艾弗目®P無菌眼用液劑0.15%

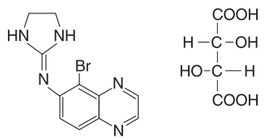
ALPHAGAN® P Ophthalmic Solution 0.15%

衛署藥輸字第023695號

性狀

ALPHAGAN® P 0.15%無菌眼用液劑0.15%，為供眼用，具有相對選擇性的α-2腎上腺激素促進作用劑。本品的化學名為5-bromo-6-(2-imidazolidinylideneamino) quinoxaline L-tartrate，呈灰白至灰黃粉末，酒石酸鹽的分子量為442.24，可溶於水(1.5 mg/mL)，也可溶解於pH 7.2的本品媒液(3.0 mg/mL)中。

結構式：



化學式：$C_{11}H_{10}BrN_5C_4H_6O_6$

於溶液中，本藥呈澄清綠黃色，滲透壓為250-350 mOsmol/kg，pH值介於6.6至7.4。

本藥每mL含有：

活性成分：brimonidine tartrate 15%(1.5 mg/mL)

保存劑：PURITE 0.005% (0.05 mg/mL)

其他賦形劑: sodium carboxymethylcellulose, boric acid, sodium borate decahydrate, sodium chloride, potassium chloride, calcium chloride dihydrate, magnesium chloride hexahydrate, hydrochloric acid or sodium hydroxide, purified water.

臨床藥理

作用機轉：

本藥是一種α腎上腺激素作用促進劑，給藥後兩小時出現降眼壓效果的峰值。於動物和人體進行螢光光度計量研究(Fluorophotometric studies)顯示，本品經由減少水樣液的產生，並能增加葡萄膜鞏膜的流出液，來達到雙重的作用機轉。

藥物動力學：

眼內投予0.1%或0.2%的活性成分溶液後，於0.5至2.5小時內出現血漿濃度峰值後，血漿濃度以全身半衰期約兩小時的速度降低。本藥主要經由肝臟代謝，藥物和藥物代謝產物的主要排除路徑是經由尿路排泄，約87%的經口投與放射性標記劑量，於120小時以內被清除，而其中有74%出現於尿液中。

臨床評估：

眼內壓升高是造成青光眼性視野喪失的一大風險因子；眼內壓愈高，則視神經受損與視野喪失的可能性愈高。本品具有降低眼內壓效果，而極少對心血管和肺參數造成影響。

進行兩項臨床研究，評估ALPHAGAN® P 0.15%，相對於ALPHAGAN®，每日三次投與患有開放隅角性青光眼或高眼壓病人的安全性、有效性和接受程度，結果顯示ALPHAGAN® P 0.15%，具有可媲美ALPHAGAN®0.2%的眼內壓下降效果，可有效降低患有開放隅角性青光眼或高眼壓病人的眼內壓，約達2-5毫米汞柱。

適應症

開放角隅青光眼或高眼壓。

禁忌

ALPHAGAN® P禁忌用於對brimonidine tartrate或本藥任何成分過敏病人，也禁忌用於正在接受單胺氧化酶(MAO)抑制劑治療病人。

警語

一般方面：

雖然臨床研究顯示，ALPHAGAN® P極少對病人血壓造成影響，但用於治療患有重度心血管疾病病人時，仍應審慎。

尚未有ALPHAGAN® P用於肝或腎功能受損病人的研究，故用於此類病人時應審慎注意。

ALPHAGAN® P用於患有憂鬱症、腦血管或冠狀血管機能不全、雷氏症候群、姿態性低血壓、或血栓閉鎖性血管炎病人時應審慎。接受降眼內壓處方藥物的病人，應例行性地監測眼內壓。

病人資訊：

如同其它此類藥物般，ALPHAGAN® P可能在某些病人身上會引起倦怠感和(或)嗜睡，從事危險性活動或工作病人，應注意可能有注意力和警覺性降低等的問題。

藥物交互作用：

雖然尚未對ALPHAGAN® P進行與特定藥物的藥物交互作用研究，但須考慮ALPHAGAN® P具有增強或加成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)效果的可能。α促進作用劑這一類藥物可能會減低脈搏和降低血壓，因此當α促進作用劑類藥物合併使用β作用阻斷劑(包括眼用和全身性使用)、抗高血壓劑、和(或)心臟作用糖苷等藥物使用時應審慎。

