

卡力舒錠 250 毫克

Carisoma Tablets 250mg

衛署藥製字第 G-11267 號
055961 號

成分：

每錠中含有 Carisoprodol 250mg。

賦形劑：

Microcrystalline Cellulose 102、Povidone K-90、Sodium Starch Glycolate、Aerosil 200、Magnesium Stearate、Purified Water

1. 適應症

焦慮緊張症，經常緊張，肌炎，椎間神經痛，坐骨神經痛，頸痛，風濕性關節炎，骨關節炎，肌肉僵硬，肌肉痛。

2. 用法用量

成人一次一粒，一日服用四次。由於長期療效的充分證據尚未獲得確立，此外，急性骨骼肌肉疼痛的症狀通常只會持續短時間，因此本品僅可短期使用。

3. 劑型與含量

250mg 錠劑：橢圓形雙凸白色錠劑。

4. 禁忌症

本品禁用於有急性間歇性紫質症病史、先前對 Carisoprodol 及其他相關藥物如 Meprobamate 產生過敏者。

5. 警語及注意事項

5.1 鎮靜

本品具有鎮靜作用，可能損及進行有風險之行為能力，例如駕駛交通工具或操作機械。曾有與使用 Carisoprodol 相關交通意外事故之上市後報告。因此治療期間應避免操作機械或開車。本品的鎮靜作用可能會與其他中樞神經系統抑制劑（如，酒精、benzodiazepine 類藥物、鴉片類藥物、三環抗憂鬱劑）產生加成作用，不建議併用。

5.2 濫用、依賴性與戒斷反應

本品之有效成分為 carisoprodol，可能引起濫用、依賴性、戒斷反應。濫用本品可能導致用藥過量，進而引發死亡、中樞神經系統與呼吸抑制、低血壓、癲癇發作 [參閱用藥過量 (10)]。

上市後經驗中，曾有患者長時間使用，或有藥物濫用病史患者發生 carisoprodol 濫用與依賴的案例。曾有長時間使用 carisoprodol 後，突然停藥引起戒斷反應的報告，戒斷症狀包括失眠、嘔吐、腹部絞痛、頭痛、顫抖、肌肉抽搐、運動失調、幻覺與精神疾病。Meprobamate 為 carisoprodol 的其中一種代謝物，也可能會引起依賴性 [參閱臨床藥理學 (12.3)]。

5.3 癲癇發作

上市後曾有使用 carisoprodol 患者發生癲癇發作的報告，多數案例發生在多重藥物用藥過量的患者（包括藥物濫用、非法藥物與酒精）[參閱用藥過量 (10)]。

6. 不良反應

6.1 臨床研究經驗（依文獻記載）

下列數據來自兩項雙盲、隨機分配、多中心、安慰劑對照臨床試驗的資料彙整結果，兩項研究皆針對急性、姿勢性 (mechanical) 下背痛患者進行，為期一週，共納入 1387 名患者。上述研究中，患者接受 carisoprodol 250mg、carisoprodol 350mg 或安慰劑治療，每天三次與睡前服用，連續 7 天。

兩項試驗皆無患者死亡，亦未發生嚴重不良反應。因不

良事件而停用試驗藥物的患者比例，安慰劑組為 2.7%、carisoprodol 250mg 為 2%、carisoprodol 350mg 為 5.4%。因為中樞神經系統不良反應而停用試驗藥物的患者比例，安慰劑組為 0.5%、carisoprodol 250mg 為 0.5%、carisoprodol 350mg 為 1.8%。

表 1 為上述兩項試驗中，carisoprodol 組之通報率超過 2%，且通報率大於安慰劑組的不良反應。

表 1：對照試驗中發生不良反應的患者人數

不良反應	安慰劑 (n=560) n (%)	carisoprodol 250mg (n=548) n (%)	carisoprodol 350mg (n=279) n (%)
嗜睡 (drowsiness)	31 (6)	73 (13)	47 (17)
頭暈	11 (2)	43 (8)	19 (7)
頭痛	11 (2)	26 (5)	9 (3)

6.2 上市後經驗（依文獻記載）

Carisoprodol 核准上市後，曾接獲下列事件之通報，由於這些事件是來自人數未知族群之自願性主動通報，因此不見得能夠準確估計發生率，也不見得能夠確立與藥物暴露之間的因果關係。

心血管：心搏過速、姿勢性低血壓、臉部潮紅 [參閱用藥過量 (10)]。

中樞神經系統：嗜睡、頭暈、暈眩、運動失調、顫抖、躁動、不安、頭痛、抑鬱反應、昏厥、失眠與癲癇發作 [參閱用藥過量 (10)]。

胃腸道：噁心、嘔吐與上腹部不適。

血液學：白血球減少症、全血球減少症

7. 藥物交互作用

7.1 中樞神經系統抑制劑

本品的鎮靜作用可能會與其他中樞神經系統抑制劑（如，酒精、benzodiazepine 類藥物、鴉片類藥物、三環抗憂鬱劑）產生加成作用，不建議併用 [參閱警語及注意事項 (5.1)]。

