核准日期：2025.10.28
修改日期：2026.01.27
修改日期：2026.06.02
修改日期：2026.08.31

阿仑膦酸钠口服溶液说明书

请仔细阅读说明书并在医师或药师指导下使用

【药品名称】

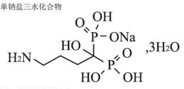
通用名称：阿仑膦酸钠口服溶液
英文名称：Alendronate Sodium Oral Solution
汉语拼音：Alunlinsuanna Koufurongye

【成　份】

本品的活性成份为阿仑膦酸钠。

化学名称：(4-氨基-1-羟基丁叉基)-1，1-二膦酸单钠盐三水化合物

化学结构式：



分子式：$C_4H_{12}NNaO_7P_2 \cdot 3H_2O$

分子量：325.12

辅　料：无水枸橼酸、枸橼酸钠、羟苯甲酯、羟苯丙酯、糖精钠及纯化水。

【性　状】本品为无色的澄清液体。

【适应症】

适用于治疗绝经后妇女的骨质疏松症，以预防髋部和脊柱骨折（椎骨压缩性骨折）。

适用于治疗男性骨质疏松以增加骨量。

【规　格】75ml：70mg（按 $C_4H_{13}NO_7P_2$ 计）

【用法用量】

绝经后妇女骨质疏松症的治疗：

推荐剂量为：每周1次，1次1瓶70mg。

治疗男性骨质疏松症以增加骨量：

推荐剂量为：每周1次，1次1瓶70mg。

本品必须在服药当天第一次进食、喝饮料或应用其它药物治疗之前的至少半小时，用白水送服，因为其它饮料（包括矿泉水）、食物和一些药物有可能会降低本品的吸收（见【药物相互作用】）。

本品应该只能在每周固定的一天晨起时使用。为尽快将药物送至胃部，降低对食道的刺激，本品应在清晨用一满杯（至少60mL）白水送服，并且在服药后至少30分钟之内和当天第一次进食前，病人应避免躺卧。本品不应在就寝时及清早起床前服用。否则会增加发生食道不良反应的危险（见【注意事项】）。

如食物中摄入不足，所有骨质疏松患者都应补充钙和维生素D（见【注意事项】）。患有消化道吸收不良综合征的患者服用时应及时补充更高剂量的维生素D，并考虑监测25-羟基维生素D水平。使用糖皮质激素的患者应补充足量的钙和维生素D。

老年患者或伴有轻至中度肾功能不全的患者（肌酐清除率35～60ml/min）不需要调整剂量。因缺乏相关用药经验，对于更严重的肾功能不全患者（肌酐清除率＜35ml/min），不推荐使用本品。

患者应该被告知，如果出现漏服的情况，请在记起来后的第二天早晨服用一瓶，之后依然按照原本正常的服药计划，请勿在同一天内服用两次。

目前尚未确定本品的最佳疗程。所有经双膦酸盐治疗的患者，都应对是否需要继续使用该类药物进行定期评估。骨折风险较低的患者在用药3至5年后应考虑停用。终止治疗的患者需周期性地对自己的骨折风险进行重新评估。

【不良反应】

据国外文献报道

临床试验经验

由于临床试验实施的条件存在广泛差异，一种药物在临床试验中的不良反应发生率很难与另一种药物直接进行比较，因此可能无法反映临床实践中的实际发生率情况。

治疗绝经后妇女骨质疏松症

每日给药

四项临床试验评估了阿仑膦酸钠治疗绝经后妇女骨质疏松症的安全性，在这四项试验共入组了7453名女性，年龄为44～84岁。研究1和研究2在设计上一致，都是为期3年的双盲、安慰剂对照的多中心研究（美国和多国；n=994）；研究3为骨折干预试验（Fracture Intervention Trial，FIT）中为期3年的椎体骨折队列（n=2027）；研究4为FIT研究中为期4年的临床骨折队列（n=4432）。整体而言，3620名患者接受了安慰剂治疗，3432名患者接受了阿仑膦酸钠治疗。这些临床研究还招募了之前已有胃肠道疾病的患者和同时服用非甾体抗炎药物的患者。在研究1和研究2中，所有女性都以碳酸钙的形式摄入了500mg的元素钙。在研究3和研究4中，每日膳食钙摄入低于1000mg的所有女性额外补充每日500mg的钙和250国际单位的维生素D。

