



## MÉCANISME D'ACTION ET INDICATIONS AMM <sup>1</sup>

Antagoniste  
GnRH



- Hormonothérapie : **antagoniste des récepteurs de la GnRH** (hormone sécrétée par l'hypothalamus) qui bloque la transmission du signal de production d'hormones hypophysaires (LH et FSH) → ∩ de la production de testostérone par les testicules
- Indication : traitement en monothérapie des patients adultes atteints d'un **cancer de la prostate avancé hormonodépendant**

## PRÉSENTATION ET CARACTÉRISTIQUES <sup>1</sup>



- Comprimé pelliculé, rouge clair en forme d'amande, dosé à **120 mg**, portant la mention « R » sur une face et « 120 » sur l'autre
- Boîte de 30 comprimés (en flacon à fermeture sécurisée)
- Conservation à température ambiante
- Ne pas déconditionner dans un pilulier.

## PRESCRIPTION ET DISPENSATION <sup>2</sup>

- Prescription **initiale hospitalière** annuelle (liste I) réservée aux spécialistes et services d'oncologie médicale et de cancérologie. Renouvellement non restreint.
- Surveillance particulière pendant le traitement
- Dispensation en pharmacies de ville

Posologie usuelle recommandée : une dose de charge de **360 mg** (trois comprimés) le premier jour, suivie d'une dose de **120 mg/jour** (un comprimé) les jours suivants.

Adaptations possibles : modifications de dose et/ou interruption du traitement selon le type de toxicité et le grade ainsi que selon l'utilisation de médicaments associés (voir RCP)

POSITOLOGIE & MODALITÉS DE PRISE <sup>1</sup>



- IR **légère à modérée** : aucun ajustement posologique
- IR **sévère** : prudence recommandée



- IH **légère à modérée** : aucun ajustement posologique
- IH **sévère** : absence de donnée

Modalités de prise : 1 prise/jour

**à heure fixe, pendant ou en dehors d'un repas**

En cas d'oubli d'une prise de moins de 12h : prendre la dose manquée. La dose suivante sera prise à l'heure habituelle. Le noter dans le carnet de suivi<sup>4</sup>.

En cas d'oubli d'une prise de plus de 12h : ne pas prendre la dose manquée. La dose suivante sera prise à l'heure habituelle, le lendemain, sans la doubler. Le noter dans le carnet de suivi<sup>4</sup>.

En cas de vomissement : ne pas prendre de nouvelle dose. Poursuivre le traitement à l'heure habituelle, sans doubler la dose. Le noter dans le carnet de suivi<sup>4</sup>.

## SURVEILLANCES SPÉCIFIQUES <sup>1</sup>

◆ NFS	◆ Surveillance régulière et selon indication clinique
◆ PSA (antigène prostatique spécifique)	◆ Dosage régulier du taux de PSA
◆ Fonction cardiaque : ECG (allongement QT), ionogramme (kaliémie, magnésémie, calcémie)	◆ Prudence chez les patients avec antécédents ou facteurs de risque d'allongement du QT et chez les patients recevant concomitamment des médicaments susceptibles d'allonger l'intervalle QT
◆ Fonction hépatique (ALAT, ASAT)	◆ Surveillance de la fonction hépatique recommandée durant le traitement pour les patients ayant ou suspectés d'avoir une insuffisance hépatique
◆ Contraception	◆ En cas de rapports sexuels avec une femme en âge de procréer, une contraception efficace doit être utilisée pendant le traitement et durant les 2 semaines qui suivent la dernière prise.

Niveau	Médicaments concernés	Nature de l'interaction médicamenteuse
Association déconseillée	<b>Inhibiteurs de la P-gp</b> Amiodarone, azithromycine, ciclosporine, kétoconazole, lansoprazole, quinidine, vérapamil...	↗ concentration (C°) plasmatique du rélugolix ( <b>surdosage</b> ). Si coadministration inévitable, rélugolix doit être pris avant l'inhibiteur de la P-gp en respectant un intervalle d'au moins 6h. Le traitement par rélugolix peut être interrompu pendant 2 semaines si un traitement court par inhibiteur de P-gp s'avère nécessaire (voir RCP).
	<b>Inducteurs du CYP3A4 et P-gp</b> Carbamazépine, millepertuis, phénytoïne, rifampicine...	↘ C° plasmatique du rélugolix ( <b>inefficacité</b> ). Si coadministration inévitable, la dose de rélugolix doit être augmentée à 240 mg/jour (voir RCP).
Précaution d'emploi	<b>Médicaments allongeant l'intervalle QT</b> Antihistaminiques H1, médicaments hypokaliémians, neuroleptiques...	Risque majoré de troubles du rythme ventriculaire. Surveillance clinique + ECG si coadministration inévitable
A prendre en compte	<b>Phytothérapie, tisanes, huiles essentielles</b>	A évaluer au cas par cas à l'aide des bases de données disponibles (ex : <a href="#">HEDRINE</a> )