7.2 CYP2C19 抑制劑與誘導劑

Carisoprodol 會在肝臟中經由 CYP2C19 代謝形成 meprobamate [參閱臨床藥理學 (12.3)]。本品與 CYP2C19 抑制劑併用，例如 omeprazole 或 fluvoxamine，可能會造成 carisoprodol 暴露量增加與 meprobamate 暴露量減少。本品與 CYP2C19 誘導劑併用，例如 rifampin 或金絲桃 (St. John's Wort)，可能會造成 carisoprodol 暴露量減少與 meprobamate 暴露量增加。低劑量的阿斯匹靈具有 CYP2C19 誘導作用。本品暴露量改變，對於有關療效或安全性的完整藥理學影響仍未知。

8. 特殊族群使用

8.1 懷孕：懷孕分級 C 級。

並無人類懷孕期間使用 carisoprodol 的相關資料。動物試驗發現，carisoprodol 會通過胎盤，對於胚胎成長與出生後存活率具有不良影響。懷孕婦女使用本品應衡量臨床效益與風險。

8.2 哺乳婦女

有限的資料指出，carisoprodol 會進入人類乳汁中，濃度可能達到母體血中濃度的 2 至 4 倍。一項小鼠的哺乳試驗中，雌仔鼠的存活率與仔鼠斷奶時的體重均降低。上述研究顯示，母體使用 carisoprodol 可能會造成嬰兒進食狀況不佳（因為鎮靜作用），或是降低乳量。哺乳婦女使用本品應特別小心。

8.3 老年人使用

Carisoprodol 用於超過 65 歲老年患者的療效、安全性與藥物動力學尚未獲得確立。

8.4 腎功能不全

尚未評估 carisoprodol 用於腎功能不全患者的安全性與藥物動力學。由於 carisoprodol 乃經由腎臟排除，腎功能不全患者使用本品應特別小心。Carisoprodol 可經由血液透析與腹膜透析排除。

8.5 肝功能不全

尚未評估 carisoprodol 用於肝功能不全患者的安全性與藥

物動力學。由於 carisoprodol 經由肝臟代謝，肝功能不全患者使用本品應特別小心。

8.6 CYP2C19 活性低下患者

CYP2C19 活性低下的患者，使用 carisoprodol 暴露量會增加，此類患者使用本品應特別小心 [參閱臨床藥理學 (12.3)]。

9. 用藥過量

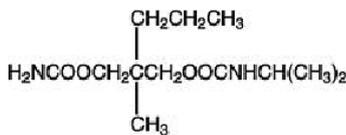
使用 carisoprodol 過量會導致中樞神經系統抑制。曾有使用 carisoprodol 過量導致死亡、昏迷、呼吸抑制、低血壓、癲癇發作、譫妄、幻覺、肌張力不全、眼球震顫、視力模糊、散瞳、肌肉不協調、僵直，以及頭痛的報告。許多 carisoprodol 用藥過量的案例，發生在多重用藥過量 (包括藥物濫用、非法藥物與酒精)。Carisoprodol 與其他中樞神經系統抑制劑 (如，酒精、benzodiazepine 類藥物、鴉片類藥物、三環抗憂鬱劑) 用藥過量的反應，有加成作用。

用藥過量之治療：應視 carisoprodol 用藥過量之表徵，給予適當之生命支持措施。由於有中樞神經抑制與呼吸抑制的風險，不可給予催吐，以免造成吸入。有需要時，應給予液體輸注及升壓藥，以支持血液循環。癲癇發作應以靜脈注射 benzodiazepine 類藥物治療，再發性癲癇發作可給予 phenobarbital。如發生嚴重中樞神經系統抑制，呼吸道的保護性反射功能可能受損，應考慮進行氣管內插管，以保護呼吸道並支持呼吸系統。

嚴重中毒時如需除去體內藥物，在患者尚未出現中樞神經系統抑制，且可保護其呼吸道的情况下，可考慮使用活性炭。

10. 說明

本品 (carisoprodol) 錠劑有 250mg 與 350mg 兩種劑量，為白色橢圓形錠劑。Carisoprodol 為白色的結晶末，具有輕微的特殊氣味，以口嚼有苦味。微溶於水，易溶於酒精、氯仿與丙酮，溶解度基本上不受 pH 值影響。Carisoprodol 為消旋混合物，化學名稱為 N-isopropyl-2-methyl-2-propyl-1,3-propanediol dicarbamate，分子式為 $C_{12}H_{24}N_2O_4$ ，分子量 260.33，結構式為：