在研究1和研究2接受10mg的阿仑膦酸钠或安慰剂治疗的患者以及研究3和研究4的所有患者之中，因各种原因死亡的发生率在安慰剂组中为1.8%，在阿仑膦酸钠组中为1.8%。严重不良事件的发生率在安慰剂组中为30.7%，在阿仑膦酸钠组中为30.9%。由于临床不良事件而终止研究的患者比例在安慰剂组中为9.5%，在阿仑膦酸钠组中为8.9%。表1显示了这些研究中发生于阿仑膦酸钠或安慰剂组的被研究者判定为可能、很可能或肯定与药物有关且在≥1%患者中报告的不良反应。

表1 在绝经后妇女骨质疏松症的治疗研究中
被研究者判定为可能、很可能和肯定与药物相关的，并且在≥1%患者中报告的不良反应

	美国/多国研究		骨折干预研究	
	阿仑膦酸钠* % （n=196）	安慰剂 % （n=397）	阿仑膦酸钠† % （n=3236）	安慰剂 % （n=3223）
胃肠道				
腹痛	6.6	4.8	1.5	1.5
恶心	3.6	4.0	1.1	1.5
消化不良	3.6	3.5	1.1	1.2
便秘	3.1	1.8	0.0	0.2
腹泻	3.1	1.8	0.6	0.3
肠胃气胀	2.6	0.5	0.2	0.3
反酸	2.0	4.3	1.1	0.9
食管溃疡	1.5	0.0	0.1	0.1
呕吐	1.0	1.5	0.2	0.3
吞咽困难	1.0	0.0	0.1	0.1
腹胀	1.0	0.8	0.0	0.0
胃炎	0.5	1.3	0.6	0.7
肌肉骨骼				
肌肉骨骼（骨、肌肉或关节）疼痛	4.1	2.5	0.4	0.3
肌肉痉挛	0.0	1.0	0.2	0.1
神经系统/精神				
头痛	2.6	1.5	0.2	0.2
头昏	0.0	1.0	0.0	0.1
特殊感觉				
味觉倒错	0.5	1.0	0.1	0.0

*10mg/天治疗3年

†5mg/天治疗2年后改为10mg/天治疗1年或2年。

皮疹和红斑。

胃肠道不良反应：1名接受阿仑膦酸钠10mg每日一次的患者有消化道溃疡和胃切除手术史，且同时在服用阿司匹林，该患者发生吻合口溃疡，并伴有微量的出血，研究者认为这与药物有关。终止阿司匹林和阿仑膦酸钠后，患者康复。在研究1和研究2中的患者中，49%～54%在基线时有胃肠道疾病史，54%～89%在研究过程中服用了非甾体类抗炎药物或阿司匹林。（见【注意事项】）。

每周给药

在为期1年的双盲多中心研究中，研究者将每周服用70mg阿仑膦酸钠与每天服用10mg阿仑膦酸钠进行了比较，评估了前者对治疗绝经后骨质疏松症的安全性。阿仑膦酸钠70 mg每周一次与阿仑膦酸钠10mg每日一次的总体安全性和耐受性相似。被研究者判定为可能、很可能或肯定与药物相关的，并且在任意一治疗组≥1%患者中报告的不良反应列于表2。

表2 在绝经后妇女骨质疏松症的治疗研究中
研究者判定为可能、很可能和肯定与药物相关的，并且在≥1%患者中报告的不良反应

	阿仑膦酸钠每周一次70mg % （n=519）	阿仑膦酸钠10mg/天 % （n=370）
胃肠道		
腹痛	3.7	3.0
消化不良	2.7	2.2
反酸	1.9	2.4
恶心	1.9	2.4
腹胀	1.0	1.4
便秘	0.8	1.6
肠胃气胀	0.4	1.6
胃炎	0.2	1.1
胃溃疡	0.0	1.1
肌肉骨骼		
肌肉骨骼（骨、肌肉或关节）疼痛	2.9	3.2
肌肉痉挛	0.2	1.1

预防绝经后妇女骨质疏松症

每日给药

通过三组双盲、安慰剂对照试验评估40～60岁绝经后女性每天服用阿仑膦酸钠5mg的安全性，这些试验随机选取了1400多名患者服用阿仑膦酸钠2～3年。这些试验表明，每天服用阿仑膦酸钠5mg的患者整体安全性和安慰剂相似。每天服用阿仑膦酸钠5mg的642名患者中有7.5%的人因为临床不良事件而终止试验，服用安慰剂的648名患者的终止率是5.7%。

