



泛抑癌膜衣錠200毫克

Truqap 200 mg film-coated tablets

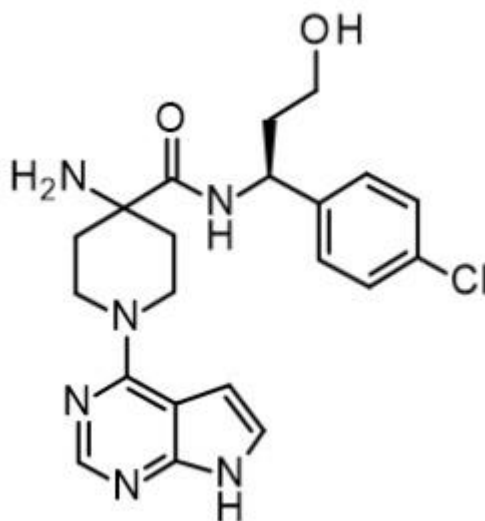
衛部藥輸字 第 028820 號

須由醫師處方使用

版本日期 2025-12-01

1 性狀

TRUQAP (capivasertib) 是一種激酶抑制劑。Capivasertib 的分子式為 $C_{21}H_{25}ClN_6O_2$ ，分子量為 428.92 g/mol。Capivasertib 化學名為 4-amino-*N*-[(1*S*)-1-(4-chlorophenyl)-3-hydroxypropyl]-1-(7*H*-pyrrolo[2,3-*d*]pyrimidin-4-yl)-4-piperidinecarboxamide。Capivasertib 係白色至灰白色粉末，溶解度隨 pH 值而變化。pH 值低於 1.2 時易溶於水，而 pH 值高於 6.8 時幾乎不可溶。Capivasertib 的結構式如下：



1.1 有效成分及含量

TRUQAP 160 毫克：每顆膜衣錠含 160 毫克的 capivasertib。

TRUQAP 200 毫克：每顆膜衣錠含 200 毫克的 capivasertib。

1.2 賦形劑

錠劑核心：

微晶纖維素 (Microcrystalline cellulose)

磷酸氫鈣 (Dibasic calcium phosphate)

交聯羧甲基纖維素鈉 (Croscarmellose sodium)

硬脂酸鎂 (Magnesium stearate)

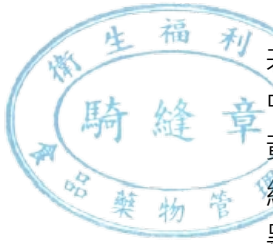
錠劑膜衣：

羥丙甲纖維素 (Hypromellose)

二氧化鈦 (Titanium dioxide)

聚乙二醇3350 (Polyethylene glycol 3350)

聚葡萄糖 (Polydextrose)



共聚維酮 (Copovidone)
中鏈三酸甘油酯 (Medium chain triglycerides)
黃色氧化鐵
紅色氧化鐵
黑色氧化鐵

1.3 劑型

膜衣錠

1.4 藥品外觀

TRUQAP 160 毫克錠劑為圓形、雙凸面、米黃色膜衣錠，一面壓印「CAV」及下方「160」字樣，反面空白。

TRUQAP 200 毫克為膠囊形狀、雙凸面、米黃色膜衣錠，一面壓印「CAV 200」字樣，反面空白。

2 適應症

與 fulvestrant 併用可治療患有荷爾蒙受體 (HR) 陽性、第二型人類表皮生長因子受體 (HER2) 陰性及具PIK3CA/AKT1/PTEN任一變異，且曾經接受內分泌治療，但疾病復發或惡化之局部晚期或轉移性乳癌成人病人。

3 用法及用量

3.1 用法用量

TRUQAP 併用 fulvestrant 的建議劑量為 400 毫克 (2粒 200 毫克錠劑)，每日口服兩次 (間隔約 12 小時)，可隨餐或空腹服用，持續 4 天然後暫停 3 天。請見表 1。

表 1：TRUQAP 每週給藥時程

	第 1 天	第 2 天	第 3 天	第 4 天	第 5 天*	第 6 天*	第 7 天*
早上	2 x 200 毫 克	2 x 200 毫 克	2 x 200 毫 克	2 x 200 毫 克			
晚上	2 x 200 毫 克	2 x 200 毫 克	2 x 200 毫 克	2 x 200 毫 克			

* 第 5 天、第 6 天及第 7 天不給藥

TRUQAP 須與 fulvestrant 併用，fulvestrant 的建議劑量為 500 毫克，分別在第 1 天、第 15 天及第 29 天給藥，之後每月一次。詳細說明請參閱 fulvestrant 之核准仿單。

未停經/停經前期的女性使用 TRUQAP 加 fulvestrant，應同時併用促黃體素釋放激素 (LHRH) 促效劑。詳細說明請參見 fulvestrant 核准處方資訊。

如果錯過一劑 TRUQAP，在平常服藥時間的 4 小時以內可立即服藥；但超過 4 小時後，應略過該次劑量，依平常服藥時間服用下一劑 TRUQAP。服藥時間應間隔至少 8 小時。如果病人嘔吐，請勿再額外服藥。依平常服藥時間服用下一劑 TRUQAP。



TRUQAP 錠劑應配水完整吞服，不可咀嚼、壓碎、溶解或剝半。TRUQAP 如果裂開、破碎或不完整，請勿服用。

治療持續時間

應持續 TRUQAP 治療，直到疾病惡化或發生無法耐受的毒性為止。

劑量調整

不良反應

可中斷 TRUQAP 治療以控制不良反應，並可以考慮減少劑量。若考慮調降劑量，請參見表 2 的劑量調降指引。TRUQAP 劑量最多可調降兩次。特定不良反應的劑量調整指引，請參見表 3 至表 5。

表 2：發生不良反應時的 TRUQAP 劑量調降指引

TRUQAP	劑量及時程	錠劑數量及強度
起始劑量	每日 2 次 400 毫克連續 4 天，然後暫停 3 天	兩粒 200 毫克錠劑
第一次調降劑量	每日 2 次 320 毫克連續 4 天，然後暫停 3 天	兩粒 160 毫克錠劑
第二次調降劑量	每日 2 次 200 毫克連續 4 天，然後暫停 3 天	一粒 200 毫克錠劑

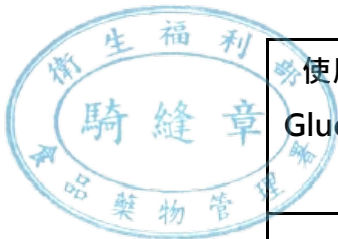
高血糖

在開始 TRUQAP 治療之前，必須檢測病人的空腹血糖 (FG) 和 HbA1C，以決定是否開始使用 TRUQAP 及降血糖藥物。TRUQAP 治療中依高血糖的嚴重程度而定，可暫時中斷 TRUQAP 給藥、調降劑量或永久停用 (參見表 3)。

