

注射用伏欣奇

说明书

【药品名称】

通用名称: 注射用伏欣奇

商品名称: 金蓓欣

英文名称: Firsekihart for Injection

汉语拼音: Zhushiyong Fuxingqibai Dankang

【成份】

国家药品监督管理局

【性状】

本品为白色或类白色粉末，加水后为无色或淡黄色溶液。

本品为白色或类白色粉末，加水后为无色或淡黄色溶液。

【适应症】

本品适用于对非甾体类抗炎药和/或秋水仙碱禁忌、不耐受或缺乏疗效的，
以及不能耐受非甾体类抗炎药或秋水仙碱的痛风性关节炎急性发作。

【规格】

200 mg/瓶。

【用法用量】

本品需要在有治疗经验的医生指导下用药。

推荐剂量和给药方法

推荐剂量为 200 mg，皮下注射。

药品配制

采用无菌操作，抽取 1.3 mL 注射用水缓慢注入药瓶中进行复溶。缓慢摇动药瓶约 5 分钟，静置约 5 分钟，重复摇动和静置的操作，直至药品完全溶解。

将药液转移至 1.3 mL 注射器中，抽取药液。复溶后的溶液应该无颗粒且不浑浊。药液转移至注射器后，应立即使用，如果不能立即使用，通常于 2~8°C 冷藏，并于 2 小时内使用。

给药

一次性使用药液转移器取出 1.3 mL 药液，然后换上注射针头进行皮下注射。

适合的注射部位：大腿上部、腹部、上臂或臀部。建议每次注射时选择不同的注射部位，以避免局部疼痛。应避免在皮肤有淤青或皮疹的区域注射。应避免注射入瘢痕组织，因为这可能会导致药物暴露量不足。

注射后应立即丢弃残留药液。应根据当地要求，指导患者或其护理人员按照适当程序处置药瓶、注射器和针头。

注射后应立即丢弃残留药液。应根据当地要求，指导患者或其护理人员按照适当程序处置药瓶、注射器和针头。

根据一项本品提供了 24 周的安全性数据仅支持单次给药。

特殊人群

肝功能不全

轻度肝功能不全的患者无需调整剂量。但是，关于此类患者的临床经验有限。

肾功能不全

轻度肾功能不全的患者无需调整剂量。但是，关于此类患者的临床经验有限。

【不良反应】

安全性特征总结

在 1 项 I 期研究（详见【临床试验】）和 3 项 II 期研究中评价了本品在痛风性关节炎患者中的安全性。共有 40 例痛风性关节炎患者接受了本品给药，其中 35 例患者接受了 200 mg 给药，5 例患者接受了 300 mg 给药。

接受本品 200 mg 治疗的患者中，最常报告的药物不良反应为高甘油三酯血症、高胆红素血症、丙氨酸氨基转移酶升高和天门冬氨酸氨基转移酶升高（详见表 1）。

表 1 在痛风性关节炎患者中开展的床试验中的不良反应（发生率≥2%）		
系统器官分类(SOC)	托舒单抗 200 mg (N=350) n(%)	复方倍他米松注射液 (N=186) n(%)
感染及侵染类疾病		
上呼吸道感染	7 (2.0)	7 (3.8)
代谢及营养类疾病		
高糖血症	94 (26.9)	30 (16.0)
胆固醇血症	高 14 (7.5)	30 (8.6)
高脂血症	11 (3.1)	9 (4.8)
肝胆系统疾病		
肝功能异常*	0	7 (2.0)
9 (4.8)		9 (4.8)
各类检查		
丙氨酸氨基转移酶升高	22 (6.3)	5 (2.7)
天门冬氨酸氨基转移酶升高	20 (5.7)	0
尿酸升高	8 (2.3)	3 (1.6)
红蛋白**	9 (2.6)	2 (1.1)
血肌酐升高	8 (2.3)	1 (0.5)
血甘油三酯升高	9 (2.6)	3 (1.6)