每周给药

在一项为期一年、双盲且包含723名患者的多中心试验中，对每天服用阿仑膦酸钠5mg的患者和每周服用阿仑膦酸钠35mg的患者进行了评估。阿仑膦酸钠35mg每周一次与阿仑膦酸钠5mg每日一次的总体安全性和耐受性特点相似。

在这些试验中，研究者判定为可能、很可能或肯定与药物相关的且在≥1%患者（阿仑膦酸钠35mg每周一次、阿仑膦酸钠5mg每日一次或安慰剂）中发生的不良反应列于表3。

表3 在绝经后妇女骨质疏松症的预防研究中
研究者判定为可能、很可能和肯定与药物相关并且在≥1%患者中所报告的不良反应

	2年/3年研究		1年研究	
	阿仑膦酸钠5mg/天 % （n=642）	安慰剂 % （n=648）	阿仑膦酸钠5mg/天 % （n=361）	阿仑膦酸钠35mg每周一次 % （n=362）
胃肠道				
消化不良	1.9	1.4	2.2	1.7
腹痛	1.7	3.4	4.2	2.2
反酸	1.4	2.5	4.2	4.7
恶心	1.4	1.4	2.5	1.4
腹泻	1.1	1.7	1.1	0.6
便秘	0.9	0.5	1.7	0.3
腹胀	0.2	0.3	1.4	1.1
肌肉骨骼				
肌肉骨骼（骨、肌肉或关节）疼痛	0.8	0.9	1.9	2.2

伴随使用雌激素/激素替代疗法

在患有骨质疏松症的绝经后妇女中进行的两项研究中（研究时间分别为1年和2年）（n=853），阿仑膦酸钠10mg每日一次与雌激素±孕酮联合治疗（n=354）的安全性和耐受性与单一治疗相似。

治疗男性骨质疏松症

在两项安慰剂对照、双盲、多中心男性患者研究中（阿仑膦酸钠10mg，每日一次的2年研究，和阿仑膦酸钠70mg每周一次的1年研究），因所有临床不良事件而导致的中止治疗率分别为：阿仑膦酸钠10mg每日一次组为2.7%，相应的安慰剂组为10.5%；阿仑膦酸钠70mg每周一次组为6.4%，相应的安慰剂组为8.6%。在这些研究中，研究者判定为可能、很可能或肯定与药物相关的且在≥2%患者（阿仑膦酸钠或安慰剂）中发生的不良反应列于表4。

表4 在男性骨质疏松症患者进行的研究中
研究者判定为可能、很可能和肯定与药物相关的，并且在≥2%患者中发生的不良反应

	2年研究		1年研究	
	阿仑膦酸钠10mg/天 % （n=146）	安慰剂 % （n=95）	每周一次阿仑膦酸钠70mg % （n=109）	安慰剂 % （n=58）
胃肠道				
反酸	4.1	3.2	0.0	0.0
肠胃气胀	4.1	1.1	0.0	0.0
胃食管返流疾病	0.7	3.2	2.8	0.0
消化不良	3.4	0.0	2.8	1.7
腹泻	1.4	1.1	2.8	0.0
腹痛	2.1	1.1	0.9	3.4
恶心	2.1	0.0	0.0	0.0

糖皮质激素引发的骨质疏松症

在两项为期一年、安慰剂对照、双盲、多中心试验中患者接受糖皮质激素治疗，每天5mg和10mg阿仑膦酸钠的整体安全性和耐受性大致和安慰剂相似。经研究者判定为可能、很可能或肯定与药物相关的，并且≥1%每天服用5mg和10mg阿仑膦酸钠或者安慰剂的患者中报告的不良反应见表5。

表5 在糖皮质激素治疗患者进行的一年研究中
研究者判定为可能、很可能和肯定与药物相关的，并且在≥1%患者中报告的不良反应

	阿仑膦酸钠10mg/天 % （n=157）	阿仑膦酸钠5mg/天 % （n=161）	安慰剂 % （n=159）
胃肠道			
腹痛	3.2	1.9	0.0
反酸	2.5	1.9	1.3
便秘	1.3	0.6	0.0
黑粪	1.3	0.0	0.0
恶心	0.6	1.2	0.6
腹泻	0.0	0.0	1.3
神经系统/精神			
头痛	0.6	0.0	1.3