選擇降血糖用藥時，應考慮諮詢糖尿病專科醫師/內分泌專科醫師；需注意在暫停 TRUQAP 的幾天，使用糖尿病藥物可能發生低血糖。

表 3：高血糖的 TRUQAP 建議劑量調整^a

使用 TRUQAP 前的空腹血糖(Fasting Glucose, FG) 值 ^c 及發生高血糖不良反應嚴重度 ^b	建議 ^d
第 1 級 > 正常值上限 (ULN) - 160 mg/dL 或 > ULN - 8.9 mmol/L 或 HbA1C > 7%	無需調整 TRUQAP 劑量。 考慮開始或加強口服降血糖藥物治療。
第 2 級 > 160-250 mg/dL 或 > 8.9-13.9 mmol/L	暫停 TRUQAP，開始或加強口服降血糖藥物治療。 如果在 28 天內改善至 ≤ 160 mg/dL (或 ≤ 8.9 mmol/L)，應以相同劑量等級恢復使用 TRUQAP，並維持之前的降血糖藥物治療。



使用 TRUQAP 前的空腹血糖(Fasting Glucose, FG) 值 ^c 及發生高血糖不良反應嚴重度 ^b	建議 ^d
	如果在 28 天後改善至 ≤ 160 mg/dL (或 ≤ 8.9 mmol/L) , 應降低一個劑量等級重新開始, 並維持之前的降血糖藥物治療。
第 3 級 > 250 - 500 mg/dL 或 > 13.9 - 27.8 mmol/L	暫停TRUQAP並諮詢糖尿病專科/內分泌專科醫師。 開始或加強口服降血糖藥物治療。視臨床需要, 考慮增加其他降血糖藥物, 例如胰島素。 考慮靜脈輸注補水, 並依當地準則進行適當的臨床處置。 如果 28 天內空腹血糖降至 ≤ 160 mg/dL (或 ≤ 8.9 mmol/L) , 應降低一個劑量等級恢復使用 TRUQAP , 並維持之前的降血糖藥物治療。 如果經適當治療, 28天內空腹血糖未降至 ≤ 160 mg/dL (或 ≤ 8.9 mmol/L) , 則永久停用 TRUQAP。
第 4 級 > 500 mg/dL 或 > 27.8 mmol/L	暫停TRUQAP並諮詢糖尿病專科/內分泌專科醫師 開始或加強適當的降血糖藥物治療。 考慮使用胰島素 (用法用量及持續期間視臨床需要而定)、靜脈輸注補水, 並依當地準則進行適當的臨床處置。 如果 24 小時內空腹血糖降至 ≤ 500 mg/dL (或 ≤ 27.8 mmol/L) , 請根據空腹血糖於此表中對應等級的劑量調整準則。 如果確認空腹血糖在 24 小時後 > 500 mg/dL (或 ≥ 27.8 mmol/L) , 則永久停用 TRUQAP。

^a 關於疑似或確診的糖尿病酮酸中毒 (DKA) 之管控, 請參閱 5.1 節。

^b 依美國國家癌症研究院不良事件常用術語標準 (NCI CTCAE) 4.03 版分級。

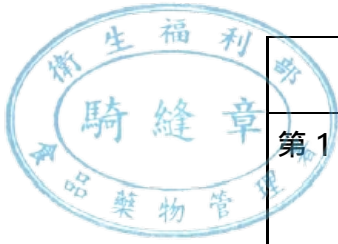
^c 也應考慮 HbA1C 升高。

^d 關於血糖及其他代謝參數的監測, 進一步建議請參閱 5.1 節。

腹瀉

對於腹瀉復發之病人, 考慮採取次級預防性用藥。

表 4：腹瀉的 TRUQAP 建議劑量調整



CTCAE 分級 ^a	建議
第 1 級	無需調整 TRUQAP 劑量。 視臨床需要開始適當的止瀉療法，加強支持性照護及監測。
第 2 級	視臨床需要，開始或加強適當的止瀉治療及監測病況。 若臨床需要，中斷 TRUQAP 給藥至多 28 天，直到復原至 ≤ 第 1 級，以相同劑量等級或降低一個劑量等級重新開始 TRUQAP 治療。 如果第 2 級腹瀉持續或復發，視臨床需要，維持適當的藥物治療並降低一個劑量等級恢復使用 TRUQAP。
第 3 級	中斷 TRUQAP。 視臨床需要，開始或加強適當的止瀉治療及監測。 如果 28 天內症狀改善至 ≤ 第 1 級，降低一個劑量等級恢復使用 TRUQAP。 如果 28 天內症狀未改善至 ≤ 第 1 級，則永久停用 TRUQAP。
第 4 級	永久停用 TRUQAP。

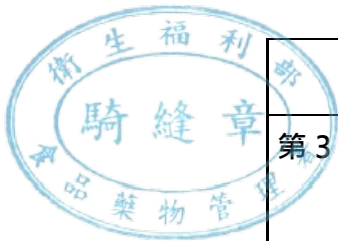
^a 依美國國家癌症研究院不良事件常用術語標準 (NCI CTCAE) 5.0 版分級。

皮疹及其他皮膚藥物反應

所有等級的皮膚藥物反應不論是否嚴重，皆應考慮諮詢皮膚科醫師。持續發生皮疹及/或先前發生第 3 級皮疹的病人，應考慮以繼續給予口服抗組織胺及/或外用類固醇，做為次級預防性用藥。

表 5：皮疹及其他皮膚藥物反應的 TRUQAP 建議劑量調整

CTCAE 分級 ^a	建議
第 1 級	無需調整 TRUQAP 劑量。 視臨床需要開始使用潤膚劑，並考慮加入非鎮靜性口服抗組織胺治療，以控制症狀。
第 2 級	開始或加強外用類固醇治療，並考慮使用非鎮靜性口服抗組織胺。 如果治療後未改善，應中斷 TRUQAP。 皮疹改善至臨床上可耐受時，以相同劑量等級恢復治療。



CTCAE 分級 ^a	建議
第 3 級	中斷 TRUQAP。 開始適當的皮膚科治療，可使用中效/強效外用類固醇、非鎮靜性口服抗組織胺及/或全身性類固醇。 如果 28 天內症狀改善至 $\leq$ 第 1 級，降低一個劑量等級恢復 TRUQAP 治療。 如果 28 天內症狀未改善至 $\leq$ 第 1 級，則停用 TRUQAP。 復發無法耐受 $\geq$ 第 3 級皮疹的病人，考慮永久停用 TRUQAP。
第 4 級	永久停用 TRUQAP

^a 依美國國家癌症研究院不良事件常用術語標準 (NCI CTCAE) 5.0 版分級。

其他毒性

表 6：其他毒性 (高血糖、腹瀉、皮膚藥物反應除外) 的劑量調整及處置

CTCAE 分級 ^a	建議
第 1 級	無需調整 TRUQAP 劑量，視臨床需要開始適當的藥物治療及監測。
第 2 級	中斷 TRUQAP 直到症狀改善至 $\leq$ 第 1 級
第 3 級	中斷 TRUQAP 直到症狀改善至 $\leq$ 第 1 級。如果症狀改善，視臨床情況以相同劑量或降低一個劑量等級恢復使用 TRUQAP。
第 4 級	永久停用 TRUQAP

