

“衛采”

**彌可保<sup>®</sup>** 膠囊 **250** 微克  
**500** 微克  
(甲鈷胺明)

**Methycobal<sup>®</sup> 250µg** “Elsai”  
**CAPSULES 500µg** (Mecobalamin)

組 成：

250 微克：1 粒中含有 Mecobalamin 250µg

500 微克：1 粒中含有 Mecobalamin 500µg

效能·效果(適應症)

末梢性神經障礙。

用法·用量

250 微克：

通常，成人 1 日 6 粒 (Mecobalamin 1 日 1.500µg) 分 3 次口服。但可按年齡及症狀適宜增減。

500 微克：

通常，成人 1 日 3 粒 (Mecobalamin 1 日 1.500µg) 分 3 次口服。但可按年齡及症狀適宜增減。

本藥須由醫師處方使用。

〔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 ③消化器：有時有胃部不適感，食慾不振、噁心、下痢等症狀。④過敏症：偶有發發現象。⑤其他：對於從事水銀及其他化合物有關之職業者，請避免長期使用。

藥效藥理

## 1. 促進核酸·蛋白·脂質代謝

白鼠之腦由來株細胞的實驗中得知，本劑係 Homocysteine 合成 Methionine 時的輔酵素，特別是參與由 Deoxyuridine 合成 Thymidine 之系統，促進 DNA、RNA 之合成。又在使用神經膠細胞之實驗中，本藥有促進髓鞘之主要構成脂質之 Lecithine 的合成。

## 2. 充分移行至神經組織，改善代謝障礙

本藥係血液、髓液中多量存在的  $CH_3-B_{12}$ 。在大白鼠的實驗中，向神經細胞內之小器官的移行性，比  $CN-B_{12}$  優異。又，在實驗性糖尿病大白鼠的坐骨神經細胞內，有促進軸索之骨骼構成成分蛋白質的合成，使骨骼蛋白之輸送速度趨近正常化，維持軸索之機能。

## 3. 修復實驗性神經障礙模樣的神經組織

用大白鼠、家兔之試驗中，對由 Adriamycin Vincristine 所引起的藥物性神經障礙及由 Streptozotocin 所引起的實驗性糖尿病，本劑在神經病理學、電氣生理學上，確認有抑制變性神經出現的作用。又，壓迫豚鼠之顏面神經而作成顏面神經麻痺之模樣實驗中，由瞬目反射、誘發肌電圖及組織學上檢討神經再生過程的結果，本藥顯示和 Steroid 有同等的麻痺回復效果。

彌可保膠囊是衛材公司開發的末梢性神經障礙治療劑。本劑含有血液、髓液中存在的輔酵素型 Vitamin  $B_{12}$ ，Mecobalamin，向神經組織之移行性比其他之  $B_{12}$  為優異。

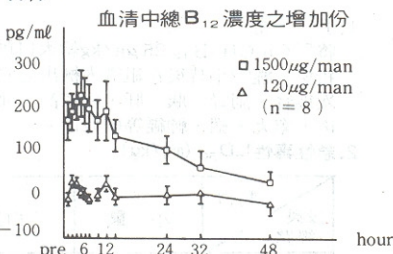
在生化學上，由於 Methyl 基之轉移反應而促進核酸·蛋白·脂質代謝，在藥理學上，能修復有障礙的神經組織。

臨床上，經二重盲檢比較試驗結果，本劑對糖尿病性神經障礙、多發性神經炎等之末梢性神經障礙，特別是對麻木、疼痛、麻痺，其有用性確為最新之藥劑。

體內藥物動態

## 1. 單次投與

健康人單次經口投與 120µg、1500µg 時，兩者於投與後 3 小時均達最高血中濃度，依其濃度而吸收。半衰期、血清中總  $B_{12}$  濃度之增加份及  $\Delta AUC$  如下圖及下表。尿中總  $B_{12}$  排泄量方面，投與後 8 小時，之排泄量為投與後 24 小時之排泄量的 40~80%。



投與量	$t_{max}$ (hour)	$C_{max}$ (pg/ml)	$\Delta C_{max}$ (pg/ml)	$\Delta C_{max}\%$ (%)
120µg	2.8 ± 0.2	743 ± 47	37 ± 15	5.1 ± 2.1
1500µg	3.6 ± 0.5	972 ± 55	255 ± 51	36.0 ± 7.9

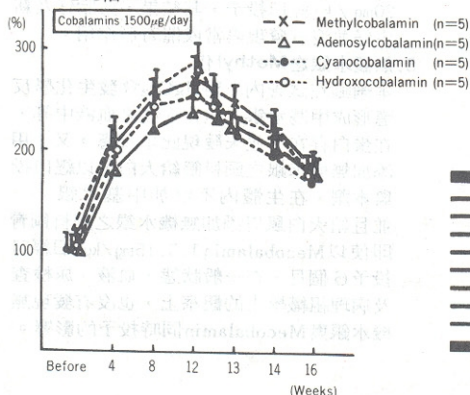
投與量	$\Delta AUC^{0-24}$ (hour · pg/ml)	$t_{1/2}^{22}$ (hour)
120µg	168 ± 58	不能算出
1500µg	2033 ± 510	12.5