P-gp : glycoprotéine P



**Interactions à évaluer en considérant la liste complète des traitements associés, y compris en automédication**  
D'autres interactions peuvent exister (liste non exhaustive) - Contactez votre OMEDIT ou votre [CRPV](#) en cas de question

## GESTION DES PRINCIPAUX EFFETS INDÉSIRABLES (EI) 1,4

Toxicité	Conduite à tenir
<b>Affections de la peau et du tissu sous-cutané</b>	
Rash	Conseils hygiéniques (voir fiche patient). Traitement par antihistaminique par voie orale ± dermocorticoïde ± produit émoullissant ± traitement des surinfections selon la sévérité. Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>rash couvrant 10-30% de la surface corporelle, avec ou sans symptômes associés, interférant avec les activités instrumentales de la vie quotidienne</b> ).
<b>Affections gastro-intestinales</b>	
Constipation, diarrhée, nausées	Conseils hygiéno-diététiques (voir fiche patient). <b>En cas de constipation</b> : traitement symptomatique (laxatifs ± probiotiques en prévention des récives). Surveillance du transit. Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>symptômes persistants avec utilisation régulière de laxatifs ou de lavements ; interférant avec les activités instrumentales de la vie quotidienne</b> ). <b>En cas de diarrhée</b> : réhydratation et traitement symptomatique selon sévérité (antidiarrhéique ± probiotiques) ± anti-infectieux selon étiologie (voir fiche d'aide à la prise en charge de la diarrhée <sup>4</sup> ). Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>augmentation de 4 à 6 selles/j par rapport à l'état habituel</b> ). <b>En cas de nausées</b> : traitement antiémétique ± réhydratation selon sévérité (voir fiche d'aide à la prise en charge des nausées et vomissements <sup>4</sup> ). Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>diminution des prises alimentaires sans perte significative de poids, déshydratation ou malnutrition</b> ).
<b>Affections hématologiques et du système lymphatique</b>	
Anémie	Surveillances biologique et clinique adaptées (voir page 1 et fiche patient). Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>Hb = 10-8 g/dL</b> ).
<b>Affections musculosquelettiques et systémiques</b>	
Arthralgie, dorsalgie, myalgie	Conseils hygiéno-diététiques (voir fiche patient). Traitement symptomatique selon sévérité (usage local ± par voie orale). <b>En cas de courbatures</b> , masser la zone douloureuse avec une crème antalgique chauffante ; possibilité d'associer un antalgique par voie orale. <b>En cas de contractures/crampes</b> , masser la zone douloureuse avec une crème myorelaxante ; possibilité d'associer un décontractant musculaire par voie orale. Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>douleur modérée ; interférant avec les activités instrumentales de la vie quotidienne</b> ).
<b>Affections psychiatriques</b>	
Insomnie	Conseils hygiéno-diététiques (voir fiche patient). Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>difficulté modérée à l'endormissement ou au maintien du sommeil ou réveil précoce</b> ).
<b>Affections vasculaires</b>	
Bouffées de chaleur	Conseils hygiéno-diététiques (voir fiche patient). Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>symptômes modérés ; interférant avec les activités instrumentales de la vie quotidienne</b> ).
Hypertension artérielle	Conseils hygiéno-diététiques (voir fiche patient). Surveillance ; automesure ambulatoire. Traitement symptomatique selon recommandations en vigueur. Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>PAS = 140-159 mmHg ou PAD = 90-99 mmHg ; nécessitant un traitement médical ; répété ou persistant ≥ 24h</b> ).
<b>Troubles généraux</b>	
Céphalées, fatigue, vertiges	Conseils hygiéno-diététiques (voir fiche patient). <b>Céphalées</b> : traitement symptomatique avec antalgiques de palier I ou II. Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>douleur modérée ; interférant avec les activités instrumentales de la vie quotidienne</b> ). <b>Fatigue</b> : surveillances biologique et clinique. Avis spécialiste si <u>grade ≥ 2</u> ( <b>fatigue ne cédant pas avec le repos ; interférant avec les activités instrumentales de la vie quotidienne</b> ).

D'autres EI peuvent survenir : colite, dépression, gynécomastie, hyperhidrose, ↘ de la libido, prise de poids... (liste non exhaustive, voir RCP).



**Pensez à déclarer tout effet indésirable à votre [CRPV](#) et/ou à les contacter en cas de question.**  
**Voir la « fiche Patient » correspondante pour les conseils spécifiques à donner aux patients**

Pour plus d'information, se reporter aux sources suivantes (consultées le 15/03/2024) : 1 - [RCP](#) ; 2 - [RSP ANSM](#) ; 3 - [Thésaurus IM de l'ANSM 08/2023](#) ; 4 - Fiches « Aide à la prise en charge des EI chimio-induits » et carnet de suivi disponibles sur [www.omedit-fiches-cancer.fr](http://www.omedit-fiches-cancer.fr)