^a 依不良事件常用術語標準 (CTCAE) 5.0 版分級

併用強效與中效 CYP3A4 抑制劑

應避免 TRUQAP 與強效 CYP3A4 抑制劑合併使用。如果無法避免合併使用，則應將 TRUQAP 劑量減少至每日兩次 320 毫克 (即每日總劑量 640 毫克，參見 7 節)。

併用中效 CYP3A4 抑制劑時，TRUQAP 劑量應減少至每日兩次 320 毫克 (相當於每日總劑量 640 毫克，參見 7 節)。

在強效或中效 CYP3A4 抑制劑停藥後，應於 CYP3A4 抑制劑停藥後第 3 至 5 個半衰期後，恢復使用強效或中效 CYP3A4 抑制劑之前的 TRUQAP 劑量。

3.3 特殊族群用法用量

老年人

老年病人不需要調整劑量 (參見第 11 節)。75 歲以上病人的資料有限。

腎功能不全

輕度至中度腎功能不全病人不需要調整劑量。TRUQAP 未曾研究過用於重度腎功能不全病人的安全性及藥物動力學，因此不建議用於這些病人 (參見 11 節)。

肝功能不全

輕度肝功能不全病人不需要調整劑量。中度肝功能不全病人的資料有限；僅限效益大於風險時，才可將 TRUQAP 用於中度肝功能不全病人，並應監測病人是否出現毒性表徵。TRUQAP 未曾研究過用於重度肝功能不全病人的安全性及藥物動力學，因此不建議用於這些病人 (參見 11 節)。

小兒族群

TRUQAP 並未核准用於兒童病人，因為尚未確立 TRUQAP 用於兒童和青少年的安全性及療效。

4 禁忌

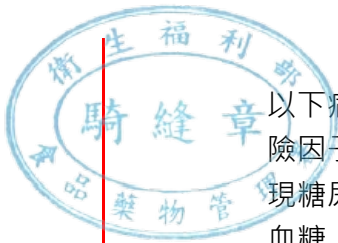
曾對有效成分或 1.2 節所列的任何賦形劑嚴重過敏。

5 警語及注意事項**5.1 警語/注意事項****高血糖**

由於第三期臨床試驗中排除了已有第一型糖尿病或需使用胰島素的第二型糖尿病病人，及/或 HbA1C > 8.0% (63.9 mmol/mol) 的病人，因此未進行 TRUQAP 用於這些病人的安全性及療效的研究。本試驗中 TRUQAP 併用 fulvestrant 組納入 21 名 (5.9%) HbA1C ≥ 6.5% 的病人。基準點 HbA1C ≥ 6.5% 的病人 (28.6%) 比基準點 HbA1C < 6.5% 的病人 (15.4%) 更常發生高血糖。TRUQAP 治療的病人中出現了嚴重高血糖，伴隨糖尿病酮酸中毒 (diabetic ketoacidosis, DKA) 以及致命結果 (參見 8.1 節)。糖尿病酮酸中毒可能在 TRUQAP 治療期間任何時間發生，部分案例在治療在不到 10 天內就出現糖尿病酮酸中毒。有糖尿病史的病人可能需要加強糖尿病治療，並應密切監測。建議糖尿病病人應考慮諮詢治療高血糖的糖尿病專科醫師或專業醫護人員。

在開始 TRUQAP 治療前，需告知病人 TRUQAP 可能導致高血糖 (參見 8.1 節)，如果出現高血糖症狀 (例如：極度口渴、排尿次數或尿量比平時增加、食慾增加但體重下降)，應立即聯絡醫護專業人員。若有其他的共病症和治療 (例如：脫水、營養不良、同時併用化療/類固醇、敗血症)，可能增加高血糖惡化為糖尿病酮酸中毒的風險。如果出現其他非專一性症狀，例如噁心、嘔吐、腹痛、呼吸困難、呼氣有水果味、意識不清、異常倦怠或嗜睡，應考慮將糖尿病酮酸中毒列入鑑別診斷之一。疑似糖尿病酮酸中毒的病人，應立即中斷 TRUQAP 治療。如果確認為糖尿病酮酸中毒，應永久停用 TRUQAP。

在開始 TRUQAP 治療之前，必須依表 7 建議之時程檢測病人的空腹血糖 (FG) 和 HbA1C。依高血糖嚴重度而定，可暫時中斷 TRUQAP 給藥、調降劑量或永久停用 (參見第 3.1 節，表 3)



以下病人建議增加血糖監測頻率：治療期間出現高血糖、基準點有糖尿病酮酸中毒風險因子 (包括但不限於糖尿病、糖尿病前期、常規使用口服類固醇)，以及治療期間出現糖尿病酮酸中毒風險因子 (例如感染、敗血症、HbA1c 升高) (參見表 7)。除了空腹血糖，在病人出現高血糖時，建議也應監測酮體 (最好是血中酮體) 及其他代謝參數 (視臨床需要)。

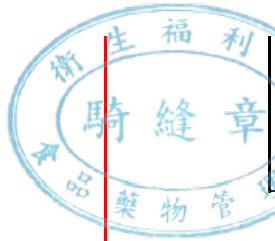
對於基準點有風險因子的病人，和 TRUQAP 治療期間發生高血糖的病人，除了第 3.1 節表 3 建議的高血糖處置，建議也應提供調整生活習慣的衛教諮商。

表 7：接受 TRUQAP 治療的病人，監測空腹血糖和 HbA1c 的建議時程

	所有接受 TRUQAP 治療的病人，監測空腹血糖和 HbA1c 的建議時程	接受 TRUQAP 治療的糖尿病病人，監測空腹血糖和 HbA1c 的建議時程 ¹
篩選時，開始 TRUQAP 治療之前	檢查空腹血糖 (FG)、HbA1c，以及使病人血糖控制最佳化 (參見表 3)。	
開始 TRUQAP 治療後	治療開始後第 1、2、4、6、8 週監測空腹血糖，之後每個月一次。 建議在給藥週的第 3 天或第 4 天，檢查用藥前的空腹血糖。 HbA1c 之監測應每 3 個月一次。	
	依醫護人員指示，定期監測/自我監測空腹血糖，在最初 4 週較頻繁，尤其是治療的最初 2 週內*。	治療的最初 2 週內，每天監測/自我監測空腹血糖。之後依醫護人員的指示，視需要繼續監測空腹血糖，以控制高血糖*。 如果基準點患有糖尿病、糖尿病前期或高血糖，建議在第 4 週進行額外的 HbA1c 檢測。
如果開始 TRUQAP 治療後發生高血糖	在 capivasertib 治療期間和停藥期間應視臨床需要監測空腹血糖，每週至少兩次，直到空腹血糖降至基準點。 應考慮諮詢治療高血糖的專科醫師。 依高血糖的嚴重度而定，可暫時中斷 TRUQAP 給藥、調降劑量或永久停用 (參見 3.1 節，表 3)。	
	在降血糖藥物治療期間應監測空腹血糖，最初 2 個月至少每週一次；之後每 2 週一次或視臨床需要進行 ² 。	