*包括：胆红素升高、胆红素升高、血非结合胆红素升高、高胆红素血症。

免疫原性

使用ELISA发光免疫分析法检测患者中的抗药抗体。在接受本品 50、200 mg

的痛风性关节炎患者中，观察到抗药抗体。在安慰剂组中，未观察到抗药抗体。在安慰剂组中，未观察到抗药抗体。

特定不良反应描述

实验室检查异常

甘油三酯升高

女性妊娠期间慎用或禁用本品（参见【孕妇及哺乳期妇女用药】以及【药理毒理】）。

（注意事项）

感染

使用本品会抑制白介素-1 β ，可能会增加感染或严重感染的发生风险。因此，一旦出现感染，应该严密监测其症状及体征。存在活动性感染、反复感染史或感染高风险因素的患者，应遵医嘱谨慎使用本品。

关于本品在结核患者中的安全性数据，目前尚不明确。

在开始治疗之前，建议根据临床实践对所有接受本品治疗的患者，进行活动性和潜伏性结核感染评估，必要时对患者进行适当的筛查（例如：PPD或T-SPOT或胸部影像学检查）。

所有患者在使用本品后，须严密监测持续性咳嗽、体重减轻、低热等症状或体征。

疫苗接种

使用本品时避免同时接种活疫苗或

灭活疫苗。关于疫苗接种的具体建议，请参考本品的说明书。

老年(≥65岁)和年轻患者之间未报告总体安全性或有效性差异,但老年患

者数据有限。

【药物相互作用】

本品未开展正式的药物间相互作用的研究。

体外试验数据表明,在2.00~200 $\mu\text{g/mL}$ 浓度范围内,本品能够调控白介素-1 β 对人原代肝细胞的CYP1A2、CYP2C9、CYP2C19、CYP2D6和CYP3A4的抑制作用。这对治疗指数窄、需进行个体化剂量调整的CYP450底物可能有临床相关性,使用这类药物治疗的患者在开始本品治疗时,应对其药效和/或药物浓度进行治疗监测,并进行个体化剂量调整。

【药物过量】

临床试验中未报告过药物过量病例。若出现药物过量,建议监测患者是否有任何不良反应的症状和体征,并采取适当的对症治疗。

【临床药理】

作用机制

参见【药理毒理】相关内容。

注射本品后,本品吸收缓慢,中位达峰时间 T_{max} 在141~166小时之间。在50~200 mg剂量范围内,本品的体内暴露量随着剂量的递增而增加,具有线性药代动力学趋势。

分布 本品分布呈现二室模型特征,在痛风性关节炎患者中平均表观分布容积在8.0~12.1L之间。群体药代动力学分析显示本品表观分布容积约为8.4L,

关节炎患者中平均清除率在9.228~11.501 mL/h 之间。群体药代动力学分析显示本品平均清除率约为10 mL/h 。

特殊人群

肾功能不全

用、坚持能不舍

其他特殊人群

遗传药理学

尚无关于本品遗传药理学相关的临床实验数据

在一项对非甾体类抗炎药和/或秋水仙碱治疗总不耐受或缺乏疗效的、反复急性痛风发作的患者(过去12个月中发作≥2次)进行的随机、双盲、安慰剂对照研究中,患者(总分12分)中,有12%的患者在服用秋水仙碱时,有不良反应。

多中心的 III 期临床研究中, 通过比较 6 周内 70 小时期羊羔的病情

(10) 将刺激输入至 VAS 装置并应用该装置进行刺激。

证实了本品治疗痛风性关节炎的有效性。

该研究分为 24 周的双盲治疗期和 24 周的开放治疗期。在双盲治疗期间,共

共有156例患者至少接受了一次200 mg本品皮下注射，156例患者至少接受了一次1 mL复方倍他米松注射液（其中1例患者给药后无任何疗效评价）。

患者既往急性痛风发作次数平均为 36.2 次, 超过 90% 的患者有伴随疾病, 包括

高脂血症 (43.1%)、高血压 (43.1%)、肝脂肪变性 (25.1%)、肾结石 (18.9%)

