

## 愛爾康衛目明點眼液 0.2 %

Brimonidine Tartrate Ophthalmic Solution 0.2%

衛署藥輸字第 024211 號

本藥須由醫師處方使用

### 【成分】

每毫升含有有效成分 Brimonidine tartrate 2 mg

保存劑：Benzalkonium chloride

其他成分：Polyvinyl alcohol、sodium chloride、sodium citrate dihydrate、citric acid monohydrate、hydrochloric acid 或 sodium hydroxide (調整 pH 值) 和 purified water。

### 【臨床藥理學】

本品乃相對上具有選擇性之  $\alpha$ -2 腎上腺激性作用劑 ( $\alpha$ -2 adrenergic agonist)，給藥後兩小時出現尖峰降眼壓效果，於動物體及人體進行螢光光譜研究顯示 brimonidine tartrate 藉由減少眼房水產量與增加葡萄膜鞏膜流出量，具有雙重作用機轉。

眼部投予 0.2% 眼藥水後，1 至 4 小時後達到血漿濃度峰值，隨後下降，全身性半衰期約 3 小時。

於人體 brimonidine 全身性之代謝作用完全，主要係由肝臟代謝，藥物及其代謝產物之主要清除路徑係由尿液排出，約 87% 經口服投藥之放射性劑量於 120 小時內清除，而其中 74% 出現於尿液。

眼內壓 (Intraocular Pressure, IOP) 升高為青光眼視野喪失之一大風險因子，IOP 越高則視神經受損及視野喪失可能性越高，本品可降低眼內壓而對心血管及肺臟功能極少造成影響。

在為期長達一年與 timolol 0.5 % 相比較的臨床試驗中，相較於 timolol 約 6 mmHg 之 IOP 降低效果，本品可降低約 4-6 mmHg 之 IOP。有 8% 的參與本試驗之病患由於眼內壓控制不當而停止繼續研究，其中 30% 係發生於治療的第一個月，約 20% 因副作用而停止繼續研究。

### 【適應症】

開放角隅青光眼或高眼壓。

說明：適用於患有開放角隅青光眼或高眼壓病人降低眼內壓，用於某些病人，本品之 IOP 降低效果隨著時間而消失，此種喪失效果的開始時間因人而異，故須密切監視。

### 【禁忌症】

禁用於對 brimonidine tartrate 或本品之任一種成分過敏病人，也禁用於接受單胺氧化酵素

(monoamine oxidase, MAO) 抑制劑治療病人。

### 【注意事項】

#### 一般方面：

- 雖然本品於臨床研究中對病人血壓及心率影響極小，但本品用於治療患有嚴重心血管疾病病人時應審慎。
- 本品未曾用於肝或腎機能受損病人進行研究，用於治療此等病人應審慎。
- 本品應小心用於患有抑鬱、腦部或冠狀機能不全、雷諾氏症候群 (Raynaud's phenomenon)、姿勢性低血壓 (orthostatic hypotension) 或血栓閉鎖性血管炎 (thromboangitis obliterans) 等病人。
- 研究期間，有些病人的效果喪失，使用本品治療第一個月觀察得的 IOP 降低效果不一定能反映出長期 IOP 降低程度；對於每日投藥兩次無法適當控制 IOP 的病人，必須於下午再加滴一滴 brimonidine，使用降低眼內壓藥物的病人必須經常性監視其 IOP 的變化。
- 病人資訊：  
本品的保存劑 benzalkonium chloride 可能被軟式隱形眼鏡吸收，配戴軟式隱形眼鏡病人須指導他們於滴注本品後，至少須等候 15 分鐘才能配戴隱形眼鏡。  
如同此類型的其它藥物般，本品可能於某些病人造成疲憊及(或)嗜睡，從事危險性活動病人須注意警覺性降低的可能。

#### 【藥物交互作用】

雖然未曾使用本品進行特定藥物交互作用研究，但須考慮與中樞神經系統抑制劑 (酒精、巴比妥酸鹽、鴉片劑、鎮定劑或麻醉劑) 產生加成作用增強效果的可能，本品於臨床研究對脈搏及血壓不會造成顯著影響，但因  $\alpha$ -促效劑類別藥物可能降低脈搏及血壓，故建議合併使用乙型遮斷劑  $\beta$ -blockers (眼用及全身性使用)、抗高血壓劑及/或強心配糖體 (cardiac glycosides) 等藥物時應審慎。據報告三環抗抑鬱劑會減弱全身性 clonidine 之降血壓效果，但未知合併使用此等藥劑與本品是否導致干擾 IOP 降低效果；目前並無有關滴注本品後的血循環兒茶酚胺 (catecholamines) 濃度資料，但建議使用三環抗抑鬱劑病人應審慎，原因是該種藥物可能影響循環性胺類 (amines) 代謝及攝取。