* 所有血糖監測應由醫師視臨床需要進行。

¹ 有糖尿病史的病人，或無糖尿病史但治療期間空腹血糖 > ULN 160 mg/dL (> ULN 8.9 mmol/L) 的病人，或同時使用皮質類固醇，或有間歇性感染或其他病症的



病人，必須更頻繁檢查空腹血糖，並可能需要加強血糖控制，以防止葡萄糖代謝不良惡化及潛在的併發症，例如糖尿病酮酸中毒。

² 建議在給藥週的第 3 天或第 4 天，檢查用藥前的空腹血糖。

腹瀉

接受 TRUQAP 治療的病人經常通報腹瀉情況 (參見 8.1 節)。

腹瀉的臨床後果可能包括脫水、低血鉀和急性腎損傷，在 TRUQAP 治療期間曾通報前述症狀以及心律不整 (低血鉀係風險因子)。

依腹瀉的嚴重度而定，可中斷 TRUQAP 給藥、減少劑量或永久停用 (參見 3.1 節，表 4)。應告知病人一開始出現腹瀉表徵就開始止瀉治療，如果服用 TRUQAP 時發生腹瀉，應增加口服液體攝取量。腹瀉的病人必須維持循環血量正常及電解質平衡，以避免血容量過低、電解質過低的相關併發症。

皮疹及其他皮膚藥物反應

接受 TRUQAP 治療的病人曾通報的皮膚藥物反應，包括多形性紅斑及全身性剝落性皮膚炎 (參見 8.1 節)。應監測病人是否出現皮疹或皮膚炎的表徵和症狀，依皮膚藥物反應的嚴重度而定，可中斷 TRUQAP 給藥、減少劑量或永久停用 (參見 3.1 節，表 5)。建議提前諮詢皮膚科醫師，以利正確診斷並適當處置。

被試驗排除之病人

此藥品未曾研究過用於有症狀的內臟疾病病人的療效及安全性。有臨床重大心臟病史的病人，包括 QTcF > 470 毫秒，有任何增加 QTc 延長、心律不整事件或心臟功能受損之風險因子，或有第一型糖尿病及需使用胰島素之第二型糖尿病病人，以及 HbA1C > 8.0% (63.9 mmol/mol) 的病人，皆被排除在 CAPItello-291 試驗之外。在開立 TRUQAP 給前述病人之前應考量上述情況。

其他藥品

TRUQAP 與強效或中效 CYP3A4 抑制劑併用可能導致 capivasertib 暴露量增加，因而增加毒性風險。有關 TRUQAP 與 CYP3A4 抑制劑併用時的劑量調整，參見 3.1 節。相反地，併用強效與中效 CYP3A4 誘導劑可能會降低 capivasertib 暴露量。應避免強效與中效 CYP3A4 誘導劑併用 TRUQAP。

鈉含量

本藥品每劑的鈉含量低於 1 mmol (23 mg)，基本上可視為「無鈉」。

5.3 操作機械能力

TRUQAP 不影響駕駛和操作機械的能力。然而在 capivasertib 治療期間，曾有倦怠的通報案例，如果這些病人出現這種症狀，應被告知在駕駛或使用機械時應特別謹慎。

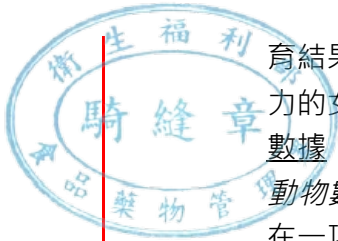
6 特殊族群注意事項

6.1 懷孕

TRUQAP 須與 fulvestrant 併用，請參閱 fulvestrant 核准仿單之懷孕資訊。

根據動物試驗結果以及作用機轉，懷孕女性服用 TRUQAP 可能對胎兒造成傷害 (參見 10.1 節)。目前並無懷孕女性使用 TRUQAP 的資料。

在一項動物生殖試驗中，懷孕大鼠在器官形成期間口服投予 capivasertib，在母體暴露量為建議劑量 400 mg 每日兩次時人體暴露量 (AUC) 的 0.7 倍時，會導致不良的發



育結果，包括胚胎-胎兒死亡和胎兒體重減輕 (參見數據)。應告知懷孕女性及有生育能力的女性其對胎兒的可能風險。

數據

動物數據

在一項胚胎-胎兒發育試驗中，懷孕大鼠在器官形成期間接受口服劑量最高為 150 mg/kg/day 的 capivasertib。投予 capivasertib 150 mg/kg/day 劑量 (依據 AUC，為建議劑量 400 mg 每日兩次時人體暴露量的 0.7 倍)，會導致母體毒性 (體重增加量和進食量減少、血糖升高) 及發育結果不良，包括胚胎-胎兒死亡 (胚胎著床後流失)、胎兒體重減輕和輕微的胎兒內臟變異。

在一項產前及產後評估中，懷孕大鼠從妊娠第 6 天到至少哺乳期至少第 6 天接受口服劑量最高為 150 mg/kg/day 的 capivasertib。投予 150 mg/kg/day 會導致窩仔數量減少及幼崽體重降低。

6.2 哺乳

目前尚不清楚 capivasertib 或其代謝物是否會分泌至人類乳汁當中。研究證實未離乳的大鼠幼崽會暴露於 capivasertib，顯示 capivasertib 可能分泌至乳汁當中。無法排除對於哺乳幼兒的風險 (參見 10.3 節)，TRUQAP 治療期間應停止哺乳。

6.3 有生育能力的女性與男性

男性及女性避孕

應告知有生育能力的女性，接受 TRUQAP 期間應避免懷孕。有生育能力的女性在開始治療前應驗孕，確認結果為陰性才可開始治療，並考慮在整個治療期間重複驗孕。應告知病人，在 TRUQAP 治療期間及完成治療後的一定期間內，使用有效避孕措施：女性至少 4 週，男性至少 16 週。

生育能力

目前並無生育能力的臨床資料。動物試驗中 capivasertib 造成大鼠和狗的雄性生殖器官小管退化，但未影響雄性大鼠的生育力。未曾在動物研究 capivasertib 對於雌性生育力的影響 (參見 10.3 節)。請參閱 fulvestrant 核准仿單資訊。

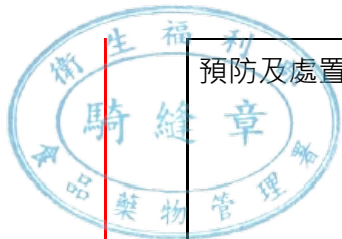
7 交互作用

藥物臨床交互作用的機轉及試驗結果，請見 11 節的說明。

其他藥物對 TRUQAP 的影響

表 8：影響 capivasertib 的 TRUQAP 藥物交互作用

強效 CYP3A4 抑制劑	
臨床影響	Capivasertib 是 CYP3A 受質。併用強效 CYP3A4 抑制劑會提高 capivasertib 濃度，可能增加 TRUQAP 不良反應的風險 (參見 11 節)。