11. 臨床藥理學

11.1 作用機轉

Carisoprodol 緩解急性骨骼肌肉疼痛的機轉，尚未完全明瞭。

動物試驗中，carisoprodol 的肌肉鬆弛作用與影響脊髓以及腦部下行網狀結構內的神經間活性有關。

11.2 藥物效力學

Carisoprodol 具中樞作用之骨骼肌鬆弛劑。

11.3 藥物動力學 (依文獻記載)

一項交叉試驗，以 24 名健康受試者 (男女各 12 人) 評估 carisoprodol 及其代謝物 meprobamate 的藥物動力學，使用單劑量 carisoprodol 250mg 與 350mg (參閱表 2)。在劑量 250 mg 與 350mg 之間，carisoprodol 與 meprobamate 之暴露量與劑量成比例。使用單劑量 350mg carisoprodol 後，meprobamate 之 C_{max} 為 2.5±0.5 μg/mL (平均值 ±SD)，約為使用單劑量 400mg meprobamate 之 C_{max} (約為 8 μg/mL) 的 30%。

表 2：Carisoprodol 與 Meprobamate 之藥物動力學參數
(Mean ±SD, n=24)

	carisoprodol 250mg	carisoprodol 350mg
Carisoprodol		
C _{max} (μg/mL)	1.2±0.5	1.8±1.0
AUC _{inf} (μg*hr/mL)	4.5±3.1	7.0±5.0
T _{max} (hr)	1.5±0.8	1.7±0.8
T _{1/2} (hr)	1.7±0.5	2.0±0.5

Meprobamate

C _{max} (μg/mL)	1.8±0.3	2.5±0.5
AUC _{inf} (μg*hr/mL)	32±6.2	46±9.0
T _{max} (hr)	3.6±1.7	4.5±1.9
T _{1/2} (hr)	9.7±1.7	9.6±1.5

吸收：Carisoprodol 之絕對生體可用率仍未知。達到 carisoprodol 最高血中濃度之平均時間 (T_{max}) 約為 1.5 至 2 小時。併服 carisoprodol 350mg 與高脂餐點，並不會影響 carisoprodol 的藥物動力學，因此 carisoprodol 隨餐或空腹服用均可。

代謝：Carisoprodol 的主要代謝路徑為經由肝臟細胞色素酶素 CYP2C19，代謝後形成 meprobamate。此酶素具有遺傳多型性 (genetic polymorphism) (請參閱下文 CYP2C19 活性低下患者)。

排除：Carisoprodol 同時經由腎臟與非腎臟途徑排除，最終排除半衰期約為 2 小時。Meprobamate 之排除半衰期約為 10 小時。

性別：女性受試者之 carisoprodol 暴露量高於 (依體重調整後，約為 30-50%) 男性受試者。Meprobamate 之整體暴露量則兩者相近。

CYP2C19 活性低下患者：CYP2C19 活性低下患者應小心使用本品。已發表之研究指出，相較於 CYP2C19 正常代謝型者，CYP2C19 緩慢代謝型者的 carisoprodol 暴露量會增加 4 倍，同時 meprobamate 暴露量會減少 50%。高加索人種與非裔美國人中，緩慢代謝型的盛行率約為 3-5%，亞洲人種則約為 15-20%。

12. 包裝 / 儲存與處理方式

250mg 錠劑：橢圓形雙凸白色錠劑，一面有“0 | 2”字樣刻印，另一面則有“G | L”字樣，8~1,000 粒塑膠瓶裝，8~1,000 粒鋁箔盒裝。

儲存方式：

25°C 以下儲存。

13. 患者諮詢資訊

應告知患者，如發生任何本品不良反應，應與醫師聯絡。

13.1 鎮靜

應告知患者，本品可能引起嗜睡或頭暈，曾有使用者發生交通事故。應告知患者，進行有風險的行為，如駕駛交通工具或操作機械前，應避免服用本品 [參閱警語及注意事項 (5.1)]。

13.2 避免使用酒精與其他中樞神經抑制劑

應告知患者，服用本品期間應避免飲用含酒精的飲料，使用其他中樞神經系統抑制劑，如 benzodiazepine 類藥物、鴉片類藥物、三環抗憂鬱劑、具鎮靜作用之抗組織胺、其他鎮靜劑前，應先諮詢醫師 [參閱警語及注意事項 (5.1)]。

13.3 本品僅可用於短期治療

應告知患者，本品僅可短期使用，用於緩解急性骨骼肌肉不適。Carisoprodol 的上市後使用經驗，曾有長期使用後發生依賴性、戒斷反應或濫用的報告。肌肉骨骼症狀仍持續未消退時，患者應聯絡專業醫護人員，接受進一步的評估。

製造廠：

健亞生物科技股份有限公司
新竹縣湖口鄉新竹工業區工業一路一號