用 Albendazole 錠劑相關 Granulocytopenia 或 pancytopenia 的死亡。Albendazole 錠劑可能導致骨髓抑制、aplastic anemia 和 agranulocytosis。所有患者在 Albendazole 錠劑每 28 天的治療週期開始、治療期間須每 2 週監測血液細胞計數。肝酶患者和 hepatic echinococcosis 患者的骨髓抑制風險增加，需要更頻繁地監測血液細胞計數。如果臨床血細胞計數顯著減少請停止使用 Albendazole 錠劑。

5.2 胚胎-胎兒毒性

根據動物生殖研究的結果，Albendazole 錠劑給孕動物可能會對胎兒造成傷害。在大鼠和兔子的器官形成階段給予劑量，報告有胚胎毒性和骨骼畸形(人類建議總體表面積標口服劑量 0.1 至 0.6 倍)。孕婦說明對胎兒的潛在風險，建議對具有生殖潛力的女性在治療前進行妊娠試驗(見劑量/給藥(2.3))，建議有生殖潛力的女性在治療期間和最後一次給藥後 3 天使用有效的避孕措施(見特定族群使用(8.1, 8.3)和臨床藥理學(12.3))。

5.3 Neurocysticercosis 神經系統症狀的風險

接受 Neurocysticercosis 治療的患者應接受類固醇和抗癲癇治療，以防止腦內寄生蟲死亡所引起的發熱導致神經系統症狀(例如癲癇發作、顱內壓升高和局部病徵)。

5.4 視網膜囊性病的視網膜損傷風險

Cysticercosis 可能影響視網膜。在開始治療 Neurocysticercosis 之前，檢查患者視網膜是否受累。如果出現此類病變，請諮詢 Anticysticercal 治療的專家，與 Albendazole 誘導的寄生蟲死亡引起發熱損傷，導致視網膜損傷的可能性。

5.5 肝臟效應

在臨床試驗中，約 16% 的患者使用 Albendazole 錠劑，與輕度至中度肝酶升高有關。這些升高通常在停止治療後恢復正常，也有不確定因果關係和肝酶的急性肝臟衰竭的病例報告[見不良反應(6)]。

在每個療程開始前監測肝酶(轉氨酶)，並且在治療期間至少每 2 週一次，如果肝酶超過正常上限的兩倍，應根據個體患者情況，考慮停止 Albendazole 錠劑治療。停止治療的患者肝酶恢復正常後，重新開始 Albendazole 錠劑治療是個人決定。應考慮進一步使用 Albendazole 錠劑的風險/益處。如果重新開始 Albendazole 錠劑治療，應經常進行實驗室檢查。肝酶檢測升高的患者，發生肝毒性和骨髓抑制的風險增加[見警告和注意事項(5.1)]。如果肝酶顯著升高或血液細胞計數臨床出現顯著降低，則停止治療。

5.6 播種 Hydatid 患者得 Neurocysticercosis

使用 Albendazole 錠劑治療其他疾病的患者可能會發現未確診的 Neurocysticercosis，有流行病學因素且有 Neurocysticercosis 風險的患者應在開始治療前進行評估。

6 不良反應

6.1 臨床試驗經驗

由於臨床試驗是在廣泛不同的條件下進行的，因此在一種藥物的臨床試驗中觀察到的不良反應率不能直接與另一種藥物的臨床試驗中的發生率進行比較，並且可能無法反應真實觀察到的發生率。

Albendazole 錠劑的不良反應在 Hydatid disease 和 Neurocysticercosis 之間有所不同。表 2 描述在任一疾病中發生率為 1% 或更高的不良反應。這些症狀通常很輕微，無需治療即可恢復。停止治療的主要原因是 leukopenia (0.7%) 或 hepatic abnormalities [Hydatid disease 的 3.8%)，以下發生率反應了與 Albendazole 錠劑至少可能或可能發生的不良反應。

表 2: Hydatid Disease 和 Neurocysticercosis 的 1% 或更高不良反應發生率	Hydatid Disease	Neurocysticercosis
不良反應		
胃腸道		
腹痛	6	0
噁心	4	6
嘔吐	4	6
一般疾病和實驗室值情況		
發燒	1	0
調查		
肝酶升高	16	<1
神經系統疾病		
癲癇	1	<1
頭痛	1	11
局部神經病	0	1
顱內壓升高	0	2
眩暈	1	<1
皮膚和皮下組織疾病		
可逆性脫髮	2	<1