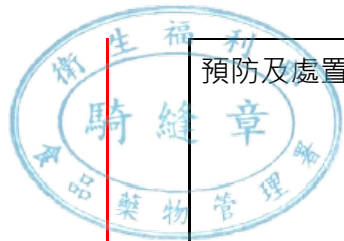


預防及處置	避免與強效CYP3A4抑制劑合併使用。如果無法避免合併使用，應減少TRUQAP 的劑量並監測病人的不良反應。(參見 3.1 節)。
中效 CYP3A4 抑制劑	
臨床影響	Capivasertib 是 CYP3A 受質。併用中效 CYP3A4 抑制劑會提高 capivasertib 濃度，可能增加 TRUQAP 不良反應的風險 (參見 11 節)。
預防及處置	與中效CYP3A4 抑制劑合併使用時，應減少TRUQAP 的劑量並監測病人的不良反應 (參見3.1 節)。
強效與中效 CYP3A4 誘導劑	
臨床影響	Capivasertib 是 CYP3A 受質。併用強效與中效 CYP3A4 誘導劑會降低 capivasertib 濃度，可能減弱 TRUQAP 療效 (參見 11 節)。
預防及處置	避免合併使用強效與中效 CYP3A4 誘導劑。

TRUQAP 對其他藥物的影響

表 9：TRUQAP 可能影響其他藥物的交互作用

CYP3A 受質	
臨床影響	與 TRUQAP 併用時，主要經由 CYP3A 代謝排出的藥物濃度可能提高。依治療劑量範圍而定，可能因而增加這些藥物產生不良反應的風險。
預防及處置	主要經由 CYP3A 代謝排出且治療劑量範圍狹窄的藥物，可能需要調整劑量，請參閱這些藥物仿單資訊之詳細指引。
與肝轉運蛋白 (OATP1B1、OATP1B3) 的交互作用	
臨床影響	對 OATP1B1 及/或 OATP1B3 抑制敏感的藥物，若經由 CYP3A4 代謝，與 TRUQAP 併用可能提高這些藥物的濃度 (參見 11 節)，因而增加這些藥物產生不良反應的風險。



預防及處置	對 OATP1B1 及/或 OATP1B3 抑制敏感的藥物，若經由 CYP3A4 代謝，依治療劑量範圍而定，可能需要調整劑量。請參閱這些藥物仿單資訊之詳細指引。
與腎轉運蛋白 (MATE1、MATE2K、OCT2) 的交互作用	
臨床影響	對 MATE1、MATE2K 及/或 OCT2 抑制敏感的藥物，與 TRUQAP 併用可能提高這些藥物的濃度 (參見 11 節)，因而增加這些藥物產生不良反應的風險。TRUQAP 治療期間可能觀察到暫時性血清肌酸酐升高，因為 capivasertib 會抑制 OCT2、MATE1 及 MATE2K。
預防及處置	對 MATE1、MATE2K、OCT2 抑制敏感的藥物，依其治療劑量範圍而定，可能需要調整劑量。請參閱這些藥物仿單資訊之詳細指引。

8 副作用/不良反應

8.1 臨床重要副作用/不良反應

安全性摘要

TRUQAP 的安全性摘要來自第三期 (CAPItello-291) 試驗中接受 TRUQAP 併用 fulvestrant 的 355 名病人資料。在 CAPItello-291 試驗中，capivasertib 治療的持續時間中位數為 5.42 個月，其中 27% 的病人治療時間 ≥ 12 個月。

最常見的不良反應包括腹瀉 (72.4%)、皮疹 (40.3%)、噁心 (34.6%)、倦怠 (32.1%)、嘔吐 (20.6%)、口腔炎 (17.2%)、高血糖 (16.9%)、頭痛 (16.9%) 及食慾減退 (16.6%)。

最常見的第 3 級或第 4 級不良反應包括皮疹 (12.4%)、腹瀉 (9.3%)、高血糖 (2.3%)、低血鉀 (2.3%)、貧血 (2.0%) 及口腔炎 (2.0%)。

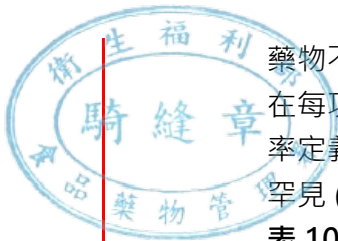
接受 TRUQAP 併用 fulvestrant 的病人，有 6.8% 發生嚴重不良反應。接受 TRUQAP 併用 fulvestrant 的病人，最常見的嚴重不良反應包括皮疹 (2.3%)、腹瀉 (1.7%) 及嘔吐 (1.1%)。

有 17.7% 的病人因為不良反應而調降劑量。導致調降 TRUQAP 劑量的最常見不良反應為腹瀉 (7.9%) 及皮疹 (4.5%)。

有 9.9% 的病人因不良反應而停止治療。導致停止治療的最常見不良反應為皮疹 (4.5%)、腹瀉 (2%) 及嘔吐 (2%)。

不良反應列表

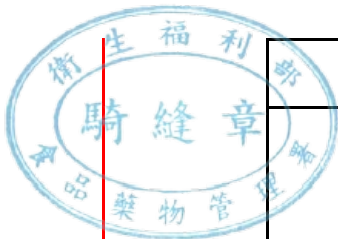
表 10 列出的不良反應來自在臨床試驗中接受 TRUQAP 併用 fulvestrant 建議劑量治療之病人的合併分析資料。



藥物不良反應 (ADR) 依據國際醫學用語詞典 (MedDRA) 系統器官分類 (SOC) 列出。在每項 SOC 中，常用術語依頻率遞減列出，再依嚴重性遞減列出。不良反應的發生頻率定義為：極常見 ($\geq 1/10$)；常見 ($\geq 1/100$ 至 $< 1/10$)；少見 ($\geq 1/1,000$ 至 $< 1/100$)；罕見 ($\geq 1/10,000$ 至 $< 1/1,000$)；極罕見 ($< 1/10,000$)；未知 (無法從現有資料推估)。

表 10：接受 TRUQAP 治療之病人觀察到的藥物不良反應

MedDRA SOC	MedDRA 術語	任何級別 (%)
感染及寄生蟲	尿道感染 ¹	極常見
血液及淋巴系統異常	貧血	極常見
免疫系統異常	過敏 ²	常見
代謝及營養異常	高血糖 ²	極常見
	食慾減退	極常見
	低血鉀	常見
神經系統異常	頭痛	極常見
	味覺障礙	常見
	頭暈	常見
	昏厥	常見
腎臟及泌尿道異常	急性腎損傷	常見
胃腸道異常	口乾	常見
	腹痛	常見
	腹瀉 ²	極常見
	噁心	極常見
	嘔吐	極常見
	口腔炎 ³	極常見
	消化不良	常見
皮膚及皮下組織異常	皮疹 ⁴	極常見
	搔癢	極常見
	皮膚乾燥	常見
	多形性紅斑	常見
	藥疹	少見
	皮膚炎	少見