二、血尿酸(16.70%)、血脂异常(6.11%)、糖尿病(6.7%)、痛风(6.7%)、高尿酸血症(5.7%)患者在入组时有稳定的

分药后52h时梨茎干的病腐病与对照分较基线的变化

本品给药后72小时可显著改善痛夏方市市市市市市市市市市市市市市的疼痛水平，优于2倍他米松注射液（表2）。

表 2 给药后 72 小时靶关节的疼痛视觉模拟评分 (VAS) 较基线的变化^[1]

给药后 72 小时疼痛 VAS 均值 (SD)	
变化 [1]	给药后 72 小时疼痛 VAS 较基线的变化 (95% CI)
	组间差值 (95% CI)
	他米松注射液

人IL-1 β ，阻断其与IL-1 β 受体的相互作用，从而阻断IL-1 β 诱导的炎性介质产生。

毒理研究

遗传毒性

遗传毒性试验。本品未进行遗传毒性试验。本品未进行

生殖毒性

大鼠毒性

大鼠生育力与早期胚胎发育毒性试验中，雌鼠从交配前4周至交配结束，雌鼠从交配前14天至妊娠第7天，每周1次皮下注射本品20、60、200 mg/kg以AUC计，暴露量分别相当于人最大临床推荐剂量200 mg的1.63、3.90、8.96倍（雄性）和6.32、15.23、23.87倍（雌性）。雌雄大鼠生育力、产仔数和产仔重均未见明显影响。

大鼠胚胎-胎仔发育毒性试验中，鼠于妊娠第6天至第13天每周1次皮下注射本品20、40、120 mg/kg（以AUC计，暴露量分别相当于人最大临床推荐剂量200 mg的1.63、3.90、8.96倍），120 mg/kg剂量下对母体动物具有肝脏毒性（可致死死亡）、对发育的NOAEL分别为40 mg/kg和120 mg/kg。

兔胚胎-胎仔发育毒性试验中，兔于妊娠第6天至第18天每周1次皮下注射本品20、40、120 mg/kg（以AUC计，暴露量分别相当于人最大临床推荐剂量200 mg的1.63、3.90、8.96倍），120 mg/kg剂量下对母体动物具有肝脏毒性（可致死死亡）、对发育的NOAEL分别为40 mg/kg和120 mg/kg。

分率升高。对母体动物和胚胎-胎仔发育的NOAEL为40 mg/kg。大鼠围产期发育毒性试验中，大鼠于妊娠第6天至哺乳期第21天每周1次皮下注射本品20、40、120 mg/kg（以AUC计，暴露量分别相当于人最大临床推荐剂量200 mg的1.63、3.90、8.96倍），120 mg/kg剂量下对母体动物具有肝脏毒性（可致死死亡）、F₁代门齿萌出和空中翻正达标日龄延迟。对母体动物和F₁代动物的NOAEL为40 mg/kg。

致癌性

本品未进行致癌性试验。

【贮藏】

于2~8℃避光保存和运输。

【包装】

直接接触药品的包装材料：中硼硅玻璃管制注射剂瓶、冷冻干燥用溴化丁基橡胶塞。

【有效期】

18个月。

【批准文号】

【上市许可持有人】

名称：长春金赛药业有限责任公司

注册地址：长春高新开发区黄河街72号

邮政编码：130012

电话：0431-820-0469 手机：139-431-0469

手机拨打：400-820-0469

【生产企业】

公司

注册地址：长春高新开发区黄河街72号

电话拨打：800-820-0469

400-820-0469

手机拨打：

网址：<http://www.gensei-china.com> 网址：<http://www.gensei-china.com>