糖皮质激素引发的骨质疏松症患者所接受的第二年持续性治疗试验（阿仑膦酸钠： n=147），其整体安全性和耐受性与第一年所观察到的一致。

Paget's骨病

骨质疏松症和Paget's病临床研究中，3～12个月内每天服用阿仑膦酸钠40mg的175名患者所报告的不良事件类似于每天服用阿仑膦酸钠10mg的绝经后女性中所发生的不良事件。然而，在每天服用阿仑膦酸钠40mg的患者中，上消化道不良反应的发病率明显增加（阿仑膦酸钠为17.7%vs. 安慰剂为10.2%）。其中发生了一例食道炎和两例胃炎，并致使治疗终止。

此外，肌肉骨骼（骨骼、肌肉或关节）疼痛出现在患有Paget's骨病并服用其他双膦酸盐加以治疗的患者中，该病被研究者判定可能、很可能或肯定与药物相关，并出现在大约6%的每天服用阿仑膦酸钠40mg进行治疗的患者中，而服用安慰剂的患者大约有1%，但很少有患者终止治疗。患有Paget's病且每天服用阿仑膦酸钠40mg的患者中有6.4%因临床不良事件而终止治疗，而服用安慰剂的患者有2.4%因临床不良事件而终止治疗。

上市后经验

上市后监测到本品的下列不良反应/事件（发生率未知）：

阿仑膦酸钠在上市后使用过程中，被报告出现下列不良反应。因为这些不良反应来自于无法确定数量的人群自发报告，所以无法可靠估计发生频率，也不能可靠地确定与药物暴露之间的因果关系。

全身反应：过敏反应，包括荨麻疹和血管性水肿。曾经报告服用阿仑膦酸钠后出现一过性肌痛、不适、乏力和发热，通常与初始治疗相关。在存在诱因条件时，会发生症状性低钙血症。外周性水肿。

胃肠道反应：食管炎、食道糜烂、食管溃疡、食管狭窄或穿孔及口咽溃疡；胃或十二指肠溃疡，某些较为严重并伴有并发症（见【注意事项】及【用法用量】）。

局限性下颌骨坏死，可能与拔牙和/或局部感染愈合延迟有关（见【注意事项】）。肌肉骨骼：骨骼、关节、和/或肌肉疼痛、背痛，偶见严重和/或致残的情况（见【注意事项】）；关节肿胀，股骨干非典型骨折（见【注意事项】）。

神经系统：头晕、眩晕和失眠。

呼吸系统、胸部：胸部痛、胸部不适、呼吸困难、急性哮喘加重。

心血管：心悸。

免疫系统：超敏反应。

消化系统：食欲减退。

泌尿系统：血尿症、尿频、肾功能损害。

皮肤：皮疹（偶伴对光过敏），瘙痒，脱发。严重的皮肤反应，包括Stevens-Johnson综合征和毒性表皮坏死溶解症。

眼部症状：眼葡萄膜炎，巩膜炎或表层巩膜炎。

耳部疾病：罕见外耳道胆脂瘤（病灶骨坏死）的报道。

实验室检查结果

在双盲、多中心、安慰剂对照的临床研究中，服用阿仑膦酸钠的患者中分别有约18%和10%出现了轻微且短暂的无症状血清钙和磷的下降，安慰剂组患者血清钙和磷分别下降了12%和3%。但是血清钙下降到低于8.0mg/dL（2.0mM）的发生率和血清磷下降到低于或等于2.0mg/dL（0.65mM）的发生率在两个治疗组中相似。

【禁　忌】

本品禁用于以下情况：

- ●导致食管排空延迟的食管异常，例如食管狭窄或弛缓不能（见【注意事项】）；
- ●不能站立或直坐至少30分钟者（见【用法用量】和【注意事项】）；
- ●对本产品任何成份过敏者，曾经报道过的过敏反应包括荨麻疹和血管性水肿（见【不良反应】）；
- ●低钙血症（见【注意事项】）；
- ●吸入性风险增加的患者禁用本品。

【注意事项】

上消化道不良反应

和其它口服双膦酸盐一样，阿仑膦酸钠可能对上消化道粘膜产生局部刺激。由于阿仑膦酸钠可能产生的刺激性及存在加重潜在疾病的可能性，有活动性上消化道疾病（如Barrett's食道、吞咽困难、其他食管疾病、胃炎、十二指肠炎或溃疡），或近期（过去1年内）有重大胃肠道疾病如消化性溃疡或活跃胃肠道出血或上消化道手术（除了幽门成形术）的患者服用本品时应予以关注。