以下不良事件的發生率低於 1%：

血液和淋巴系統疾病：有白細胞減少、粒細胞減少、全血細胞減少、粒細胞缺乏症或血小板減少症的通報[見警告和注意事項(5.1)]。

免疫系統疾病：過敏反應，包括皮疹和蕁麻疹。

6.2 上市後經驗

在批准使用 Albendazole 錠劑期間，已發現以下不良反應，由於這些反應是由數量不確定的人群自願回報，因此並不總是能夠可靠地估計其頻率或建立與藥物暴露的因果關係。

血液和淋巴系統疾病：再生障礙性貧血、骨髓抑制、中性粒細胞減少症。

眼睛疾病：視力模糊。

腸道疾病：腹瀉。

一般系統疾病：虛弱。
肝臟疾病：肝酶升高、肝炎、急性肝功能衰竭。
骨骼肌肉和結締組織疾病：橫紋肌溶解症。
神經系統疾病：嗜睡、抽搐。
腎臟和泌尿系統疾病：急性腎功能衰竭。
皮膚和皮下組織疾病：多形性紅斑、Stevens-Johnson 二氏症候群

7 藥物相互作用

7.1 Dexamethasone

8 名 Neurocysticercosis 患者的 Albendazole sulfoxide 穩態濃度約高出 56%，當 8 mg Dexamethasone 與每日 Albendazole (15 mg/kg/天) 聯合給藥時。

7.2 Praziquantel

在進食狀態下，Praziquantel (40 mg/kg) 使健康受試者 (n = 10) 的平均最大血漿濃度和 Albendazole sulfoxide 曲線下面積與單獨給予 Albendazole 的受試者 (n = 6) 相比增加了約 50%，Albendazole sulfoxide 的平均 T_{max} 和平均血漿消除半衰期沒有變化。Praziquantel 的藥物動力學與 Albendazole (400 mg) 共同給藥後沒有變化。

7.3 Cimetidine

與單獨使用 Albendazole (20 mg/kg/day) (n = 12) 相比，Hydatid Cyst 患者 Albendazole sulfoxide 在應以 cimetidine (10 mg/kg/day) (n = 7) 後，膽汁及尿液濃度上升(大約兩倍)，Albendazole sulfoxide 血漿濃度在給藥後 4 小時沒有變化。

7.4 Theophylline

單劑量 Albendazole (400 mg) 後，theophylline (aminophylline 20 分鐘內輸注 5.8 mg/kg) 的藥物動力學沒有變化。Albendazole 會誘導人體肝細胞中 cytochrome P450 1A；因此，建議在治療期間和治療後監測 theophylline 的血漿濃度。

8 特定族群使用情況

8.1 孕婦

風險摘要

根據動物生殖研究的結果，給孕婦服用 Albendazole 錠劑可能會對胎兒造成傷害，然而由少數已發表病例及報告顯示，在第一次妊娠內使用多劑量 Albendazole，在妊娠後期使用單劑量 Albendazole 的多項已發表研究，尚未發現任何藥物相關的巨大出生缺陷、流產或母體或胎兒不良的風險。在動物生殖研究中，在器官形成期口服 Albendazole 會導致懷孕大鼠(劑量為人體最大體表面積建議劑量的 0.10-0.32 倍，單位是 mg/m²) 和懷孕兔子(劑量為人體最大體表面積建議劑量的 0.60 倍，單位是 mg/m²) 的胚胎毒性和骨骼畸形，Albendazole 還與兔子的母體毒性有關(劑量為人體體表面積建議劑量的 0.60 倍，單位是 mg/m²) (見數據)。告知孕婦對胎兒的潛在風險。指定族群的重大先天缺陷和流產的預估背景風險尚不清楚，所有懷孕都有先天缺陷、流產或其他不良後果的背景風險。在美國普通人群中，臨床上認定懷孕重大先天缺陷、流產的預估背景風險分別為 2%-4% 和 15%-20%。

數據

動物數據

Albendazole 已被證明對懷孕的大鼠和兔子是致畸的(導致胚胎毒性和骨骼畸形)。此致畸性在大鼠器官形成期(懷孕第 6 至 15 天)口服劑量為 10-30 mg/kg/day (劑量分別為人體最大體表面積建議劑量的 0.10 和 0.32 倍，單位是 mg/m²)；在懷孕兔子的器官形成期(懷孕第 7 至 19 天)口服給藥 30 mg/kg/day (為人體最大體表面積建議劑量的 0.60 倍，單位是 mg/m²) 是被觀察到的。在兔子研究中，劑量 30 mg/kg/day 注意到有母體毒性(33% 死亡率)；在小鼠中，在懷孕第 6 至 15 天口服劑量高達 30 mg/kg/day (為人體表面積建議劑量的 0.16 倍，單位是 mg/m²) 未觀察到致畸作用。