MedDRA SOC	MedDRA 術語	任何級別 (%)
全身性異常及施用部位症狀	全身性剝落性皮膚炎	少見
	毒性皮膚疹	少見
	倦怠 ⁵	極常見
檢驗結果	黏膜發炎	常見
	發熱	常見
	血中肌酸酐升高	常見
	體重減少	常見
	糖化血色素升高	常見

¹ 尿道感染包括尿道感染及膀胱炎。

² 包括其他相關術語。

³ 口腔炎包括口腔炎、口瘡性潰瘍及口腔潰瘍。

⁴ 皮疹包括紅斑、皮疹、紅斑疹、斑疹、斑丘疹、丘疹、癢疹。

⁵ 倦怠包括倦怠和無力。

特定不良反應之說明

高血糖

接受 TRUQAP 治療的病人，有 61 名 (17.2%) 發生任一級別的高血糖，其中 8 名 (2.3%) 為第 3 級或第 4 級。在試驗中，2 名 (0.6%) 病人因為高血糖而減少劑量，1 名 (0.3%) 停止治療。61 名出現高血糖的病人，有 29 名 (47.5%) 接受降血糖藥物治療，其中 10 名 (16.4%) 使用胰島素。

腹瀉

接受 TRUQAP 的病人，有 257 名 (72.4%) 發生腹瀉，其中 33 名 (9.3%) 為第 3 級及/或第 4 級腹瀉。有 28 名 (7.9%) 病人因腹瀉而減少劑量，7 名 (2.0%) 停用 TRUQAP。在 257 名腹瀉病人當中，59% (151/257) 需使用止瀉藥物控制腹瀉症狀。

皮疹

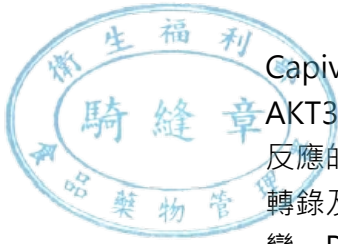
143 名 (40.3%) 病人通報皮疹 (包括紅斑、皮疹、紅斑疹、斑疹、斑丘疹、丘疹和癢疹)。capivasertib 治療組有 44 名 (12.4%) 病人為第 3 級及/或第 4 級。因皮疹的緣故，有 16 名 (4.5%) 病人而減少劑量，有 16 名 (4.5%) 停用 TRUQAP。

9 過量

對於 TRUQAP 用藥過量目前沒有具體的治療，也未確立用藥過量的可能症狀。醫師應遵循一般支持性措施，並治療病人的症狀。

10 藥理特性

10.1 作用機轉



Capivasertib 是一種對於絲胺酸/蘇胺酸激酶 AKT 三種同功型 (AKT1、AKT2 及 AKT3) 的選擇性抑制劑。AKT 是 PI3K (phosphatidylinositol 3-kinase) 訊息傳遞級聯反應的樞紐節點，調控多種細胞程序，包括細胞存活、增生、細胞週期、代謝、基因轉錄及細胞遷移。腫瘤中的 AKT 活化，是由於其他訊息傳遞路徑的上游活化、AKT 突變、PTEN (Phosphatase and Tensin Homolog) 功能喪失，以及 PI3K 催化次單元 (PIK3CA) 突變所造成的結果。

在體外，capivasertib 降低了乳癌細胞株的生長，包括具有 PIK3CA 或 AKT1 相關突變或 PTEN 變異的乳癌細胞株。在體內，capivasertib 單獨或與 fulvestrant 併用可以抑制小鼠異種移植模型的腫瘤生長，其中包括具有 PIK3CA、AKT1 和 PTEN 變異的雌激素受體陽性乳癌模型。

10.2 藥效藥理特性

暴露量-反應關係

針對 capivasertib 的療效，未曾完整探討過暴露量 - 反應關係和藥效反應時程。在劑量為 80 至 800 mg (核准建議劑量的 0.2 至 2 倍) 時，已觀察到腹瀉 (不良事件常用術語標準 [CTCAE] 第 2 級至第 4 級)、皮疹 (CTCAE 第 2 級至第 4 級) 和高血糖 (CTCAE 第 3 級或第 4 級) 的暴露量 - 反應關係。

心臟電生理學

根據一份暴露-反應分析資料，180 名晚期實體惡性腫瘤病人接受 capivasertib 劑量 80 至 800 毫克，在每日兩次服用 400 毫克後達到平均穩定狀態 C_{max} ，預期 QTcF 延長為 3.87 毫秒。

10.3 臨床前安全性資料

10.3.1 致癌性、致突變性及生育力損傷

在一項為期兩年的大鼠致癌性試驗中，觀察到胰島肥大 / 增生的發生率和 / 或嚴重程度增加 (雄性與雌性)，以及雄性大鼠睪丸的腫瘤性變化。這些發現出現在暴露量低於人體的情況下 (依據總 AUC，為人體建議劑量 400 毫克每日兩次時人體暴露量的 0.2 至 0.5 倍)。

在體內大鼠骨髓微核試驗中，capivasertib 透過非整倍體性的 (aneugenic) 作用機轉造成基因毒性。在細菌回復突變 (Ames) 試驗或小鼠淋巴瘤基因突變試驗中，capivasertib 不具體外致突變性。

在大鼠最長為期 26 週及在狗最長為期 39 週的重覆劑量毒性試驗中，分別在大鼠口服 capivasertib 100 mg/kg/day，以及狗口服 15 mg/kg/day (依據 AUC，約為建議劑量 400 mg 每日兩次時人體暴露量的 1 倍) 的劑量下，觀察到睪丸小管退化及附睪中的細胞碎屑。在一項雄性生育力試驗中，雄性大鼠口服 capivasertib 最高達 100 mg/kg/day 的劑量 10 週後，未顯示對雄性生育力的影響。未曾進行動物研究評估 capivasertib 對雌性生育力的影響。

10.3.2 動物毒理及/或藥理

在為期兩年的大鼠致癌性試驗中，觀察到雄性大鼠的水晶體退化，這是在暴露量低於人體的情況下發生的 (依據總 AUC，為人體建議劑量 400 毫克每日兩次時人體暴露量的 0.1 倍)，可能與升高的血糖有關。

11 藥物動力學特性



Capivasertib 的藥物動力學特性已在健康受試者和實體腫瘤病人探討分析。在 80 至 800 毫克劑量範圍內，全身暴露量 (AUC 和 C_{max}) 約隨劑量成比例增加。Capivasertib 採間歇性給藥，每日兩次 400 毫克連續 4 天，然後暫停 3 天，預期從第 2 週開始，在每週給藥第 3 天或第 4 天可達到穩定狀態濃度 AUC 為 8,069 h·ng/mL (37%)， C_{max} 為 1,371 ng/mL (30%)。暫停給藥期間，藥物血漿濃度降低 (約為穩定狀態 C_{max} 的 0.5% 至 15%)。

