



# 艾伏離® 凝膠 0.1% Anefree Gel 0.1%

衛署藥製字第048286號  
G-9291

## 【成份】

Each gm contains:

Adapalene ..... 1mg

## 【賦形劑】

Carbopol、Eddate(Disodium)、Methyl Paraben、Polyethylene Glycol 6000、Propylene Glycol、Sodium Hydroxide、Purified Water

## 【藥理性質】依文獻記載

Adapalene 是一種維生素 A 類化合物，於活體試驗及體外試驗發炎反應中皆顯示其具有抗發炎性，Adapalene 本質上對氧氣及光線呈現穩定狀態，且不會產生化學反應。就機轉而言，Adapalene 類似維生素 A 酸(Tretinoin)，可結合特定維生素 A 酸細胞核受體 (Retinoic acidnuclear receptors)；但和維生素 A 酸(Tretinoin)不同的是，Adapalene 不會和細胞質受體結合蛋白 (Cytosolic receptor binding proteins) 相結合。

Adapalene 在 Rhino 小鼠試驗模式施用於皮膚時，具有分解粉刺的性質，且對異常的表皮角質化、分化過程有療效。而表皮異常角質化、分化即為促成尋常痤瘡 (acne vulgaris) 的病理因素，因此推測 Adapalene 的作用模式係使毛囊上皮細胞分化正常而導致微細粉刺的生成減少。

Adapalene 在標準抗發炎檢定分析中皆比參考品維生素 A 酸類優異，此分析包括體外試驗及活體試驗。就機轉方面而言，Adapalene 可抑制人類多形核白血球之趨化反應及化學動力學反應，同時也可抑制花生四烯酸 (Arachidonic Acid) 脂肪氧化 (Lipoxidation) 的方式，抑制其形成發炎前驅媒介物此一代謝作用。此種情況即顯示粉刺的細胞媒介發炎成分可被 Adapalene 改變。對人類病人進行研究也提供了臨床證據。證實使用 Adapalene 於皮膚可有效減少粉刺之發炎成分 (即丘疹和膿胞顯著減少)。

Adapalene 經由人類皮膚之吸收量低：臨床試驗中，長時間經皮膚用藥於大面積粉刺皮膚後採用  $0.15\text{ng} \cdot \text{mL}^{-1}$  之靈敏度分析，結果並未發現任何可測量的血漿 Adapalene 濃度。在投予放射線標示之 [ $^{14}\text{C}$ ] - Adapalene 於大鼠 (IV, IP, 口服及經皮膚吸收)、兔 (IV, 口服及經皮膚吸收)、犬 (IV 及口服) 後，放射性則分佈於數種組織中，最高濃度出現於肝、脾、腎上腺及卵巢：動物體內代謝已被證實主要係經 O -去甲基化(O-Demethylation)、羥基化 (Hydroxylation)，及共軛接合反應 (Conjugation)，排泄主要係經由膽汁途徑。

動物研究中，施用 Adapalene 於兔皮膚長達 6 個月時間及小鼠皮膚長達 2 年時間，皆對 Adapalene 的忍受性良好，全部動物以口服投藥的實驗中，發現的主要毒性症狀係為類似維生素 A 過量症候群，包括了骨質溶解，鹼性磷酸酵素增高，及略為貧血。口服大劑量 Adapalene 對動物體並未造成神經、心血管、或呼吸方面的不良影響：Adapalene 不具致突變性。於小鼠皮膚劑量  $0.6$ 、 $2$  及  $6\text{mg} \cdot \text{kg}^{-1} \cdot \text{d}^{-1}$ ，及大鼠口服劑量  $0.15$ 、 $0.5$  及  $1.5\text{mg} \cdot \text{kg}^{-1} \cdot \text{d}^{-1}$  已完成 Adapalene 的終生使用研究，唯一有意義的發現是，接受 Adapalene  $1.5\text{mg} \cdot \text{kg}^{-1} \cdot \text{d}^{-1}$  劑量的雄大鼠，腎上腺髓質的良性嗜鉻細胞瘤統計上顯著增加。此種改變被視為與經皮膚使用 Adapalene 無關。

## 【適應症】治療尋常性痤瘡。

說明：Adapalene 凝膠劑係經皮膚使用，主要於發生粉刺、丘疹及膿胞的尋常痤瘡：適合治療面部、胸部或背部的痤瘡。

禁忌症：對本藥品的任何成份過敏者不適用。

## 【用法用量】本藥須由醫師處方使用

Adapalene 凝膠劑須於休息前及洗臉後每日一次施用於痤瘡患部，

續背面