

核准日期:

修改日期:

阿法骨化醇片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

【药品名称】

通用名称: 阿法骨化醇片

商品名称: 立庆

英文名称: Alfacalcidol Tablets

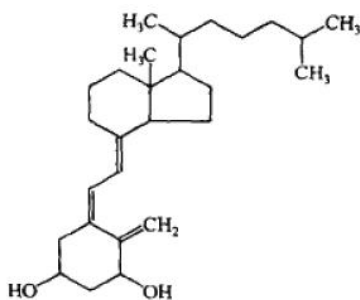
汉语拼音: Afaguhuachun Pian

【成份】

本品主要成份: 阿法骨化醇

化学名称: (5Z,7E)-9,10-开环胆甾-5,7,10(19)-三烯-1 α ,3 β -二醇

化学结构式:



分子式: $C_{27}H_{44}O_2$

分子量: 400.64

【性状】

本品为白色片。

【适应症】

1. 骨质疏松症
2. 改善下列疾病所致的维生素 D 代谢异常的各种症状 (如低血钙, 手足搐)

搦，骨痛，骨病变等)

- 慢性肾功能衰竭
- 甲状旁腺功能减退症
- 抗维生素 D 佝偻病、软骨病

【规格】

每片中分别含阿法骨化醇

(1) 0.25 μ g (2) 0.5 μ g

【用法用量】

在充分控制患者正常血钙值的基础上，调整本品的服用量。

● 慢性肾功能衰竭、骨质疏松症：

通常，成人 1 日 1 次，口服阿法骨化醇片 0.5 μ g。但应按年龄、症状适当增减用量。

● 甲状旁腺功能减退症，其他的维生素 D 代谢异常所致的疾病：

通常，成人 1 日 1 次，口服阿法骨化醇片 1.0 ~ 4.0 μ g。但应按疾病、年龄、症状、病型适当增减用量。

【不良反应】 据国外文献报道

(1) 治疗骨质疏松症

14,808 例中报告不良反应有 192 例(1.3%)241 件。其中主要的是血尿素氮(BUN)上升(0.2%)、呕吐感(0.2%)、食欲不振(0.1%)、胃痛(0.1%)、天冬氨酸氨基转移酶 (AST)上升(0.09%)等。

(2) 治疗慢性肾功能衰竭、甲状旁腺功能减退症、抗维生素 D 佝偻病、软骨病、未成熟儿的维生素 D 代谢异常所致的各种症状的改善

4,967 例中报告不良反应有 285 例(5.7%)471 件。其中主要的是搔痒感(2.3%)、食欲不振(1.0%)、呕吐感(0.9%)、腹泻(0.6%)、丙氨酸氨基转移酶 (ALT)上升(0.5%)等。

重大的不良反应

- (1) 急性肾功能衰竭 (频度不明)：因血清钙上升偶伴有急性肾功能衰竭的出现，需定期观察血清钙值及肾功能，当发现有异常时，应采取确切的停药等措施。

(2) 肝功能障碍、黄疸（频度不明）：伴 AST、ALT、碱性磷酸酶（ALP）的上升等的肝功能障碍、黄疸的出现，应进行充分的观察，当发现有异常时，应采取确切的停药等措施。

其他的不良反应

在发生如下不良反应时，应采取确切的减量、停药等措施。

频度 种类	0.1~5%	小于 0.1%
消化系统	食欲不振、恶心、呕吐感、腹泻、便秘、胃痛	呕吐、腹胀、胃部不适、消化不良、口腔内不适感、口渴
精神神经系统		头痛、头重、失眠、精神恍惚、乏力、倦怠感、头晕、麻木感、嗜睡、记忆力减退、耳鸣、老年性耳聋、背痛、肩部的肌肉僵硬、下肢的紧张感、胸痛
循环系统		轻度的血压上升、心悸
肝脏	AST 上升、ALT 上升	乳酸脱氢酶（LDH）上升、 γ -谷氨酰转肽酶（ γ -GTP）上升
肾脏	BUN 上升、肌酐（Cr）上升（肾功能减退）	肾结石
皮肤	搔痒感	皮疹、发热感
眼	结膜充血	
骨		关节周围的钙化
其他		嗓音嘶哑、水肿