吸收

Capivasertib 吸收迅速，病人約 1-2 小時可達到藥物最高血中濃度 (C_{max})。絕對生體可用率平均為 29%。

食物作用

在高脂、高熱量餐點後 (約 1000 大卡) 服用 capivasertib，相較於整夜空腹後服藥，餐後對空腹的 AUC 和 C_{max} 比例分別為 1.32 及 1.23。在低脂、低熱量餐點後 (約 400 大卡) 服用 capivasertib，藥物暴露量與空腹服藥類似，餐後對空腹的 AUC 和 C_{max} 比例分別為 1.14 及 1.21。隨餐服用對於藥物暴露量並未造成具臨床意義的變化。

分佈

健康受試者靜脈注射給藥後，平均分佈體積 (V_{ss}) 為 2.6 L/Kg。Capivasertib 並未廣泛結合血漿蛋白 (未結合百分比 22%)，血漿對血液比為 0.71。

生物轉換

Capivasertib 主要經由 CYP3A4 及 UGT2B7 酵素代謝。人類血漿中主要代謝物為葡萄糖醛酸苷，佔藥物相關物質總量的 83%。微量氧化代謝物經定量為 2%，capivasertib 佔血液循環中藥物相關物質總量的 15%。並未發現活性代謝物。

排除

病人接受多劑量給藥後，有效半衰期為 8.3 小時。健康受試者單次靜脈注射給藥後，平均總血漿清除率為 38 升/小時；單次口服給藥後，平均口服總血漿清除率為 60 升/小時，每日兩次 400 毫克重複給藥後減少 8%。

單次口服 400 毫克後，尿液的平均總放射性劑量回收率為 45%，糞便為 50%。腎臟清除率佔總清除率 21%。Capivasertib 主要經由代謝排除。

特殊族群

種族、年齡、性別、體重的影響

依據種族/族裔 (包括白人及亞洲病人)、性別 (88% 女性) 或年齡 (26 至 87 歲)，capivasertib 的藥物動力學並無具臨床意義的差異。體重與 capivasertib 擬似口服清除率的相關性達統計顯著，相較於體重 66 公斤的病人，體重 47 公斤的 AUC 預期提高 12%，對 capivasertib 暴露量的影響很小，因此無需依據體重調整劑量。

腎功能不全

根據群體藥物動力學分析，輕度腎功能不全病人的 AUC 及 C_{max} 比腎功能正常的病人高 1% (肌酸酐清除率 60 至 89 毫升/分鐘)。中度腎功能不全病人的 AUC 及 C_{max} 比腎功能正常的病人高 16% (肌酸酐清除率 30 至 59 毫升/分鐘)。

重度腎功能不全或末期腎病的病人 (肌酸酐清除率 < 30 毫升/分鐘) 尚無資料。

肝功能不全

根據群體藥物動力學分析，輕度肝功能不全病人的 AUC 及 C_{max} 比肝功能正常的病人高 5% (膽紅素 $\leq$ ULN 且天冬胺酸轉胺酶 > ULN，或膽紅素 > 1 倍 ULN 至 $\leq$ 1.5 倍 ULN)。輕度肝功能不全病人不需要調整劑量。

中度肝功能不全病人的資料有限，重度肝功能不全病人無資料。

藥物交互作用

其他藥品對 *capivasertib* 的影響

體外試驗證實 *capivasertib* 主要經由 CYP3A4 和 UGT2B7 酵素代謝。

強效和中效 CYP3A 抑制劑對 *capivasertib* 的影響：Itraconazole (強效CYP3A4抑制劑) 預測會使 *capivasertib* 的 AUC 增加至 1.7 倍， C_{max} 增加至 1.4 倍。Erythromycin 和 Verapamil (中效 CYP3A 抑制劑) 預測會使 *capivasertib* 的 AUC 增加至 1.5 倍， C_{max} 增加至 1.3 倍。

強效和中效 CYP3A 誘導劑對 *capivasertib* 的影響：Rifampicin (強效CYP3A4誘導劑) 預測會使 *capivasertib* 的 AUC 減少 70%， C_{max} 減少 60%。Efavirenz (中效 CYP3A4 誘導劑) 預測會使 *capivasertib* 的 AUC 減少 60%， C_{max} 減少 50%。

UGT2B7 抑制劑對 *capivasertib* 的影響：Probenecid (UGT2B7抑制劑) 預測不會對 *capivasertib* 的藥物動力學產生具臨床意義的影響。

制酸劑對 *capivasertib* 的影響：Rabeprazole (制酸劑) 對 *capivasertib* 的藥物動力學未產生具臨床意義的影響。

Capivasertib 對其他藥品的影響

體外研究中，*capivasertib* 會抑制 CYP2C9、CYP2D6、CYP3A4 和 UGT1A1 代謝酵素，以及 BCRP、OATP1B1、OATP1B3、OAT3、OCT2、MATE1、MATE2K 藥物轉運蛋白。

Capivasertib 對 CYP3A 受質的影響：TRUQAP 與 Midazolam (CYP3A受質) 合併使用，使 CYP3A 受質的 AUC 在第 4 天增加至 1.8 倍，在第 7 天增加至 1.2 倍。

Capivasertib 對 CYP2D6 受質的影響：TRUQAP 預測會使 Desipramine (CYP2D6受質) 的 AUC 在第 4 天增加至 2.1 倍。

Capivasertib 對 CYP2C9 受質的影響：TRUQAP 與 Warfarin (CYP2C9 受質) 合併使用，預測不會對 Warfarin 的藥物動力學產生具臨床意義的影響。

Capivasertib 對 UGT1A1 受質的影響：TRUQAP 預測會使 Raltegravir (UGT1A1受質) 的 AUC 在第 4 天增加至 1.7 倍。

12 臨床試驗資料

CAPitello-291 是一項隨機分配、雙盲、安慰劑對照試驗，試驗中納入 708 名病人，旨在研究 TRUQAP 併用 fulvestrant 的療效及安全性，用於罹患 HR 陽性、HER2 陰性 (定義為 IHC 0 或 1+，或 IHC 2+/ISH-) 局部晚期 (無法手術切除) 或轉移性乳癌的成人女性 (停經前或停經後) 及成人男性，其中 289 名病人的腫瘤帶有一種以上符合 PIK3CA/AKT1/PTEN 條件的變異且在芳香環酶抑制劑 (aromatase inhibitor, AI) 基礎治療之期間或治療後腫瘤復發或惡化。

試驗中排除的病人包括：局部晚期 (無法手術切除) 或轉移性疾病已接受超過二線內分泌治療，或已接受超過一線化療；曾接受 AKT、PI3K、mTOR 抑制劑、fulvestrant 及/或其他選擇性雌激素受體降解劑 (SERD) 治療；患有臨床重大葡萄糖代謝異常 (定義為需要胰島素治療的第一型或第二型糖尿病，及/或 HbA1c > 8.0% [63.9 mmol/mol])；有臨床重大心臟病史；有症狀的內臟疾病或其他疾病負擔，不適合接受內分泌治療。

