

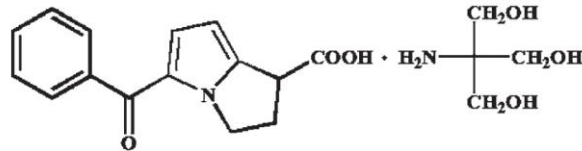
舒腫 眼藥水0.5%

Kelac Ophthalmic Solution 0.5%

衛署藥製字第046223號

【性狀】

本品屬於眼用非類固醇消炎藥(NSAID)之pyrrolo-pyryole族中之一員，化學名為(±)-5-benzoyl-2,3-dihydro-1H-pyrrolizine-1-carboxylic acid與 2-amino-2-(hydroxymethyl)-1,3-propanediol(1,1)之化合物，結構式如下：



本品係呈無菌等張0.5%水溶液，R-(+)與S(-)-Ketorolac tromethamine之外消旋混合物，Ketorolac tromethamine係以三種晶體形式存在，各形式皆同樣可溶於水。Ketorolac之pKa=3.5，白色至灰白色結晶物質於長期曝光時變色。

【成份】

本劑1mL中含有下列之成分：

Ketorolac tromethamine..... 5mg

賦形劑：Benzalkonium Chloride, EDTA-2Na, Polysorbate 80, Sodium Chloride, Sodium Hydroxide, Distilled Water.

【適應症】

暫時緩解由季節性過敏性結膜炎引發之眼部搔癢，白內障手術後之眼部發炎。

【用法用量】

本藥須由醫師處方使用

本品建議劑量為每日四次，每次一滴(0.25mg)用於緩解因季節性過敏性結膜炎引發之眼部搔癢。

用於治療接受白內障摘除術病人之術後發炎或炎性反應，於白內障手術後24小時開始，於患部眼睛滴注，每日四次，每次一滴，並持續直到手術後2週。

開瓶注意事項：產品於開啟使用前，先以順時針方向往下旋緊一圈後再逆時針旋轉開瓶使用，以利藥液滴出。

於保管時，若容器的前端和蓋子出現結晶，請以乾淨的紗布擦拭後使用。

【臨床藥理】

本品乃非類固醇消炎藥，全身性投藥時具有止痛、消炎及解熱活性，其作用機轉相信部份係來自其可抑制前列腺素(Prostaglandin)之生物合成。Ketorolac tromethamine於全身性投藥時不會造成瞳孔收縮；許多動物模式研究中顯示前列腺素乃多種眼內發炎之媒介物質，於動物眼部進行研究，前列腺素可造成血液-眼水障壁破裂、血管擴張、血管滲透度增高、白血球增多及眼內壓升高，前列腺素顯然於眼部手術時經由膽鹼激性機轉(Cholinergic mechanisms)無關方式縮窄虹膜括約肌而縮瞳反應扮演某種角色。

兩滴(0.1mL)舒腫眼藥水0.5%於摘除白內障前12小時及1小時滴入病人眼部，9位病人眼部中有8位達到可測量的程度(平均Ketorolac濃度95ng/mL眼水，40至170ng/mL範圍)，眼部投予本品可降低眼水之前列腺素E2(PGE2)濃度，接受媒劑之眼球之眼水中平均PGE2濃度為80pg/mL，而接受舒腫眼藥水0.5%之眼球為28pg/mL。

一滴(0.05mL)舒腫眼藥水0.5%滴入26正常個體之一眼，而點一滴媒劑於另一隻眼，每日三次，於局部眼部治療期間於第10日，26人中僅5人血漿含有可檢測量之Ketorolac(10.7至22.5ng/mL之範圍)；當Ketorolac tromethamine 10mg每6小時全身性投藥時，穩定狀態的峰值血漿濃度約為960ng/mL。兩次對照臨床研究顯示本品用於緩解因季節性過敏性結膜炎引發之眼部搔癢，顯然比媒劑更有效。兩次對照臨床研究顯示使用舒腫眼藥水治療兩週的病人，比使用媒劑處理病人，更少有可測量之發炎徵象(細胞及發紅)。臨床研究結果指出本品對眼內壓不會造成顯著影響，但白內障手術後可能出現眼內壓的變化。本品可與其他眼科藥併用而無安全上的考量，如抗生素、貝它遮斷劑(β -blockers)、碳酸脫水酵素抑制劑、睫狀肌麻痺劑及散瞳劑。

