

	*承認番号	**薬価収載	販売開始
0.25 μ g	23000AMX00159	2018年6月	1990年10月
0.5 μ g	23000AMX00160		
1.0 μ g	23000AMX00161		

活性型ビタミンD₃製剤

* **アルファカルシドールカプセル0.25 μ g「あすか」**

劇薬 * **アルファカルシドールカプセル0.5 μ g「あすか」**

* **アルファカルシドールカプセル1.0 μ g「あすか」**

貯 法：室温保存

（アルミ袋開封後は湿気及び光を避けて保存すること。）

ALFACALCIDOL CAPSULES

アルファカルシドールカプセル

使用期限：外箱等に表示

【組成・性状】

* 販 売 名	アルファカルシドールカプセル0.25 μ g「あすか」	アルファカルシドールカプセル0.5 μ g「あすか」	アルファカルシドールカプセル1.0 μ g「あすか」
成分・含量	1カプセル中 アルファカルシドール		
	0.25 μ g	0.5 μ g	1.0 μ g
添 加 物	中鎖脂肪酸トリグリセリド カプセル本体：ゼラチン、濃グリセリン、D-ソルビトール、酸化チタン、パラオキシ安息香酸エチル、パラオキシ安息香酸プロピル		
	黄色三二酸化鉄	—	三二酸化鉄
剤 形	淡黄色軟カプセル剤	白色軟カプセル剤	淡赤色軟カプセル剤
外 形			
	長径約8.5mm	短径約5.8mm	重量約170mg
識別コード (PTPに表示)	G315	G316	G317

【効能・効果】

- 下記の疾患におけるビタミンD代謝異常に伴う諸症状（低カルシウム血症、テタニー、骨痛、骨病変等）の改善
慢性腎不全、副甲状腺機能低下症、ビタミンD抵抗性クル病・骨軟化症
- 骨粗鬆症

【用法・用量】

本剤は患者の血清カルシウム濃度の十分な管理のもとに投与量を調整する。

- 慢性腎不全、骨粗鬆症の場合
通常、成人1日1回アルファカルシドールとして0.5～1.0 μ gを経口投与する。ただし、年齢、症状により適宜増減する。
- 副甲状腺機能低下症、その他のビタミンD代謝異常に伴う疾患の場合
通常、成人1日1回アルファカルシドールとして1.0～4.0 μ gを経口投与する。ただし、疾患、年齢、症状、病型により適宜増減する。

（小児用量）

通常、小児に対しては骨粗鬆症の場合には1日1回アルファカルシドールとして0.01～0.03 μ g/kgを、その他の疾患の場合には1日1回アルファカルシドールとして0.05～0.1 μ g/kgを経口投与する。ただし、疾患、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

- (1) 過量投与を防ぐため、本剤投与中、血清カルシウム値の定期的測定を行い、血清カルシウム値が正常値を超えないよう投与量を調整すること。
- (2) 高カルシウム血症を起こした場合には、直ちに休薬する。休薬により血清カルシウム値が正常域に達したら、減量して投薬を再開する。

2. 相 互 作 用

【併用注意】（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
マグネシウムを含む製剤 酸化マグネシウム、炭酸マグネシウム等	高マグネシウム血症が起きたとの報告がある。	不明
ジギタリス製剤 ジゴキシン等	不整脈があらわれるおそれがある。	本剤により高カルシウム血症が発症した場合、ジギタリス製剤の作用が増強される。
カルシウム製剤 乳酸カルシウム水和物、炭酸カルシウム等	高カルシウム血症があらわれるおそれがある。	本剤は腸管でのカルシウムの吸収を促進させる。
ビタミンD及びその誘導体 カルシトリオール等	高カルシウム血症があらわれるおそれがある。	相加作用
PTH製剤 テリパラチド	高カルシウム血症があらわれるおそれがある。	相加作用

3. 副 作 用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用

- 1) 急性腎不全（頻度不明）：血清カルシウム上昇を伴った急性腎不全があらわれることがあるので、血清カルシウム値及び腎機能を定期的に観察し、異常が認められた場合には、投与を中止するなどの適切な処置を行うこと。
- 2) 肝機能障害、黄疸（頻度不明）：AST（GOT）、ALT（GPT）、ALPの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

以下のような副作用が認められた場合には、減量・休薬など適切な処置を行うこと。

	頻 度 不 明
消 化 器	食欲不振、悪心・嘔気、下痢、便秘、胃痛、嘔吐、腹部膨満感、胃部不快感、消化不良、口内異和感、口渇等
精神神経系	頭痛・頭重、不眠・いらいら感、脱力・倦怠感、めまい、しびれ感、眠気、記憶力・記憶力の減退、耳鳴り、老人性難聴、背部痛、肩こり、下肢のつばり感、胸痛等
循 環 器	軽度の血圧上昇、動悸
肝 臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、LDH、 γ -GTPの上昇
腎 臓	BUN、クレアチニンの上昇（腎機能の低下）、腎結石
皮 膚	そう痒感、発疹、熱感
眼	結膜充血
骨	関節周囲の石灰化（化骨形成）
そ の 他	嗄声、浮腫