在口服双膦酸盐（包括阿仑膦酸钠）治疗的患者中，已报告的食管不良反应有食管炎、食管溃疡和食管糜烂，偶见出血，罕有食管狭窄或穿孔。其中有些病例，因这些不良反应加重而需要住院治疗。因此，医生应该警惕可能发生食管反应的任何症状和体征，患者如果发生吞咽困难、吞咽痛、胸骨后疼痛或新发胃灼热或胃灼热加重，应指导其停用本品并就医。

在口服双膦酸盐（包括阿仑膦酸钠）后躺卧、和/或无法将双膦酸盐（包括阿仑膦酸钠）用推荐的一整杯水（175mL～250mL）送服，和/或出现提示食管刺激的症状后仍继续服药的患者，发生严重食管不良反应的风险更大。因此，向患者提供详尽的用药指导，让其充分理解是很重要的（见【用法用量】）。对于那些因智力障碍而不能遵守用药指南的患者，应在适当的监护下应用本品治疗。

已有上市后报告口服使用双膦酸盐会发生胃和十二指肠溃疡，其中有些很严重并伴并发症，尽管对照临床试验中未观察到胃和十二指肠溃疡风险增加。（见【不良反应】）。

颌骨坏死

在服用包括阿仑膦酸钠的双膦酸盐的患者中，可自发报告颌骨坏死（ONJ），这一般与拔牙和/或局部感染（包括骨髓炎）伴愈合延迟相关。颌骨坏死的已知风险因素包括侵入性牙齿治疗（如，拔牙、种植牙、骨科手术）、癌症诊断、伴随治疗（如化疗、放疗、皮质类固醇类药物、血管生成抑制剂、吸烟）、口腔卫生差、伴随疾病（如牙周病和/或先前存在的牙齿疾病、贫血、凝血病、感染、假牙不合）。接触双膦酸盐的时间越长，颌骨坏死的风险也会随之提高。

对于需要接受侵入性牙科手术的患者，停用双膦酸盐治疗可以降低颌骨坏死的风险。治疗医生和/或口腔外科医生的临床判断应基于个体获益/风险评估，指导每个患者的治疗计划。

在接受双膦酸盐治疗时发生了颌骨坏死的患者应接受口腔外科医生的医治。在这些患者中，治疗颌骨坏死的大型牙科手术会加重该情况。基于个体获益/风险评估，应考虑是否终止双膦酸盐的治疗。

在接受双膦酸盐进行治疗时，应鼓励患者保持良好的口腔卫生，接受常规的口腔检查，并报告任何口腔症状，如牙齿松动、疼痛或肿胀。

非典型性股骨干骨折

在接受双膦酸盐治疗的患者中，曾报告出现非典型的低能量或低创伤的股骨干骨折。这些骨折可以出现在小转子以下到髁上锥形部的任一处股骨干，且这些骨折的方向为横向或短斜，无明显的粉碎现象。由于这些骨折也出现在未接受双膦酸盐治疗的骨质疏松患者中，因此这些骨折与双膦酸盐并无一定的因果关系。

非典型性股骨骨折最常见的是其受伤区域只有微小的创伤或没有创伤。这类骨折可能是双侧的，且许多患者报告在该区域有前驱疼痛，通常表现为大腿钝痛，前驱疼痛在出现完全性骨折前会持续几周至几个月。一些报告注意到，患者在骨折时也在接受糖皮质激素（如：强的松）治疗。

有双膦酸盐用药史的患者，如表现出大腿疼或腹股沟疼，则有可能出现了非典型性骨折，应接受评估，以排除不完全股骨骨折。表现出非典型性骨折的患者也应该对侧肢体的骨折症状和体征进行评估。基于个体获益/风险评估，应考虑是否终止双膦酸盐的治疗。

肌肉骨骼疼痛

据上市后经验报告，在使用双膦酸盐（被批准用于骨质疏松的预防和治疗）的患者中曾偶尔发生严重的导致功能障碍的骨、关节和/或肌肉疼痛（见【不良反应】）。这类药物中包括阿仑膦酸钠，多数患者为绝经后女性。自服用药物至症状发作的时间从一天至数月不等。如果出现严重症状，应停用。多数患者停药后症状缓解。重新使用同一药物或其他双膦酸盐后，一些患者可再次出现这些症状。

在阿仑膦酸钠安慰剂对照临床试验中，阿仑膦酸钠组和安慰剂组发生肌肉骨骼疼痛的患者百分比相似。

矿物质代谢

在开始应用本品治疗之前，必须先纠正低钙血症（见【禁忌】）。应对其他可能影响矿物质代谢的疾病（例如维生素D缺乏和甲状旁腺功能减退症）进行有效治疗。对于这些患者，在使用本品治疗期间应监测其血清钙和低钙血症的情况。