\* 1 從投與後 12 小時之實測值對投與前之值的增加份，依梯形法算出。

\* 2 從投與後 24~48 小時之平均值算出。  
平均 ± 標準誤差。

## 2. 連續投與

健康人每日經口投與 1500µg 連續服用 12 週，觀察投與中止後 4 週之血清中總  $B_{12}$  量之變動率。投與 4 週後，約達投與前之值的 2 倍，以後也漸增，12 週後約為 2.8 倍。投與中止 4 週後，也約達投與前之值的 1.8 倍。



(請接背面)

## 臨床適用

### 1. 臨床效果

在包含二重盲檢試驗之臨床試驗中，對末梢性神經障礙之有效率為44.5% (5503 / 12373)。又，以他種B<sub>12</sub>劑 (DBCC) 及小用量 (120μg) 為對照之二重盲檢試驗結果得知，在慢性・固定期之症例中，本劑之有用性被肯定。

### 2. 副作用及臨床檢查值的變動

總症例15180例中，有副作用報告者為146例 (0.96%) 主要之副作用為食慾不振52例 (0.34%)、胃腸障礙38例 (0.25%)、噁心・嘔吐18例 (0.18%)、軟便・下痢17例 (0.11%) 等消化器症狀以及發疹14例 (0.09%)。此外，認為是由於本劑所引起的臨床檢查值的變動尚無報告。

## 非臨床實驗

### 1. 分布

將<sup>14</sup>C-CH<sub>3</sub>B<sub>12</sub> 25 μg/kg 給大白鼠經口投與，經72小時後在組織內檢出之濃度依次為腎、副腎、胰、肝、胃較高，而在肌肉、睪丸、腦、神經等則較低。

### 2. 急性毒性LD<sub>50</sub> (mg/kg)

動物 投與 經路	動物	
	小鼠	大白鼠
經口	>1,000	>500

### 3. 亞急性毒性

給大白鼠以0.2.2.0.20mg/kg / 日經口投與一個月，其結果，各投與群在一般症狀、體重、血液、尿、臟器重量以及病理組織學的檢查等均沒有發現必須特記的變化。

### 4. 慢性毒性

給大白鼠以0.2.2.0.20mg/kg / 日連續經口投與6個月。其結果，各投與群在一般症狀、體重、血液、尿、臟器重量以及病理組織學的檢查等均沒有發現必須特記的變化。

### 5. 生殖試驗

給小鼠及大白鼠在器官形成期以0.2.2.0.20mg/kg 經口投與，其結果，對胎仔及新生仔並沒有發現異常或催奇形作用。

### 6. 無機水銀之Methyl化

本劑雖在試管內，對HgCl<sub>2</sub>會發生化學反應形成甲基水銀，但在人體之血液中等，在蛋白存在下並未發現此項反應。又，用添加無機水銀之飼料餵給大白鼠以經口投與本劑，在生體內不增加甲基水銀。並且給大白鼠以添加無機水銀之飼料飼育即使以Mecobalamin 1.5.15mg/kg/日經口投與6個月，在一般狀態、血液、尿檢查及病理組織學上的觀察上，也沒有發現無機水銀與Mecobalamin同時投與的影響。

## 性 狀





### 1. 製劑之性狀

250微公克：

本品為紅色 (蓋) 和淡粉紅色 (身) 之3號硬膠囊，內容物為微粉紅色之粉末。

500微公克：

本品為深紅色 (蓋) 和紅色 (身) 之3號硬膠囊，內容物為微粉紅色之粉末。

販賣名	識別號	外形	断面
“衛采” 彌可保膠囊 250微公克 (甲鈷胺明)	MB.25E		
“衛采” 彌可保膠囊 500微公克 (甲鈷胺明)	MB.50E		

### 2. 有效成分之物理化學性質

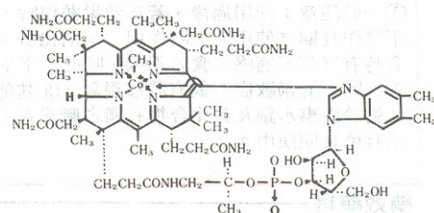
一般名：Mecobalamin

化學名：α-(5,6-Dimethylbenzimidazolyl)-C<sub>o</sub>-methyl-cobamide

分子式：C<sub>63</sub>H<sub>91</sub>CoN<sub>13</sub>O<sub>14</sub>P

分子量：1,344.40

構造式：



### 物理化學的性狀：

Mecobalamin 係深紅色之結晶或結晶性粉末，無臭、庶幾無味。難溶於水、甲醇、乙醇，庶幾不溶於Acetone、ether、Chloroform。本品有吸濕性，受光會變化。

### 保管上的注意

〔貯 藏 法〕①室溫保存

②遮光保存 (受光分解而含量降低。)

〔使用期限〕請依外盒標示之使用期限內使用之。

### 包 裝

“衛采”彌可保膠囊 250 微公克 (甲鈷胺明)：  
12~1000粒鋁箔盒裝

衛署藥製字第029034號

“衛采”彌可保膠囊 500 微公克 (甲鈷胺明)：  
6~1000粒鋁箔盒裝

衛署藥製字第029630號



衛采製藥股份有限公司

台南縣官田鄉二鎮村工業西路54號