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので用量に注意すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

[ヒト妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。動物実験（ラット）で大量投与の場合、胎児化骨遅延等がみられている。]

- (2) 授乳中は投与を避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。

[授乳婦への投与に関する安全性は確立していない。動物実験（ラット）で授乳による新生児への移行率は、母動物投与量の1/20に相当する。]

6. 小児等への投与

小児に投与する場合には、血清カルシウム値等の観察を十分に行いながら少量から投与を開始し、漸増投与するなど、過量投与にならぬよう慎重に投与すること。

[幼若ラット経口投与における急性毒性は成熟ラットに比べ強くあらわれている。]

7. 適用上の注意

薬剤交付時

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること（PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている）。

8. その他の注意

高リン血症のある患者に投与する場合はリン酸結合剤を併用し、血清リン値を下げること。

【薬物動態】

血漿中濃度¹⁾

（参考）雄性ビーグル犬に本剤と標準製剤それぞれアルファカルシドールとして1.0 μgをクロスオーバー法により絶食単回経口投与して活性代謝物である1α,25-(OH)₂-D₃の血漿中濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC, C_{max}）について統計解析を行った結果、両剤間に有意差は認められなかった。

【臨床成績】

- 骨粗鬆症患者47例を対象とした一般臨床試験（1日1回1 μg, 2週～29カ月投与）において中等度改善以上が27例（57.4%）であった^{2～5)}。
- 慢性腎不全患者65例を対象とした一般臨床試験（多数例は1日0.5～1.0 μg, 3カ月投与）において、有効以上が51例（78.5%）であった^{6～8)}。

【薬効薬理】

1. 骨粗鬆症モデルに対する骨量の減少抑制作用⁹⁾

卵巣を摘出し、坐骨神経切断による運動制限により作成した骨粗鬆症モデルラットに対し、アルファカルシドールを0.1 μg/kg/日、19週経口投与したところ、血清Ca濃度、骨長、骨重量及び灰分重量の減少が対照群に比し有意に抑制された。

2. 腸管からのCa吸収促進作用及び血清Ca濃度上昇作用¹⁰⁾

腎摘出ラット及び疑似手術を施したビタミンD欠乏ラット両群にアルファカルシドールを静脈内投与したところ、十二指腸における⁴⁵Ca輸送能及び血清Ca濃度はいずれも、両群において用量依存的に増加した。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アルファカルシドール

Alfacalcidol [JAN]

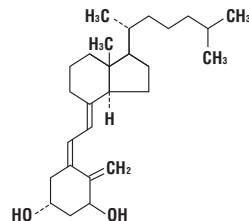
化学名：(5Z,7E)-9,10-Secocholesta-5,7,10(19)-triene-1α,3β-diol

慣用名：1α-hydroxycholecalciferol

1α-hydroxyvitamin D₃

分子式：C₂₇H₄₄O₂

化学構造式：



分子量：400.64

融点：137～142℃

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。メタノール、エタノール（99.5）、クロロホルム又はジクロロメタンに溶けやすく、アセトン又はジエチルエーテルにやや溶けやすく、水又はヘキサンにほとんど溶けない。空気又は光によって変化する。

【取扱い上の注意】

安定性試験¹¹⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、4年）の結果、アルファカルシドールカプセル 0.25 μg「あすか」、アルファカルシドールカプセル 0.5 μg「あすか」及びアルファカルシドールカプセル 1.0 μg「あすか」は通常の市場流通下において4年間安定であることが確認された。

【包装】

アルファカルシドールカプセル 0.25 μg「あすか」：

100カプセル（10カプセル×10）

500カプセル（10カプセル×50）

1,000カプセル（10カプセル×100）

アルファカルシドールカプセル 0.5 μg「あすか」：

100カプセル（10カプセル×10）

500カプセル（10カプセル×50）

1,000カプセル（10カプセル×100）

アルファカルシドールカプセル 1.0 μg「あすか」：

100カプセル（10カプセル×10）

500カプセル（10カプセル×50）

1,000カプセル（10カプセル×100）

【主要文献】

- 社内資料（生物学的同等性試験）
- 大戸 輝也 他：診療と新薬，27：1313，1990
- 田中 守：診療と新薬，27：1323，1990
- 大戸 輝也 他：診療と新薬，29：2541，1992
- 本間 光正：診療と新薬，29：2549，1992
- 鶴田 良成 他：診療と新薬，27：1522，1990
- 池田 嘉宏：診療と新薬，27：1514，1990
- 善山 金彦 他：新薬と臨牀，39：1982，1990
- 社内資料（薬効薬理）
- 津田 敏治 他：実中研・前臨床研究報，16：13，1990
- 社内資料（安定性試験）

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

あすか製薬株式会社 くすり相談室
〒108-8532 東京都港区芝浦二丁目5番1号
TEL 0120-848-339
FAX 03-5484-8358

製造販売元

あすか製薬株式会社

東京都港区芝浦二丁目5番1号

販売

武田薬品工業株式会社

大阪府中央区道修町四丁目1番1号