致癌性、致突變性、危害生育力：

於小鼠及大鼠之為期 21 個月及 2 年研究期間，分別

口服投予 25 毫克/公斤/每日 (以游離基計) 及 10 毫克/公斤/每日 (分別高達使用推薦眼用劑量後人類血漿藥物濃度之 77 倍及 118 倍)，並未觀察得化合物相關之致癌作用。

本品於一系列試管試驗及活體研究，包括 Ames 試驗，寄主媒介檢定分析 (host-mediated assay)，中國倉鼠卵巢 (CHO) 細胞之染色體畸型分析 (chromosomal aberration assay)，小鼠細胞遺傳學研究及致死量檢定分析 (lethal assay) 中，不具有突變發生作用或細胞再生作用。

用於孕婦：

大鼠使用口服劑量 0.66 mg 游離基/kg 進行生殖研究，並未危害生育力或對胚胎造成傷害，此種劑量為可產生人類使用多劑眼用劑量後血漿藥物濃度的百倍。並無任何本品用於孕婦之研究。但動物研究中 brimonidine 會穿過胎盤進入胎兒血循環至一定相當程度。除非對母體可能的效益超過對胚胎潛在的風險時才可用於孕婦。

用於哺乳婦：

未知本品是否分泌於人類乳汁，但動物研究中 brimonidine tartrate 顯然分泌於乳汁，故須考慮藥物對母體的重要性，決定是否停止哺乳或停止用藥。

用於小兒：

用於小兒科之安全性及效果尚未確立。此外，心跳減慢、低血壓、體溫降低、肌張力減弱及呼吸弛緩等症候，也曾罕見於投與 brimonidine 的新生兒。

#### 【副作用】

發生率約 10-30% 的副作用，以發生率遞減順序表示，包括：口乾、眼部充血、燒灼感及針刺感、頭痛、視力模糊、異物感、疲勞、嗜睡、結膜濾泡、眼部過敏反應及眼部搔癢。

發生率約 3-9% 的副作用，以遞減順序表示，包括：角膜染色/糜爛、畏光、眼皮紅斑、眼痛、眼乾、流淚、上呼吸道症狀、眼皮水腫、結膜水腫、頭暈、眼瞼炎、眼部刺激、胃腸道症狀、虛弱無力、結膜變白、視力異常及肌肉痛。

下列副作用發生率低於 3%：眼皮結痂、結膜出血、味覺異常、失眠、結膜分泌物、抑鬱、高血壓、焦慮不安、心悸、鼻乾及昏厥。

#### 【上市後不良反應】

使用本品之上市後不良反應為自願性通知，因此，人數多寡及發生頻率為未知。

眼睛疾病：虹膜炎、虹膜睫狀體炎 (前葡萄膜炎)、

縮瞳症、結膜炎、眼瞼搔癢。

免疫系統異常：過敏、皮膚疾病 (包括紅斑、臉部水腫、皮膚搔癢、皮疹、血管擴張)。

心臟疾病：心悸、心律不整 (包括心跳過緩或過速)。

精神疾病：抑鬱。

血管疾病：低血壓、昏厥。

#### 【過量】

並無有關人類用藥過量的資訊，口服用藥過量之處理，包括支持性及症狀性治療，須維持病人呼吸道的暢通。

#### 【用法用量】

推薦劑量為每日兩次，每次滴注一滴愛爾康衛目明點眼液於患部；對於下午達到 IOP 峰值或需要額外控制 IOP 病人，可於下午增加一滴劑量。

#### 【包裝】

100 毫升以下無菌塑膠滴瓶。

#### 【儲存】

25°C 以下儲存，限處方調劑，置於兒童不能及之處。

**Alcon** A Novartis Division

製造廠：Alcon Research Ltd.

廠址：6201 South Freeway, Fort Worth, Texas 76134, USA

藥商：瑞士商愛爾康大藥廠股份有限公司台灣分公司

地址：台北市中正區仁愛路二段 99 號 11 樓