

核准日期:

眼内注射用曲安奈德说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称: 眼内注射用曲安奈德

英文名称: Triamcinolone Acetonide for Ophthalmic Injection

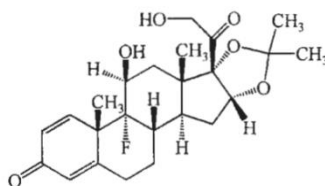
汉语拼音: Yannei Zhusheyong Qu'annaide

【成份】

本品活性成份为曲安奈德。

化学名称: 9-氟-11 β , 21-二羟基-16 α , 17[(1-甲基亚乙基)双(氧)]-孕甾-1, 4-二烯-3, 20-二酮

化学结构式:



分子式: $C_{24}H_{31}FO_6$

分子量: 434.50

【性状】

本品为白色结晶性粉末。

【适应症】

玻璃体手术时的玻璃体可视化。

【规格】

40mg

【用法用量】

玻璃体内注射给药。通常向 1 瓶本品中注入 4mL 生理盐水或眼内冲洗灌注液, 配置成浓度为 10mg/mL 的混悬液。使用前需混悬, 向玻璃体内注射曲安奈德 0.5~4mg (相当于混悬液 0.05~0.4mL)。同时, 可根据手术方式、患者的状态等适当调整混悬液中曲安奈德的浓度, 但不应超过 40mg/mL。

【不良反应】

在中国进行的以玻璃体手术患者为对象的临床试验中,在总病例 93 例中有 25 例(26.9%)发生了不良反应,所有的不良反应均发生在眼部,且均为 1 级到 2 级。不良反应发生率如下表所示。

发生率	5%以上	5%以下
眼部	眼内压增高 (24.7%)	眼内压降低、虹膜睫状体炎、角膜水肿、青光眼 (均为 1.1%)

在日本进行的以玻璃体手术患者为对象的临床试验中,在总病例 32 例中有 2 例(6.3%)发生了不良反应,分别为眼内压增高 1 例 (3.1%) 及操作性低血压 1 例 (3.1%)。不良反应及发生率如下表所示。

发生率	低于 5%
眼部	眼内压增高
其他	操作性低血压

文献显示,目标疾病的手术操作复杂程度越高,引起眼内压增高的风险越大。中国和日本开展单臂临床试验所纳入的受试者的目标疾病的手术操作复杂程度所占比例不同,中国临床试验中手术操作复杂的患者占比较高(中国 72.0% vs 日本 34.4%),导致眼内压增高发生率有所差异。

【禁忌】

1. 对本品活性成分有过敏反应者禁用。
2. 控制不佳的青光眼患者禁用[有症状恶化的可能]。

【注意事项】

1.慎重给药（对下述患者请慎重给药）

- (1) 青光眼-高眼压症患者：有可能造成眼压升高。
- (2) 白内障患者：有可能造成白内障恶化。
- (3) 眼部或眼部周围有感染的患者、或疑似感染的患者：有可能造成感染恶化。

2.重要的基本注意事项

- (1) 请仅由具有充分的视网膜疾病相关知识、具有玻璃体手术或玻璃体内注射相关知识和经验的眼科医生使用本品。
- (2) 由于有发生玻璃体炎症的可能,在本品给药后,应进行充分观察。此外,嘱咐患者在发现异常时及时联系医生。

(3) 玻璃体切除后，应通过灌流及吸引的方式除去本品。

本品残存于眼内时，应定期观察直至确认本品消失。玻璃体切除后本品残存于眼内时，曾有报告称有发生无菌性玻璃体炎症的病例。

(4) 由于有眼内压增高的情况发生，在本品给药后，应密切关注患者眼压情况。

(5) 由于有发生白内障等的可能，因此在使用本品后，应密切关注患者情况。此外，嘱咐患者在发现异常时及时联系医生。

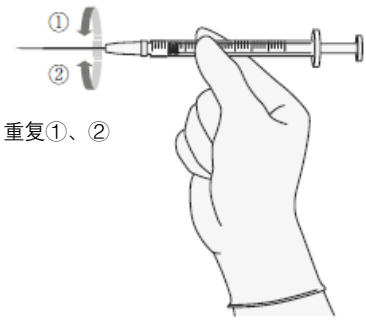
3.使用上的注意事项

(1) 由于本品不含有防腐剂，因此请在使用前配制，配制后立即使用。

(2) 请勿将同一瓶药品用于多个患者。同时，请将未使用的残余药品丢弃。

(3) 取 1 瓶本品加入不少于 1mL（曲安奈德浓度为 10mg/mL 时，加入 4mL）的生理盐水或眼内冲洗灌注液，剧烈振荡 10 秒钟，形成均匀的混悬液后，吸取所需用量。

(4) 给药之前，将注射器按照如图所示方式转动 10 秒钟（再次混悬）后注射至玻璃体内。



【孕妇及哺乳期妇女用药】

在动物实验（小鼠、大鼠、猴）中有致畸作用的报告，同时具有引起新生儿畸形、降低出生儿体重、副肾上腺功能衰竭的可能。对于孕妇或育龄期女性，须谨慎评估风险获益，只有在治疗的获益大于风险的情况下才能给药，并告知怀孕妇女本品对胎儿的潜在风险。

【儿童用药】

尚未确立本品在儿童中的安全性（无使用经验）。

【老年用药】

通常老年人的生理机能减退，需要注意。

【药物相互作用】

与以下药品合并用药时需注意

药品	临床症状-处置措施	机制-危险因素
口服糖尿病用药品	有报告称会使该类药品（片剂	本品在肝脏促进糖异生，在

如乙酰苯磺酰环己脲等 胰岛素制剂	和注射剂)的效果减弱,合并用药时应密切关注患者的状态。	外周组织中抑制糖的利用。
----------------------------	-----------------------------	--------------

