

# 愛康鈣軟膠囊0.25/0.5微公克

Alfacalcidol soft capsules 0.25/0.5 TV

|        |                        |               |
|--------|------------------------|---------------|
| 商品名    | 愛康鈣軟膠囊 0.25 μg         | 愛康鈣軟膠囊 0.5 μg |
| 衛署藥輸字號 | 第 021174 號             | 第 021175 號    |
| 類別     | 本藥須由醫師處方使用             |               |
| 貯存方法   | 遮光之密閉容器，室溫保存           |               |
| 使用期限   | 有效日期標示於外盒 (從製造日期 3 年內) |               |

【組成・特性】

|                        |                                                                                                                                                  |         |
|------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------|
| 商品名                    | 愛康鈣軟膠囊 Alfacalcidol Soft Capsules                                                                                                                |         |
|                        | 0.25 微公克                                                                                                                                         | 0.5 微公克 |
| 成分・含量<br>(每 capsule 中) | 含 Alfacalcidol                                                                                                                                   |         |
|                        | 0.25 μg                                                                                                                                          | 0.5 μg  |
|                        | Dehydrated Ethanol,<br>Medium-chain Fatty Acids triglyceride,<br>Gelatin,<br>Concentrated Glycerin,<br>D-Sorbitol Solution,<br>Sunset Yellow FCF |         |
| 製劑                     | 軟膠囊                                                                                                                                              |         |
| 顏色                     | 淡橙色透明                                                                                                                                            | 淡橙色透明   |
| 外觀                     | O (球型)                                                                                                                                           |         |
| 大小                     | Ø = 7.4 mm                                                                                                                                       |         |
| 總重量                    | 約 200mg                                                                                                                                          |         |

【適應症】

骨質疏鬆症・慢性腎衰竭引起之低血鈣症・  
副甲狀腺機能低下症・維生素 D 抵抗性佝僂病・骨軟化症

【用法・用量】

本藥須在謹慎監視病患血清鈣濃度的原則下，  
調整其給藥劑量：

- 慢性腎衰竭、骨質疏鬆症等：  
通常成人 1 日 1 次，口服 alfacalcidol 0.5~1.0 μg，依年齡、症狀適量增減劑量。
- 副甲狀腺機能低下症及其伴有維生素 D 代謝異常之各種疾病：  
通常成人 1 日 1 次，口服 alfacalcidol 1.0~4.0 μg，依年齡、症狀、疾病型態做適量增減。

〔小兒用量〕

通常對小兒骨質疏鬆症以 1 日 1 次給與 alfacalcidol 0.01~0.03 μg / kg；對其它疾患，則 1 日 1 次口服給與 alfacalcidol 0.05~0.1 μg / kg。

此藥應依疾病、症狀做適量增減。

【使用注意事項】依文獻記載

1. 重要的基本注意事項：

- 為防止用藥過量，本劑給藥中，必須定期進行血清鈣質的測定以不超過血清鈣質的正常值範圍來調整劑量。
- 若引起高血鈣症的話，請立即停藥。停藥後，使血清鈣值再回復到正常範圍內時，請減量再行給藥。

2. 交互作用 併用注意 (併用上的注意事項)

|                   |             |                            |
|-------------------|-------------|----------------------------|
| 藥劑名稱等             | 臨床症狀 - 處置方法 | 機制、危險因子                    |
| 含有鎂的藥劑等、氧化鎂、碳酸鎂…等 | 曾有發生高鎂血症的報告 | 不明                         |
| 毛地黃藥劑、異煙基洋地黃毒…等   | 可能會出現心律不整   | 因本藥劑而發生高鎂血症時，會增強異煙基洋地黃毒的作用 |

|                           |             |                  |
|---------------------------|-------------|------------------|
| 藥劑名稱等                     | 臨床症狀 - 處置方法 | 機制、危險因子          |
| 鈣製劑、乳酸鈣、碳酸鈣…等             | 有可能發生高鈣血症   | 本藥劑會促進腸管的鈣吸收。    |
| 維他命 D 及其他誘導體 Calcitriol…等 | 有可能發生高鈣血症   | 加成作用 (Summation) |

3. 副作用

- 對於慢性腎衰竭、副甲狀腺機能降低症、維他命 D 缺乏性佝僂病・軟骨症、幼兒維他命 D 代謝異常導致之各種症狀的改善。病例共 4967 例中，確認 285 例 (5.7%) 471 件有副作用。主要副作用為搔癢感 112 件 (2.3%)、食欲不振 48 件 (1.0%)、嘔吐感 47 件 (0.9%)、下痢 28 件 (0.6%)、GPT 上升 27 件 (0.5%)。(1993.1 為止)
- 骨質疏鬆症 14,808 例中，確認 192 例 (1.3%) 241 件有副作用。主要副作用為 BUN 上升 24 件 (0.2%)、嘔吐感 23 件 (0.2%)、食慾不振 21 件 (0.1%)、胃痛 19 件 (0.1%)、GOT 上升 14 件 (0.09%)。(1993.1 為止)