由于阿仑膦酸钠可增加骨密度，因此可能会发生轻度的、无症状的血清钙和磷水平下降，尤其是患有Paget's骨病（其骨转换的预处理率将大大提高）和使用糖皮质激素治疗的患者，可能他们的钙吸收会降低。也有一些症状性低钙血症的罕见报道，这些偶尔严重，常发生于具有诱发条件（如甲状旁腺功能减退、维生素D缺乏和钙吸收不良）的患者。

因此，对于患有Paget's骨病和使用糖皮质激素的患者而言，保证摄入足够的钙和维生素D是很重要的。

肾功能损伤

对于肌酐清除率低于35mL/min的患者，不推荐服用本品。肌酐清除率为35～60mL/min的患者不需要调整剂量。

肝功能损害

因为有证据表明阿仑膦酸钠不在胆汁中代谢或排泄，因此未在肝功能损害患者中进行研究。无需进行剂量调整（见【临床药理】）。

糖皮质激素引发的骨质疏松症

尚未确定阿仑膦酸钠在糖皮质激素每日治疗剂量少于或等于7.5mg强的松时的风险和益处。治疗开始之前，应确定男性和女性的性腺荷尔蒙状况并考虑合适的替代。

治疗初期应进行骨密度测量，并在联合服用阿仑膦酸钠和糖皮质激素6到12个月之后重复测量骨密度。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠

现有在孕妇人群中的研究数据尚不能充分说明使用阿仑膦酸钠与母体和胎儿产生不良妊娠结局风险的相关性，确认妊娠后停用阿仑膦酸钠。

双膦酸盐吸收于骨基质中，并在数年期间从骨质中逐渐释放。吸附于成人骨中的双膦酸盐量以及可以释放入系统循环的量直接与所用双膦酸盐的剂量和持续时间有关。没有有关人类胎儿风险的数据。但是，如果女性患者在使用一段时间双膦酸盐后妊娠，理论上存在胎儿伤害的风险，特别是对骨骼的影响。对于以下不同因素，例如，停止双膦酸盐治疗到妊娠之间的时间，所使用的双膦酸盐的具体剂量以及给药途径（相对于口服给药而言的静脉内给药）所导致的风险尚未进行研究。

在大鼠中进行的生殖毒性研究表明，当低于临床推荐剂量的一半剂量时，观察到大鼠的着床存活率降低和正常幼仔的体重增加减少。自3倍临床剂量开始，胎鼠骨化不全部位（椎骨（颈椎、胸椎和腰椎）、颅骨和胸骨）统计学上显著增加。妊娠家兔给予约10倍临床剂量时，未观察到对胎兔有上述相似的影响。

妊娠大鼠给予约4倍临床剂量时，大鼠体内的总钙量和钙离子量均降低，从而导致分娩延迟和失败。当大鼠从交配前直到整个妊娠期间均给予十分之一临床剂量时，大鼠会因低钙血症出现分娩延迟。不同时期（给药时间范围从仅在交配前给药到仅在妊娠早期、中期和晚期给药）给予4倍临床剂量时，在雌性大鼠中均观察到母体毒性（妊娠后期大鼠死亡）；停止给药后，大鼠死亡减少但仍存在。通过饮水或微型真空泵给予钙补充剂不能改善低血钙状态或防止由于分娩延迟所造成的母体和新生儿死亡；通过静脉内给予钙补充剂能够防止母体死亡，但不能防止胎儿死亡。

药物的暴露量是基于表面积，即 mg/m^2，并通过人每日40mg的剂量加以计算的。动物给药的剂量范围：大鼠为1～15mg/kg/天，家兔高达40mg/kg/天。

哺乳期妇女

尚不明确阿仑膦酸钠是否能够通过乳汁分泌。因为许多药物能够通过乳汁分泌，因此哺乳期妇女慎用。

【儿童用药】本品不适用于儿童。

【老年用药】

在骨折干预研究（FIT）中，在阿仑膦酸钠治疗组，年龄≥65岁的患者占71%（n=2302），年龄≥75岁的患者占17%（n=550）。在美国和多国女性骨质疏松症治疗研究、男性骨质疏松症治疗研究中、糖皮质激素性骨质疏松研究和Paget病研究中，接受阿仑膦酸钠治疗的患者中65岁及以上群体分别占45%、54%、37%、和70%。这些患者与65岁以下患者相比，有效性和安全性总体而言没有差异，但并不能排除某些老年个体更加敏感。