8.2 哺乳期

風險摘要

Albendazole 和活性代謝物 Albendazole sulfoxide 被報告在人類母乳中的濃度較低，沒有關於母乳哺育嬰兒不良反應的報告，也沒有母乳被影響的資訊。母乳哺育的發育和康復益處，應與母親對 Albendazole 錠的臨床需求，及 Albendazole 母乳哺育嬰兒的任何潛在不良影響，或母體任何潛在不良反應一同考慮。

8.3 具有生殖潛力的女性和男性

妊娠試驗

建議有生育能力的女性在使用 Albendazole 錠之前進行妊娠試驗。

避孕

女性

給予懷孕婦女 Albendazole 錠可能導致胎兒傷害(見特定族群使用(8.1))。建議有生育能力的女性在 Albendazole 錠治療期間、最後一次給藥後 3 天使用有效的避孕措施。

8.4 兒童使用

Hydatid disease 在嬰幼兒中並不常見。在 Neurocysticercosis 中，Albendazole 錠對兒童的療效似乎與成人相似。

8.5 老年人使用

65 歲以上患有 Hydatid disease 或 Neurocysticercosis 的患者中，無足夠數據來確定 Albendazole 錠的安全性和有效性是否與年輕患者不同。

8.6 腎功能損傷患者

尚未研究 Albendazole 錠在腎功能損傷患者的藥物動力學。

8.7 肝外阻塞患者

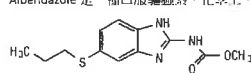
肝外阻塞患者(n=5)，Albendazole sulfoxide 的全身利用率增加，以及最大血漿濃度增加 2 倍，及曲線下面積增加 7 倍。Albendazole sulfoxide 的吸收/轉化和消除速率似乎延長，分別以平均 T_{max} 和血漿消除半衰期值為 10 小時和 31.7 小時，5 名患者中只有 1 名患者血漿可測量到原本 Albendazole 濃度。

10 過量用藥

在過量用藥的情況下，建議對症治療和一般支持措施。

11 說明

Albendazole 是一種口服驅蟲藥。化學上，是 methyl 5-(propylthio)-2-benzimidazolecarbamate，分子式是 C₁₂H₁₅N₂O₂S，分子量是 265.34，化學結構式：



Albendazole 為白色至淡灰色粉末，易溶於無水甲酸，微溶於乙醚和二氯甲烷，Albendazole 幾乎不溶於酒精和水。

Albendazole 錠 USP 是白色至灰白色、圓形、凸面、膜衣錠，印有“110”字樣，一側為拱形，另一側為平面，含有 200 mg Albendazole。

Albendazole 錠 USP 的非活性成分包括：羧丙甲纖維素、乳糖水合物、硬脂酸鈣、微晶纖維素、聚乙烯吡咯酮、硫酸月桂基鈉、甘氨酸澱粉糊精和玉米澱粉。

12 臨床藥理學

12.1 作用機制

Albendazole 錠是苯并咪唑類的合成驅蟲藥(見臨床藥理學(12.4))。

12.3 藥物動力學

吸收

由於其低水溶性，Albendazole 錠難以從胃腸道吸收，血漿中的 Albendazole 濃度可忽略或檢測不到，因為它在體積積項前便迅速轉化為 sulfoxide 代謝物，全身暴露活性隨因於主要代謝物 Albendazole sulfoxide。與禁食狀態相比，當 Albendazole 與高脂飲食(脂肪含量為 40 g) 共同服用時，口服生物有效性似乎提高，而 Albendazole sulfoxide 血漿濃度增加(平均高達 5 倍) 證明了這一點。

6 名 hydatid disease 病患與高脂飲食一起服用 Albendazole (400 mg) 時，Albendazole sulfoxide 的最大血漿濃度在給藥後 2-5 小時平均達到 1310 ng/mL (範圍 460 ng/mL 至 1580 ng/mL)。攝入高脂肪飲食(脂肪含量 43.1 g) 後，Albendazole sulfoxide 血漿濃度在治療劑量範圍內以劑量比例增加，25 名健康受試者以及 14 名 hydatid 和 8 名 neurocysticercosis 病患，Albendazole sulfoxide 的平均表觀終端消除半衰期為 8-12 小時。