(1) 嚴重副作用：

- 1) 急性腎衰竭 (頻率不明)：  
急性腎衰竭的發生會伴隨血中鈣濃度的上昇，所以要定期觀察血中鈣濃度的值及腎臟機能，若有發現異常時，請採取停止給藥等適當處理。
- 2) 肝機能障礙、黃疸 (頻率不明)：  
肝機能障礙、黃疸的發生會伴隨 AST (GOT)、ALT (GPT)、A1-P 等的上，所以需充分觀察，若有發現異常時，請採取停止給藥及適當處理。

(2) 其他的副作用：

有下列的副作用時，請採取減量、停用等適當處理

|      |                             |                                                                            |
|------|-----------------------------|----------------------------------------------------------------------------|
|      | 0.1-0.5%                    | <0.1%                                                                      |
| 消化系統 | 食慾不振、噁心<br>嘔吐感、下痢、<br>便秘、胃痛 | 嘔吐、腹部膨脹感、胃部不適<br>消化不良、口內不適感、<br>口渴等                                        |
| 神經系統 |                             | 頭痛、頭重、失眠、煩躁、<br>無力、倦怠感、目眩、麻痺感<br>睏倦、記憶力減退、耳鳴、<br>老人性重聽、背痛、肩膀痠、<br>下肢痠痛、胸痛等 |
| 循環器官 |                             | 輕度血壓上升、心悸                                                                  |
| 肝臟   | GOT、GPT 上昇                  | LDH、γ-GTP 的上昇                                                              |
| 腎臟   | BUN、肌酐的<br>上昇 (腎機能的<br>減弱)  | 腎結石                                                                        |
| 皮膚   | 搔癢感                         | 發疹、發熱感                                                                     |
| 眼    | 結膜充血                        |                                                                            |
| 骨    |                             | 關節周圍的石灰化<br>(形成鈣化骨質)                                                       |
| 其他   |                             | 聲音沙啞、浮腫                                                                    |

4. 對高齡者的給藥

一般而言，高齡者的生理功能已降低，因此須注意用量

## 5. 對孕婦、產婦、授乳婦的給藥

(1) 對於孕婦或有可能已懷孕的婦女，必須只有在治療上判斷其有益性超過危險性時才可給與。(至於人類懷孕中投與之安全性，則尚未確定。在動物實驗中大量給與時，發現胎鼠有骨化延遲的現象。)

(2) 最好避免對餵母乳的母親給藥，不得不使用時，最好避免授乳。(授乳母親的投藥安全性並未確認。動物實驗(Rat)中，經由授乳移轉至新生兒的比率，約為對母體投藥量的1/20。)

## 6. 對小兒的給藥

對小兒患者給藥時，必須十分謹慎地監視血清鈣質等，然後由少量開始投與，而後漸增劑量，並注意防止過量給藥。(因幼鼠(Rat)經口投與所引起的急性毒性，較成熟老鼠(Rat)強。)

## 7. 適用上的注意事項 交付藥劑時

(1) 關於PTP包裝的藥劑，請指導患者需由PTP片取出服用。(曾有因誤服PTP片，使硬的銳角部刺入食道黏膜，進而引起穿孔，併發縱膈膈炎等嚴重合併症的報告。)

(2) 將瓶包裝的藥劑分裝時，請指導除了服用時以外，請勿從藥袋中取出藥劑，以及請勿將藥放在陽光直射的場所。

## 8. 其他注意事項

患有高磷酸血症的患者欲服用本劑時，請與磷酸結合劑併用，以降低血磷濃度。

(7) 口服給與Alfacalcidol之作用，顯示與 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}_3$ 有同等或超過的作用(人，柴田腎炎Rat)<sup>16, 17, 18.)</sup>。

## 【有效成分的物理化學性質】

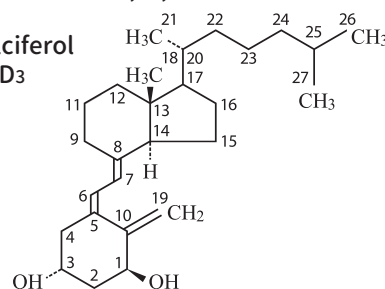
一般名：alfacalcidol (JAN)

化學名：(5Z,7E)-9, 10-secostercholesta-5, 7, 10(19)

-triene- $1\alpha, 3\beta$ -diol

慣用名： $1\alpha$ -hydroxycholecalciferol

$1\alpha$ -hydroxyvitamin D<sub>3</sub>



化學結構式：

化學式：C<sub>27</sub>H<sub>44</sub>O<sub>2</sub>

分子量：400.64

性狀：白色結晶或結晶性粉末，易溶於甲醇、無水乙醇、氯仿、二氯甲烷；可溶於丙酮或乙醚；殆不溶於水、己烷。受空氣或光而變化。

融點(部分分解)：135°C~138°C (JP，一般試驗法)  
137°C~142°C (JP，維生素D<sub>2</sub>測定法)

