

末梢性神經障礙治療劑

“衛采”

彌可保[®] 膠囊 250微公克
500微公克

(甲鈷胺明)

Methycobal[®] Capsules 250 µg "Eisai"
500 µg "Eisai"
(Mecobalamin)

〔貯 存〕 30°C以下儲存

應將開啟包裝後的膠囊避開光線。(光線會使主成分含量減少。)

〔保存期限〕請於包裝上所標示之保存期限內使用

“衛采” 彌可保[®] 膠囊250微公克：衛署藥製字第029034號“衛采” 彌可保[®] 膠囊500微公克：衛署藥製字第029630號

【敘 述】

1. 組成

“衛采” 彌可保[®] 膠囊250微公克：一粒中含mecobalamin 250µg“衛采” 彌可保[®] 膠囊500微公克：一粒中含mecobalamin 500µg

賦形劑包括：crystalline cellulose及corn starch。

2. 產品描述

商品名	劑型及識別碼	外 觀	描 述
“衛采” 彌可保 [®] 膠囊 250微公克 (甲鈷胺明)	膠 囊		紅色(蓋)和淡粉紅色(身)之3號硬膠囊，內容物為微粉紅色之粉末。
	MB .25E		
“衛采” 彌可保 [®] 膠囊 500微公克 (甲鈷胺明)	膠 囊		深紅色(蓋)和紅色(身)之3號硬膠囊，內容物為微粉紅色之粉末。
	MB .50E		

【適應症】

末梢性神經障礙。

〔注意事項〕：

(1) 一般注意：使用過後，若無效果顯現時，不應作長期之使用。

(2) 副作用：(a) 消化器：有時有胃部不適感、食慾不振、噁心、下痢等症狀。

(b) 過敏症：偶有發疹現象。

(3) 其 他：對於從事水銀及其化合物有關之職業者，請避免長期使用。

除非有療效，否則 *Methycobal[®]* 不應無目標地使用超過一個月。

【用法·用量】

本藥須由醫師處方使用。

“衛采” 彌可保[®] 膠囊250微公克：

成人一般口服劑量為一日6粒(Mecobalamin 1,500µg)

分三次口服。

此劑量可依患者年齡及症狀調整。

“衛采” 彌可保[®] 膠囊500微公克：

成人一般口服劑量為一日3粒 (Mecobalamin 1,500µg)

分三次口服。

此劑量可依患者年齡及症狀調整。

【注意事項】

1. 不良反應

在15,180病例中，有不良反應報告為146例(0.96%)。(在不良反應發生率調查結束時)¹⁾

	5%>	≥0.1%	<0.1%
胃腸道		厭食、噁心 / 嘔吐及腹瀉	
過 敏			發 疹

2. 使用上有關注意事項

交付藥物(膠囊)之注意事項

在交付PTP包裝的藥物時，應指導患者在使用前先將藥物由PTP鋁箔片中取出。(曾有PTP鋁箔片被吞服的報告，且鋁箔片尖角可能刺穿食道粘膜，造成穿孔及縱膈炎等嚴重的併發症。)

3. 其他注意事項

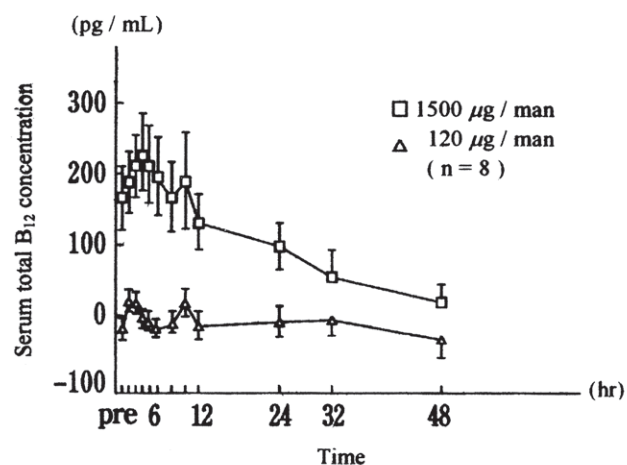
不建議 *Methycobal[®]* 被長期大劑量的使用在從事水銀及其化合物有關之職業者。

【藥物動力學】


1. 單次投與

當健康成人男性志願者單次口服投與*Methycobal[®]* 120µg及1500µg^註時，兩種劑量均於投與後三小時到達總維他命B₁₂(以下縮寫為B₁₂)最高血中濃度，且根據投與劑量被吸收。半衰期、血清中總B₁₂濃度增加量及投與12小時後之ΔAUC₀¹²如以下圖表。投與後8小時的尿中分泌總B₁₂蓄積劑量，為投與後24小時之分泌量的40%~80%。²⁾

註)1500µg單次劑量尚未被核准。

血清中總B₁₂濃度增加量

This Artwork is property of : Eisai Taiwan Inc.