【禁忌】

高钙血症患者禁用。

【注意事项】

1. 服用本品的同时，根据医嘱，酌情补充钙剂。
2. 服药期间，应在医生指导下，严密监测血钙、尿钙水平，调整剂量，发生高钙血症时，立即停药。血钙值恢复到正常范围后，可重新减量给药。
3. 超大剂量服药可能出现胃肠道系统、肝脏、精神神经系统、循环系统等方面的不良反应，如：胃痛、便秘、GOT 及 GPT 升高、头痛、血压轻度升高等。
4. 正在服用抗凝血剂、抗癫痫药、抗酸铝剂、含镁或含钙制剂、噻嗪类利尿剂、洋地黄糖甙药物的患者，请遵医嘱使用本品。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

- (1) 孕妇或可能怀孕的妇女使用本品时要权衡利弊，只有在利大于弊的情况下才能使用。[妊娠期间用药的安全性尚未确立。在动物实验大量给药时，曾出

现胚胎骨化延迟。对性腺的影响包括，受孕率下降胎儿死亡率上升胎儿的发育受到抑制及哺乳力下降等。]

- (2) 哺乳期中最好避免用药，在不得已的情况下用药时停止哺乳。[哺乳期间用药的安全性尚未确立。动物实验（大白鼠）时，哺乳向新生幼年白鼠的移行率相当于母动物用药量的 1/20。]

【儿童用药】

尚不明确。

【老年用药】

一般来说，因高龄者生理功能低下，要注意服用量。

【药物相互作用】

与下列药物联合应用应注意：

制剂名	临床症状	机理、危险因子
含镁制剂（氧化镁、碳酸镁等）	偶有引起高镁血症的报告	不明
强心制剂（地高辛等）	有可能出现心律不齐	由本品引起高钙血症时，强心制剂的作用被增强
钙制剂（乳酸钙水化物、碳酸钙等）	有可能出现高钙血症	本品促进肠道对钙的吸收
维生素 D 及其衍生物（骨化三醇等）	有可能出现高钙血症	相加作用
甲状旁腺激素（PTH）制剂（特立帕肽）	有可能出现高钙血症	相加作用

【药物过量】

- (1) 为了预防过量给药，在本品服用期间，应定期测定血清钙值，调整服药量以免导致高钙血症。
- (2) 在发生高血钙时，应立即停止服用。在血清钙值恢复正常后，再开始减量服药。

【药理毒理】

药理作用

口服阿法骨化醇后，迅速由肠道吸收到血液中，通过肝脏微粒体的第 25 位羟化酶的作用，在侧链第 25 位被羟化成活性物质 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}_3$ 分布于肠道及骨等的靶组织，与受体结合促进肠道吸收钙，产生骨盐溶解及成骨等一系列的生理活性作用。

毒理研究

生殖毒性

大鼠妊娠前及妊娠初期、器官形成期、围产期及哺乳期口服予阿法骨化醇，最大剂量 $2.5\mu\text{g}/\text{kg}$ ；兔器官形成期时口服给药，最大剂量 $0.5\mu\text{g}/\text{kg}$ 。结果显示：大鼠在 $0.5\mu\text{g}/\text{kg}$ ，兔 $0.02\mu\text{g}/\text{kg}$ 剂量时均未见异常。大剂量给药组动物出现骨化延迟、对性腺产生影响、受孕率下降、胎儿死亡率升高、胎儿发育受抑制及哺乳力下降等现象

【药代动力学】

据国外文献报道：本品在小肠被吸收，经肝脏迅速代谢成为 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}_3$ 。健康成人 14 例口服阿法骨化醇 $4\mu\text{g}$ ($1.0\mu\text{g}\times 4$ 片) 时血中 $1\alpha, 25-(\text{OH})_2\text{D}_3$ 浓度在 4~24 小时 (平均 11.0 小时) 达到峰值 (平均 $94.6\text{pg}/\text{ml}$)，48~72 小时几乎恢复为服用前值。

【贮藏】

遮光，密闭，室温 (不超过 25°C) 保存。

【包装】

聚酰胺/铝/聚氯乙烯冷冲压成型固体药用复合硬片，药用铝箔

10 片/板 \times 1 板/盒，10 片/板 \times 2 板/盒，10 片/板 \times 3 板/盒

【有效期】

12 个月

【执行标准】

【批准文号】

0.25 μ g: 国药准字 H10950135

0.5 μ g: 国药准字 H10950134

【生产企业】

企业名称: 重庆药友制药有限责任公司

生产地址: 重庆市渝北区人和镇星光大道 100 号

邮政编码: 401121

电话号码: 023-67518018

传真号码: 023-67527018

网 址: <http://www.yaopharma.com>