## 【包裝】

0.25 µg：8~1,000 顆 鋁箔盒裝

0.5 µg：8~1,000 顆 鋁箔盒裝

## 【儲存方法】

規格區分：劇藥指定醫藥品

儲存方法：阻光，密閉容器內 25 °C 保存。

## 【參考文獻】

1. 東平靖雄，他：骨代謝，**12**：152 (1979)
2. Ogura, Y. et al.：Contr. Nephrol., **22**：18 (1980)
3. 藤田拓男，他：腎與透析，**5**：583 (1978)
4. 藤田拓男，他：荷爾蒙與臨床，**27**：99 (1979)
5. 伊丹康人，他：醫學的進步，**123**：958 (1982)
6. Fukushima, M. et al.：Biochem. Biophys. Res. Commun., **66**632 (1975)
7. 須田立雄，他：診療與新藥，**15**：1295 (1978)
8. 須田立雄，他：診療與新藥，**13**：1595 (1976)
9. 鈴木不二男：維生素，**56**：457 (1982)
10. 渡邊正美，他：整形外科基礎科學，**10**：175 (1983)
11. 滋野長平，他：日本內分泌學會雜誌，**58**：1473 (1982)
12. 鈴木正司，他：診療與新藥，**15**：1355 (1978)
13. 福永仁夫，他：診療與新藥，**15**：1521 (1978)
14. Kaneko, C. et al.：Steroids, **23**：75 (1974)
15. Kanis, J. et al.：Br. Med. J., **1**：78 (1977)
16. Nishii, Y. et al.：Endocrinol., **107**：319 (1980)
17. Fukushima, M. et al.：Endocrinol., **107**：328 (1980)
18. 須田立雄：維生素，**54**：407 (1980)

## 【藥動學】依文獻記載

一次5 µg 對人口服給藥時，血漿 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}$ 濃度將迅速上昇，9小時後達到最高值(141.9 pg/mL)，此後逐漸減少，其半衰期是17.6小時<sup>1.)</sup>。

30天連續口服給藥(1 µg/日)時，血漿內 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}$ 濃度是26.1 pg/mL，中止給藥後14天後為21.3 pg/mL，18天後減少至3.1 pg/mL (人慢性腎衰竭)<sup>2.)</sup>。

## 【臨床結果】依文獻記載

用雙盲試驗設計，對慢性腎衰竭、副甲狀腺機能低下症及骨質疏鬆症的患者做比較試驗，證實本藥均具療效<sup>3, 4, 5.)</sup>。

## 【藥效藥理】依文獻記載

### 1. 作用的發現 (Alfacalcidol之25位羥基化)

以肝灌流法(Rat)可以迅速代謝為 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}_3$ ，此肝之25位羥基化反應，對投與四氯化碳或Galactosamine時引起之肝障礙，仍能保持作(Rat)<sup>7.)</sup>。

### 2. 作用、效果

(1) 對於缺乏維生素D或低磷高鈣的食物所飼養的Rat，顯示具有促進抗佝僂病作用及骨石灰化前線形成之促進作用<sup>8.)</sup>。

(2) Alfacalcidol之活性型代謝物 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}_3$ ，具有骨吸收作用及骨再構成作用，(對軟骨細胞之骨細胞的增殖、分化)。(in vitro)<sup>9.)</sup>。

(3) 計測骨形態時，因給與Alfacalcidol，使具有骨芽細胞之類骨面比率增加，此時亦直接作用於骨芽細胞、促進骨之形成(人骨質疏鬆症)<sup>10.)</sup>。

(4) 因連續投與，使血清 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}_3$ 值上昇，同時改善已降低之小腸的鈣吸收率。(人骨質疏鬆症)<sup>11.)</sup>。

(5) 對低鈣血症，會因腸之鈣吸收促進作用(慢性腎衰竭、副甲狀腺機能低下症)及骨鹽溶出作用(腎臟或副甲狀腺摘除之Rat)，使血清鈣上昇<sup>8, 12.-14.)</sup>。停止給藥後，顯示血清鈣質迅速下降，由血清鈣之變化得到半衰期為3.4日的報告(人)<sup>15.)</sup>。

(6) 能改善腎性骨Dystrophy之骨吸收之窩面及肥厚之類骨層(慢性腎衰竭<sup>12.)</sup>，柴田腎炎Rat<sup>16, 17.)</sup>)。又能降低肥大之副甲狀腺重量及血中副甲狀腺荷爾蒙，抑制續發性之副甲狀腺機能亢進<sup>12, 16, 17.)</sup>。

委託廠：TOYO CAPSULE CO. LTD.

製造廠：Fuji Capsule Co., Ltd. Shibakawa Plant

廠址：789 Kamiyuno, Fujinomiya-shi,  
Shizuoka-ken, Japan

藥商：一成藥品股份有限公司

22101新北市汐止區新台五路一段77號19樓之8