Type: Circular	Regular Color
Product name: 彌可保膠囊	
Item code: F021931012	Special Color (PANTONE)
Printing order: 12	
Pharma code:	紅色
Size: 205x297 m/m	
Date(mm/dd/yy): 05/20/15	
Long Yih Printing Company TEL : (02) 77091988 0935874015	WARNING: Proof color may not reflect true Pantone color. Artworks may not be altered.

Does	t _{max} (hr)	C _{max} (pg/mL)	ΔC _{max} (pg/mL)	ΔC _{max} (%)	AUC ₀ ^{12*1} (pg-hr/mL)	t _{1/2} ^{*2} (hr)
120μg	2.8±0.2	743±47	37±15	5.1±2.1	168±58	N.A.
1500μg	3.6±0.5	972±55	255±51	36.0±7.9	2033±510	12.5

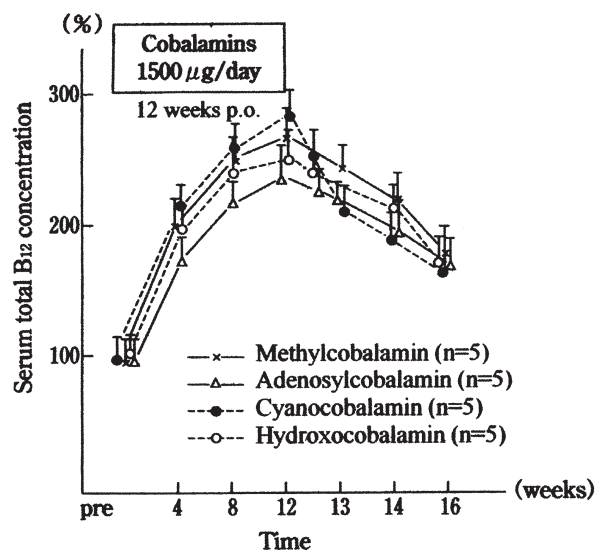
Mean ± S.E., n=8

*以梯形法算出投與前至投與後12小時之增加值。

*由投與後24~48小時之平均值算出。

2. 連續投與

健康成人男性志願者每日投與Methycobal® 1500μg連續12週，並測定血清中總B₁₂濃度直到最後一次投與後四週。血清中濃度在投與之前4週增加並到達起始值之2倍。之後濃度逐步增加，在投與後12週到達起始值之2.8倍。血清中濃度會在最後一次投藥後(第12週)下降，但在最後一次投與後4週仍約為起始值的1.8倍。³⁾



【臨床試驗】

臨床效果

在一雙盲試驗中，末梢神經病變患者連續四週每日分三次口服投與1500μg及120μg(低劑量群組) mecobalamin。這些慢性期及固定期末梢神經病變患者，其病情明顯改善比率為：在1500μg群組為17.6%(6/34)而120μg群組為9.7%(3/31)。病情稍有改善比率為：在1500μg群組為64.7%(22/34)而120μg群組為41.9%(13/31)。由此可知每日投與劑量1500μg被證實有效。⁴⁾

在以安慰劑為控制組的雙盲臨床試驗中，末梢神經病變患者連續四週每日投與1500μg mecobalamin及cobamamide。末梢神經病變患者其病情明顯改善比率為：在mecobalamin群組為38.6%(17/44)、cobamamide群組為22.2%(10/45)而安慰劑群組為26.7%(12/45)。由此可知mecobalamin被證實有效。⁵⁾

【藥效藥理】

1. Mecobalamin是一種內生性的B₁₂輔酶

Mecobalamin在由homocysteine合成methionine之甲基轉移作用中，扮演methionine synthetase輔酶之重要角色。

2. Mecobalamin能被充分運輸至神經細胞及胞器，促進核酸及蛋白質合成

在大鼠實驗中，與cyanocobalamin相比mecobalamin較易被運輸至神經細胞胞器中。曾在腦細胞與脊髓神經細胞的大鼠實驗中顯示，mecobalamin參與deoxyuridine合成thymidine的過程，促進貯藏型葉酸的利用及核酸的代謝。另外在大鼠實驗中，mecobalamin與cobamamide相比較能促進核酸與蛋白的合成。⁶⁻⁸⁾