【動物藥理】

Ketorolac tromethamine可防止兔局部施用花生四烯酸出現眼內壓升高。於試管試驗中不會抑制兔水晶體之醛醣還原酵素。本品不會促成Candida albicans、herpes simplex病毒一型或Pseudomonas aeruginosa於兔誘發眼部感染的傳播。

【禁忌】

禁用於對配方中之任一成分過敏病人。

【警告】

1. 與乙酰基水楊酸(acetylsalicylic acid)、苯基乙酸衍生物(phenylacetic acid derivatives)及其它非類固醇消炎劑可能產生交叉過敏，因此用於治療過去對此等藥物過敏病人時須特別審慎。
2. 某些非類固醇消炎藥由於干擾血小板凝結而可能延長出血時間，曾有報告於眼科手術時眼部施用非類固醇消炎藥引起眼部組織出血(包括眼前房出血)。

【注意事項】

1. 有出血傾向或接受其它可能延長出血時間藥物病人時應審慎。戴隱形眼鏡者禁用。
2. 致癌性、致突變性及危害生育力：
小鼠以口服相當於腸外MRHD(人類最高推薦劑量)劑量之Ketorolac tromethamine維持18個月的研究及大鼠口服外MRHD 2.5倍劑量為期24個月研究，皆未顯示引發腫瘤。
Ames試驗、未經規劃之DNA合成與修復及前瞻性突變檢定分析中，Ketorolac tromethamine不會引發突變；於試管試驗小鼠微核檢定分析中不會造成染色體斷裂；於1590µg/mL(約為平均人類血漿濃度之1000倍)及更高濃度時Ketorolac tromethamine可能提高中國倉鼠卵巢細胞之染色體畸形分裂之發生率。雄性或雌性大鼠分別口服9mg/kg及16mg/kg劑量，並未危害生育力。
3. 用於孕婦：致畸胎效應：懷孕類別C：
對兔使用3.5mg/kg每日口服劑量及大鼠使用10mg/kg於器官發生期間進行生殖研究，研究結果並未造成胎兒畸形，Ketorolac tromethamine口服劑量1.5mg/kg，乃人類口服劑量之半，於大鼠妊娠17日後投藥引發難產及死亡率增高；並無用於孕婦之充分且經過徹底對照研究，故唯有於潛在效益超過對胚胎之潛在風險時方可用於孕婦。
非致畸胎效應：由於已知前列腺素抑制性藥物對胎兒心血管的影響(動脈導管閉合)，因此於懷孕末期禁忌使用本品。
4. 用於哺乳婦：本品投予哺乳婦時應審慎。
5. 用於小兒：用於12歲以下小兒科病人安全性及療效未確立。

【副作用】

對照臨床研究中最常報告的副作用為滴注時的暫時性針刺感與燒灼感，發生率約佔接受治療病人之40%；全部藥物開發研究中，其它的副作用包括：眼部刺激、過敏反應、眼部淺層感染及角膜表面發炎的發生率，皆低於5%治療時間。其它罕見副作用報告包括：眼睛乾燥、角膜浸潤、角膜潰瘍及視覺障礙(視力模糊)。

【儲存】

避免儲存於25°C以下。
置本品於孩童無法接觸之處。
開封一個月即丟棄不用。

【儲存】

100 mL以下塑膠瓶裝。



委託者：麥迪森醫藥股份有限公司

台北市中正區林森南路十號五樓

製造廠：麥迪森醫藥股份有限公司 桃園廠

桃園市桃園區桃鶯路445-2號

ASEPTIC INNOVATIVE MEDICINE CO.,LTD.

No.445-2, Taoying Rd, Taoyuan Dist, Taoyuan City 330, Taiwan (R.O.C.)