【药物相互作用】

钙补充剂/抗酸药物

如果同时服用钙补充制剂、抗酸药物和或含多价阳离子的口服药物可能会干扰阿仑膦酸钠吸收。因此，患者在服用本品以后，必须等待至少半小时后，才可服用其它药物。

阿司匹林

在临床研究中，同时接受日剂量高于10mg的阿仑膦酸钠和含阿司匹林药物治疗的患者，上消化道不良事件发生率增加。

非甾体类抗炎药（NSAIDs）

正在服用非甾体抗炎药的患者可同时服用阿仑膦酸钠。在一项为期3年的对照临床研究中（n=2027），大多数患者治疗期间同时服用非甾体抗炎药，每天服用阿仑膦酸钠5mg或10mg的患者上消化道不良事件发生率与那些服用安慰剂的患者相似。由于非甾体类抗炎药会引起胃肠道刺激，当与阿仑膦酸钠同时使用时应该慎重。

【药物过量】

雌性大鼠和小鼠单次口饲给予阿仑膦酸钠552mg/kg（$3256mg/m^2$）和966mg/kg （$2898mg/m^2$）后出现显著致死率。这些值在雄性中稍高，分别为626 mg/kg和1280mg/kg。犬口饲剂量高达200mg/kg（$4000mg/m^2$）时未出现死亡。

在治疗阿仑膦酸钠过量方面没有特别的信息可供参考。口服药物过量可能会导致低钙血症、低磷血症和上消化道不良事件，如胃部不适、胃灼热、食管炎、胃炎或溃疡。应给予牛奶或抗酸药物以中和阿仑膦酸。由于本品存在对食管刺激的风险，因此应避免诱导呕吐，患者应保持完全直立状态。

透析治疗并不利于阿仑膦酸钠的消除。

【临床药理】作用机制参见【药理毒理】相关内容。

药代动力学

据国外文献报道

吸收：

相对于静脉参考剂量，阿仑膦酸钠女性的平均口服生物利用度为0.64%，剂量范围为5-70mg，在一夜禁食后和标准早餐前两小时给药。男性口服10mg片剂的生物利用度(0.59%)与女性在禁食一夜后和早餐前2小时服用时相似。

70mg阿仑膦酸钠口服溶液和70mg阿仑膦酸钠片剂具有同样的生物利用度。

一项关于进餐时间对阿仑膦酸钠生物利用度影响的研究在49名绝经后妇女中进行。与吃早饭前2小时给药相比，在标准化早餐前0.5小时或1小时给药10mg阿仑膦酸钠时，生物利用度降低（约40%）。在治疗和预防骨质疏松症的研究中，阿仑膦酸钠在早餐前至少30分钟服用是有效的。

无论阿仑膦酸钠是与标准早餐同时服用还是在早餐后2小时服用，其对生物利用度的影响都可以忽略不计。与咖啡或橙汁同时服用阿仑膦酸钠可降低约60%的生物利用度。

分布：

临床前研究表明，静脉给予大鼠阿仑膦酸钠1mg/kg 后，其瞬间分布于软组织，但接着迅速再分布于骨组织或通过尿排泄。其在人体内的平均稳态分布容积，除了骨组织外至少为28L。口服给予治疗剂量的阿仑膦酸钠由于其在血浆内的浓度过低，难以进行检验分析（小于5ng/ml）。其血浆蛋白结合率约为78%。

代谢：

没有证据表明阿仑膦酸钠在动物或人体内存在代谢过程。

排泄：

单次静脉注射[^{14}C]阿仑膦酸钠后，72小时内约有50%的放射性物质从尿液中排出，而粪便中几乎没有放射性物质。单次静脉给药10mg后，阿仑膦酸钠的肾脏清除率为71mL/min(64，78；90%置信区间[CI])，全身清除率不超过200mL/min。静脉注射后6小时内血浆浓度下降95%以上。据估计，其在人体内的终末半衰期超过10年，表明阿仑膦酸钠会从骨骼中释放。基于上述推测在口服阿仑膦酸钠10年（每天10mg）后，每天从骨骼释放的阿仑膦酸钠量约为从胃肠道吸收的25%。