病人按 1：1 比例隨機分配，在每 28 天療程中，每週連續 4 天接受每日兩次 TRUQAP 400 毫克 (N=355) 或安慰劑 (N=353)，然後暫停 3 天。第 1 療程的第 1 天和第 15 天施用 fulvestrant 500 毫克，之後在每 28 天療程的第 1 天施用。未停經/停經前期的女性接受 LHRH 促效劑治療。隨機分配的分層因子包括是否發生轉移到肝、是否曾接受 CDK4/6 抑制劑治療、地理區域。施用治療直到病人發生疾病惡化、死亡、撤回同意書或無法耐受之毒性。隨機分配前收集病人的腫瘤檢體，由中央實驗室回溯性檢測是否帶有 PIK3CA/AKT1/PTEN 變異。

人口學資料和基準點特性在治療組別間平衡分佈。708 名病人的年齡中位數為 58 歲 (範圍 26 歲至 90 歲，且 30.7% 超過 65 歲)；女性 (99%)；白人 (57.5%)、亞裔 (26.7%)、黑人 (1.1%)；美國東岸癌症臨床研究合作組織 (ECOG) 體能狀態 0 (65.7%)、1 (34.2%)；21.8% 未停經或停經前期。所有病人皆曾接受內分泌療法 (100% 使用芳香環酶抑制劑 AI，44.1% 接受 tamoxifen)。70.1% 的病人曾接受 CDK4/6 抑制劑治療，18.2% 的病人曾接受化療治療局部晚期 (無法手術切除) 或轉移性疾病。PIK3CA/AKT1/PTEN 變異子群體的人口學資料大致可代表整體試驗族群。

兩項主要評估指標為整體族群的無惡化存活期 (progression free survival, PFS) 以及 PIK3CA/AKT1/PTEN 變異子群體的 PFS，由試驗主持人依實體腫瘤治療反應評估標準 (RECIST) 1.1 版判定。

在資料截止日期 (DCO) 2022 年 8 月 15 日時，本試驗結果顯示，在整體族群和 PIK3CA/AKT1/PTEN 變異子群體中，接受 TRUQAP 併用 fulvestrant 的病人相較於安慰劑併用 fulvestrant 的病人，PFS 改善皆達到統計顯著 (參見表11)。對 313 名 (44%) 腫瘤未帶有 PIK3CA/AKT1/PTEN 變異的病人群體進行 PFS 探索性分析，結果顯示 HR 為 0.79 (95% CI: 0.61, 1.02)，指出整體族群的差異主要可歸因於腫瘤帶有 PIK3CA/AKT1/PTEN 變異之病人族群的觀察結果。盲性獨立中央審查 (BICR) 的評估，支持試驗主持人的 PFS 評估結果，且兩者一致。在主要 PFS 分析時，OS 的資料尚不完整。整體族群中，接受 TRUQAP 併用 fulvestrant 的病人，以及安慰劑併用 fulvestrant 病人，經試驗主持人評估的 ORR 分別為 22.9% 及 12.2%，變異子群體分別為 28.8% 及 9.7%。

試驗療效結果呈現如表11及圖1。

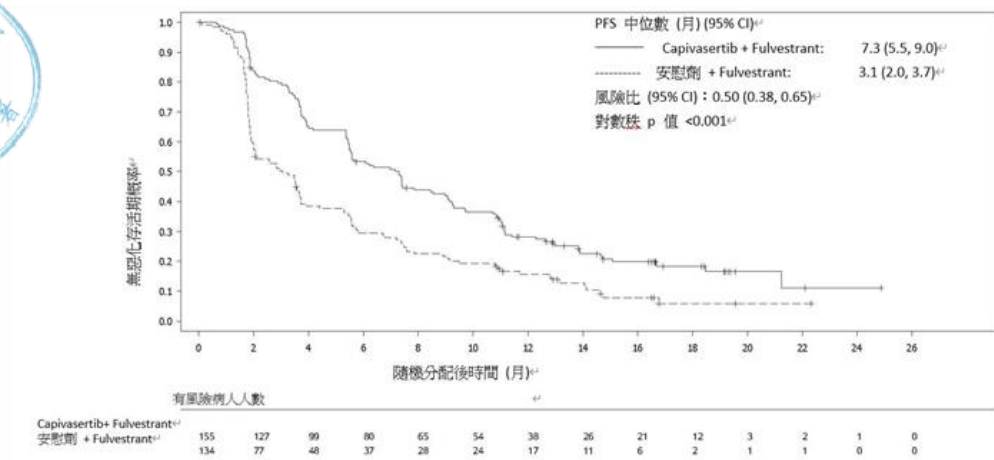
表11 PIK3CA/AKT1/PTEN 變異子群體依試驗主持人評估的無惡化存活期

	PIK3CA/AKT1/PTEN 變異子群體 N = 289	
	TRUQAP + fulvestrant N = 155	安慰劑 + fulvestrant N = 134
PFS 事件數量 – n (%)	121 (78.1)	115 (85.8)
PFS 中位數 (月) (95% CI)	7.3 (5.5, 9.0)	3.1 (2.0, 3.7)
風險比 (95% CI) ^a	0.50 (0.38, 0.65)	
p 值 ^b	<0.001	

^a 分層 Cox 比例風險模型。風險比 < 1 表示 capivasertib + fulvestrant 較佳。整體族群採用對數秩檢定及 Cox 模型，分層因子包括肝轉移 (是或否)、曾使用 CDK4/6 抑制劑 (是或否)、地理區域 (地區 1：美國、加拿大、西歐、澳洲、以色列；地區 2：中南美洲、東歐、俄羅斯；地區 3：亞洲)。變異子群體採用對數秩檢定及 Cox 模型，分層因子包括肝轉移 (是或否) 及曾使用 CDK4/6 抑制劑 (是或否)。

^b 分層對數秩檢定。

圖 1：CAPItello-291 試驗無惡化存活期 Kaplan-Meier 圖 (試驗主持人評估，PIK3CA/AKT1/PTEN 變異子群體)



在所有預先定義的子群體中，相較安慰劑組，TRUQAP 併用 fulvestrant 治療的病人皆觀察到 PFS 改善。

13 包裝及儲存

13.1 包裝

鋁箔盒裝。

13.2 效期

如外包裝所示。

13.3 儲存條件

以原包裝儲存於 30°C 以下。

15 其他

製造廠：AstraZeneca AB

廠址：Gartunavagen, Sodertalje, 152 57, Sweden.

藥商：臺灣阿斯特捷利康股份有限公司

地址：台北市大安區敦化南路二段207號21樓

電話：(02) 23782390

修訂日期：2025年11月

併用仿單許可證：

泛抑癌膜衣錠 160 毫克 (TRUQAP Film-Coated Tablets 160 mg) 衛部藥輸字第028821號

泛抑癌膜衣錠 200 毫克 (TRUQAP® Film-Coated Tablets 200 mg) 衛部藥輸字第028820號

TRUQAP® is a trademark of the AstraZeneca group of companies.

製造廠

AstraZeneca AB

Gartunavagen, Sodertalje, 152 57, Sweden.

藥商

臺灣阿斯特捷利康股份有限公司

台北市大安區敦化南路二段207號21樓