3. Mecobalamin促進神經軸突運輸及再生

在以streptozotocin誘導造成糖尿病的大鼠實驗模式中，mecobalamin能使軸突結構性蛋白運輸到坐骨神經細胞的傳導正常化。對於由adriamycin, acrylamide及vincristine等藥物誘導的神經病變(在大鼠

和家兔)、小鼠的軸突變性模式及大鼠自發性的糖尿病神經病變等實驗中，亦能顯現其對神經病理學及電氣生理學上的神經變性抑制。⁹⁻¹⁴⁾

4. Mecobalamin促進髓鞘形成(磷脂質合成)

Mecobalamin可促進髓鞘脂質主要組成成分lecithin的合成，在大鼠組織培養之神經元髓鞘形成上較cobamamide有用。^{15,16)}

5. Mecobalamin可修復延遲的突觸傳導且使減少的神經傳導物質恢復正常

藉由增加受損的大鼠坐骨神經纖維興奮性，mecobalamin可提早修復終板電位傳導。另外，mecobalamin可使餵食缺乏choline飼料而造成大鼠腦部組織中acetylcholine減少的情形正常化。^{17,18)}

【物理化學性質】

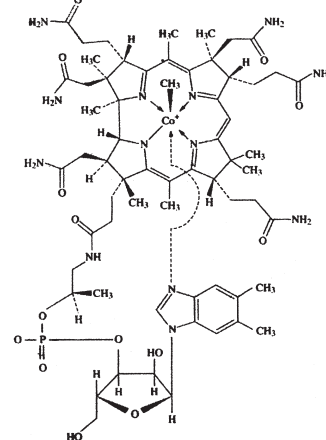
學名：Mecobalamin (JAN,INN)

化學名：Coα-[α-(5,6-Dimethylbenz-1H-imidazolyl)]-Coβ-methylcobamide

分子式：C₆₃H₉₁CoN₁₃O₁₄P

分子量：1,344.38

結構式：



描述：Mecobalamin為暗紅色的結晶或結晶性粉末。

本品難溶於水、微溶於乙醇(99.5)、幾不溶於acetonitrile。

本品有吸濕性，受光會變化。

【包裝】

「衛采」彌可保®膠囊250微公克：12~1,000粒鋁箔盒裝

「衛采」彌可保®膠囊500微公克：6~1,000粒鋁箔盒裝

【參考文獻】

參考文獻	文獻索取號碼
1) Ogawa M.et al.: J.New Remed.Clin.,34,2275,1985.	MBL-0489
2) Tanaka N.et al.: ibid.,35,67,1986.	MBL-0500
3) Tanaka N.et al.: Vitamin,55,155,1981.	MBL-0267
4) Kameyama M.et al.: Clin.Eval.,1,91,1972	MBL-0131
5) Kameyama M.et al.: Jpn.J.Clin.EXP.Med.,49,1963,1972.	MBL-0130
6) Inada M.et al.: Nervous System and Methyl B ₁₂ , (Kyowa Kikaku Tsuushin),23,1981	MBL-0680
7) Nakazawa T.et.Al.: Vitamin,42,193,1970.	MBL-0044
8) Nakazawa T.et al.: ibid.,42,275,1970.	MBL-0045
9) Takenaka T.et al.: Prog.Med.,2,1759,1982.	MBL-0313
10) Ohnishi A.et al.: Jpn.J Clin. Pharmacol.Ther.,18,387,1987.	MBL-0571
11) Watanabe T.et al.: J.Neurol.Sci.,122,140,1994.	MBL-0774
12) Saitoh T.et al.: Nervous System and Methyl B ₁₂ , (Kyowa Kikaku Tsuushin),75,1981.	MBL-0542
13) Yamazaki K.et al.: Neurosci.Lett.,170,195,1994.	MBL-0773
14) Yagihashi S.et al.: Jpn.J.Clin.Pharmacol.Ther.,19,437,1988.	MBL-0624
15) Nakazawa T.et.Al.: Nervous System and Methyl B ₁₂ , (Kyowa Kikaku Tsuushin), 54,1981.	MBL-0679
16) Yonezawa T.et al.: ibid., 49, 1981.	MBL-0554
17) Shibuya T.et al.: ibid.,134, 1981.	MBL-0540
18) Sasaki H.et al.: Pharmacol.Biochem.Behav.,43,635, 1992.	MBL-0775

製造廠：保瑞藥業股份有限公司
台南市官田區工業西路54號委託者：衛采製藥股份有限公司
台北市長安東路一段18號9樓

F021931012

Item Code