【药理毒理】

药理作用

阿仑膦酸钠在细胞水平，对骨吸收部位特别是破骨细胞作用的部位有亲嗜性。正常情况下，破骨细胞粘附于骨表面但边缘并不粗糙，而粗糙的边缘则是骨吸收活跃的标志。阿仑膦酸钠不影响破骨细胞的聚集或粘附，但它能抑制破骨细胞的活性。小鼠体内进行的[^{3}H]阿仑膦酸钠在骨内作用部位的研究显示，破骨细胞表面的摄入是成骨细胞表面的10倍。[^{3}H]阿仑膦酸钠分别给予大鼠6天和小鼠49天后，检查其骨组织发现，正常骨形成于阿仑膦酸钠表面，后者与基质结合后不再具有药理活性，因此，阿仑膦酸钠必须持续服用以抑制新形成的位于吸收表面的破骨细胞。狒狒和大鼠的组织形态测量学显示，阿仑膦酸钠能降低骨转换（即骨重建部位的数量），在骨重建部位，骨形成超过骨吸收，从而使骨量逐渐增加。

毒理研究

重复给药毒性

大鼠和犬分别进行的长达一年和三年的毒性研究发现，阿仑膦酸钠的相关变化有以下几个方面：在内源性软骨骨形成区保留了最初的松质骨，碱性磷酸酶活性持续下降，血钙和血磷的浓度一过性下降。这些都与阿仑膦酸钠预期的药理活性相关。对肾毒性最敏感的物种（如犬）出现肾毒性的剂量相当于人类至少应用100mg。大鼠需要更高的剂量才表现出这种肾毒性。胃肠毒性只出现在啮齿动物。这可能是由于对黏膜的直接作用，且仅发生在剂量超过2.5mg/kg/天时。

遗传毒性

无论有无代谢活性，体外微生物致突变试验未发现阿仑膦酸钠有致突变作用。体外哺乳细胞致突变试验、体外大鼠肝细胞碱性洗脱试验、以及小鼠静脉给予阿仑膦酸钠25mg/kg/天（$75mg/m^2$）体内染色体畸变试验也未发现其有致突变作用。但在中国仓鼠卵巢细胞的体外染色体畸变试验发现：阿仑膦酸钠浓度大于5mM时有弱细胞毒作用，这对人类来说无相关性，因为体内的治疗剂量不可能达到同样浓度。而且，五项基因毒性研究中有四项都是纯阴性结果，包括与人类致癌可能性最直接相关的研究（体内染色体畸变试验和微生物致突变试验），以及大鼠和小鼠体内的致癌研究阴性结果均表明阿仑膦酸钠对人类没有基因毒性或致癌的危险。

生殖毒性

大鼠经口给予阿仑膦酸钠5mg/kg/天对雌雄动物的生育和繁殖能力没有影响。研究中发现的唯一与药物相关的影响是大鼠分娩困难，这与药物介导的低钙血症直接相关，这种影响可通过给大鼠补充钙来预防。1.25mg/kg/天的剂量对生育和繁殖能力没有影响。

大鼠经口给予阿仑膦酸钠25mg/kg/天和兔给予35mg/kg/天，未发现对生长发育的影响。

致癌性

大鼠经口给予大鼠阿仑膦酸钠3.75mg/kg/天105周，及小鼠经口给予阿仑膦酸钠10mg/kg/天观察92周，均未发现有致癌作用。

【贮　藏】密封，不超过30℃保存，不得冷冻。请将本品放在儿童不能接触的地方。

【包　装】口服液体药用高密度聚乙烯瓶、药用聚烯烃瓶盖包装，75ml/瓶，1瓶/盒。

【有效期】24个月。

【执行标准】国家药品监督管理局药品注册标准编号YBH26712025

【批准文号】国药准字H20255791

【上市许可持有人】

名　　称：山东新华制药股份有限公司
注册地址：山东省淄博市高新区鲁泰大道1号
邮政编码：255000
电话号码：0533-2166666
传真号码：0533-2184991
网　　址：www.xhzy.com

【生产企业】

企业名称：山东新华制药股份有限公司
生产地址：山东省淄博市高新区兰雁大道3号
邮政编码：255000
电话号码：0533-2196361
传真号码：0533-2196365
网　　址：www.xhzy.com

301XY097071B

品名规格	阿仑膦酸钠口服溶液说明书	改版项目	说明书	签字及日期	马建华 2026.09.10
包装材质		版本号	301XY097071B		
成品尺寸	160mm × 180mm	印刷颜色	（印刷与提供色样有偏差，以最后印刷稿为准。）		
修订日期		字体			
设计稿	淄博新升印刷有限公司				