【药物过量】

未进行该项实验且无可靠参考文献。

【临床药理】

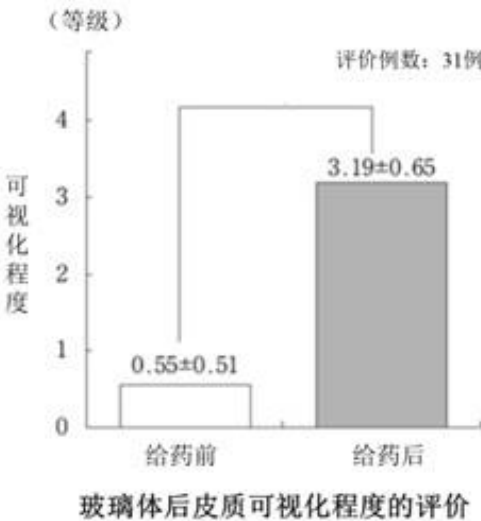
药代动力学

血浆中浓度

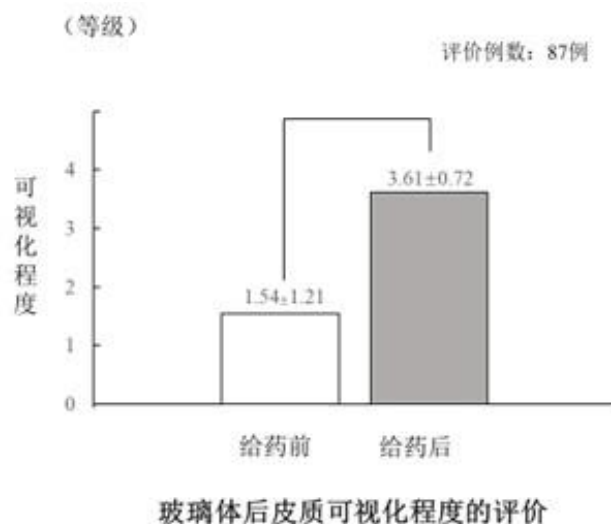
32 例接受玻璃体手术的日本患者,玻璃体内注入本品 0.5~3.8mg,在玻璃体手术时尽可能除去,给药后 4 小时血浆中曲安奈德浓度(平均值)为 0.062ng/mL,给药后(术后)7 天时低于定量下限(0.020ng/mL)。

【临床试验】

(1) 在以接受玻璃体手术的 32 例日本患者为对象进行的Ⅲ期临床试验中,玻璃体手术时给药本品 0.5~3.8mg,对给药前后的可视化程度[分为 5 个等级(0~4 级)]进行评价,结果显示,给药前后玻璃体可视化程度具有显著的统计学差异($p<0.0001$)。



(2) 在以接受玻璃体手术的 93 例中国患者为对象进行的Ⅲ期临床试验中,玻璃体手术时给药本品 0.5~4.0mg,对给药前后的可视化程度[分为 5 个等级(0~4 级)]进行评价,结果显示,给药前后玻璃体可视化程度具有显著的统计学差异($p<0.025$)。



【药理毒理】

药理作用

玻璃体内注射曲安奈德后，白色的曲安奈德颗粒可附着于玻璃体后皮质，从而增加玻璃体可视化程度。

毒理研究

遗传毒性

曲安奈德的 Ames 试验和中国仓鼠卵巢细胞染色体畸变试验结果为阴性，小鼠体内微核试验结果为阳性。

生殖毒性

在雄性和雌性大鼠中，曲安奈德经口给药剂量高达 0.015 mg/kg 对妊娠率未见影响，0.005 mg/kg 剂量下可见胎仔吸收增加和死产，幼鼠体重和存活率下降。

大鼠和兔吸入曲安奈德 ≥ 0.02 mg/kg 剂量下可见剂量相关性的致畸作用，表现为腭裂，和/或脑积水、中轴骨缺损。猴吸入曲安奈德 0.5 mg/kg 剂量下可见颅骨畸形的致畸作用。上述致畸性作用与其它糖皮质激素相似。

致癌性

在小鼠两年致癌性试验中，曲安奈德经口给药剂量高达 0.003 mg/kg 时，未见给药相关的致癌性。在大鼠两年致癌性试验中，曲安奈德经口给药剂量高达 0.001mg/kg 时，未见给药相关的致癌性。

【贮藏】

密闭，不超过 25℃ 保存。

【包装】

中硼硅玻璃管制注射剂瓶、注射制剂用氯化丁基橡胶塞。1 瓶/盒。

【有效期】

36 个月

【执行标准】

JX20250092

【批准文号】

【上市许可持有人】

名称：WAKAMOTO PHARMACEUTICAL CO., LTD.

注册地址：2-2-2, Nihonbashi, Honcho, Chuo-ku, Tokyo, Japan

邮政编码：103-8330

联系电话：+81-3-3279-0364

【生产企业】

企业名称：永信药品工业股份有限公司台中幼狮厂

生产地址：中国台湾台中市大甲区日南里工九路27号

邮政编码：43769

联系电话：+886-4-26815181

【境内联系人】

名称：深圳市罗素医药有限公司

地址：深圳市福田区梅林街道中康路卓越梅林中心广场一期2号楼1A01室

邮政编码：518049

联系电话：0755-82405467