Albendazole (200 mg，每日 3 次) 治療 4 週後，12 名患者的 Albendazole sulfoxide 血漿濃度比治療前同期觀察到的低約 20%，顯示 Albendazole 可能誘導其自身代謝。

分布

70% Albendazole sulfoxide 與血漿蛋白結合，廣泛分佈於全身；能在尿液、膽汁、肝臟、囊液、囊液和腦脊液(CSF) 中檢測到，血漿中的濃度分別比在囊液和 CSF 同時測定到的濃度高 3-10 倍和 2-4 倍。

代謝和排泄

Albendazole 在肝臟中迅速轉化為主要代謝物 Albendazole sulfoxide，進一步代謝為 albendazole sulfone 和人類尿液檢測到的其他主要氯化物，口服給藥後，在人類尿液中未檢測到 Albendazole，尿液是 Albendazole sulfoxide 的次要排泄途徑，小於 1% 的回收劑量。膽汁中 Albendazole sulfoxide 濃度與血漿中達到相似的濃度，證明了膽汁可能佔排除的一定比例。

特殊族群

兒童

3 名空腹和 2 名進食過的包蟲囊病病兒科患者(年齡範圍 6-13 歲)單劑量服用 200 mg-300 mg(約 10 mg/kg) Albendazole 錠，Albendazole sulfoxide 的藥物動力學與成年人進食後觀察到的相似。

老年人

儘管沒有針對此年齡 Albendazole sulfoxide 藥物動力學的影響調查，但 26 名 Hydatid cyst 患者(最高 79 歲)的數據顯示其藥物動力學與年輕健康受試者相似。

12.4 微生物學

作用機制

Albendazole 與 β-tubulin 的秋水仙素敏感位點結合，抑制其聚合成微管，寄生蟲腸細胞微管的減少降低了它們的吸收功能，特別是成蟲和幼蟲對葡萄糖的吸收，也會消耗肝糖原，葡萄糖不足會導致產生三磷酸腺苷(ATP) 的能量不足，寄生蟲最終會死亡。

抗藥機制

寄生蟲對 Albendazole 的抗藥性是由改變胺基酸引起 β-tubulin 變化，導致藥物與 β-tubulin 的結合減少。

在特定的適應症治療，Albendazole 似乎對以下生物的幼蟲形式有活性：

Echinococcus granulosus 犬絛蟲 *Taenia solium* 豬的絛蟲

13 非臨床毒理學

13.1 致毒性、突變、及生育能力受損

在小鼠和大鼠上進行了長期致癌性研究

在小鼠和大鼠中分別以高達 400 mg/kg/day 或 20 mg/kg/day 為人體表面積建議劑量的 2 倍和 0.2 倍) 未發現腫瘤發生率增加的證據。

在遺傳毒性試驗中，Albendazole 在艾姆斯沙門氏菌/微粒體培養突變試驗、中國倉鼠卵巢染色體畸變試驗和小鼠體內核仁試驗均呈陰性。在 BALB/3T3 體外細胞轉化試驗中，Albendazole 在代謝活化的情況下產生弱活性，而在沒有代謝活化的情況下沒有發現活性。

Albendazole 口服劑量為 30 mg/kg/day 為人體體表面積建議劑量的 0.32 倍，單位是 mg/m² 時，對雄性或雌性大鼠的生育能力沒有不良影響。

16 如何供應/儲存和處理

16.1 如何供應

Albendazole 錠 USP 是白色至灰白色、圓形、凸面、膜衣錠，印有“110”字樣，一側為拱形，另一側為平面，含有 200 mg Albendazole。

2 錠/瓶 NDC 42799 110 02

16.2 儲存和處理

儲存於 20°C~25°C (68° 至 77°F) [參見 USP 控制的室溫]

17 病患諮詢訊息

患者應被告知：

有些人，尤其是兒童，可能難以吞嚥整個 Albendazole 錠。

隨餐服用 Albendazole 錠。

告知孕婦和有生育潛力的女性對胎兒的潛在風險，建議女性若疑以懷孕告知醫生(見警告和注意事項(5.2))，特定族群使用(8.1))。

建議有生育能力的女性在治療期間和最後一次給藥後 3 天使用有效的避孕措施(見特定族群使用(8.3))。

在 Albendazole 錠治療期間，每 2 週監測血液細胞計數和肝酶，因為可能對肝臟或骨髓造成傷害(見警告和注意事項(5.5))。

廠商：

Edenbridge Pharmaceuticals, LLC

Parsippany, NJ 07054

877-381-3336