三環抗鬱劑，已有報告指出會減低全身性投與clonidine的降血壓效果，但未知同時使用三環抗鬱劑與ALPHAGAN® P於人體,是否可能導致干擾眼內壓下降的效果。目前尚無任何投與ALPHAGAN® P後的catecholamines血中濃度的資料，但建議病人於併服可能會影響血循環胺類(amines)的代謝和攝取的三環抗鬱劑時應審慎。

致癌性，致突變性，和生育力受損：

小鼠和大鼠分別經過21個月和24個月的用藥後，未觀察得本藥引起的致癌效應：研究中，經膳食投與小鼠高達2.5mg/kg/日劑量和大鼠高達1.0mg/kg/日劑量的brimonidine tartrate，所致的血漿藥物濃度，分別是人類使用每日三次，每次兩眼各滴一滴ALPHAGAN® P治療時，預估所得血漿藥物濃度的86倍與55倍。

本藥用於一系列試管試驗和活體試驗研究，包括Ames試驗、中國倉鼠卵巢(Chinese Hamster Ovary; CHO)細胞染色體迷失檢定分析(chromosomal aberration assay)、小鼠的宿主媒介檢定分析(host-mediated assay)和細胞新生研究(cytogenic studies)、和顯著致命檢定分析(dominant lethal assay)，不具致突變發生或致細胞新生作用。

用於孕婦：致畸胎作用：妊娠用藥級數B。

大鼠每日口服投與0.66 mg的brimonide tartrate進行生殖研究，未見任何因本藥造成的生育力受損、或胚胎損傷，這種用量比人類經多次眼用劑量投與後，病人所得的劑量高189倍。

目前尚無足夠且經充分對照的孕婦研究，而於動物實驗，brimonidine某種程度會通過胎盤，進入胎兒血循環。ALPHAGAN® P唯有在經權衡後，對母體的潛在效益超過可能對胎兒的風險時，方可用於孕婦。

用於哺乳婦：

未知本藥是否會分泌於乳汁，但於動物實驗，brimonidine tartrate會分泌於動物乳汁。基於藥物對母體重要性的考慮，應在停止哺乳與停止用藥，擇一而為。

用於小兒：

本品用於小兒病人的安全性和有效性尚未確立。小兒病人使用brimonidine tartrate 0.2%，曾報告有躁動不安、窒息、心搏減慢、抽搐、發紺、憂鬱、呼吸困難、情緒不穩、低血壓、體溫過低、肌肉張力不足、換氣不足、興奮易怒、不活潑、嗜睡、和木僵等副作用。

用於老人：

用於老人與用於其它成年病人的安全性或有效性間，整體上來說，未見任何差異。

不良反應

發生率約10-20%的不良反應，包括：過敏性結膜炎、結膜充血、和眼睛搔癢。

發生率約5-9%的不良反應，包括：灼燒感、結膜毛囊炎、高血壓、口乾、和視覺模糊。

發生率約1-4%的不良反應，包括：過敏反應、全身無力、眼瞼緣炎、支氣管炎、結膜水腫、結膜出血、結膜炎、咳嗽、頭昏眼花、消化不良、呼吸困難、淚漏、流淚、眼乾、眼睛刺激感、眼痛、眼瞼水腫、眼瞼紅斑、流感症狀、毛囊性結膜炎、異物感、頭痛、咽炎、畏光、發疹、鼻炎、鼻竇感染、竇炎、刺痛感、表淺小點狀角膜病變、視野缺損、玻璃體漂浮物、和視銳度惡化。

發生率低於1%的不良反應，包括：角膜糜爛、失眠、鼻乾、思睡、和味覺倒錯。

用藥過量

並無任何人體使用本品用藥過量之相關資訊。口服用藥過量的處置，包括支持性療法和症候性療法，須隨時維持病人呼吸道的暢通。

用法用量：本藥須由醫師處方使用

建議劑量每日三次，每次患眼滴一滴，間隔約8小時。

包裝

本品為不透明無菌塑膠滴瓶，有3公撮，5公撮，10公撮，15公撮等包裝。

註：低於25°C溫度下儲存，置於兒童不能及之處。

ALLERGAN

Manufactured by:
Allergan Sales, LLC
Waco, Texas, U.S.A.

© 2013 Allergan, Inc.
® marks owned by Allergan, Inc.

藥商
台灣愛力根藥品股份有限公司
台北市羅斯福路二段102號9樓
電話：(02)2366-9888

中華民國發明專利第I287992號
中華民國發明專利第I287998號

9174X
71726UT13

FPO
CODE 128 C
3823

ALLERGAN

* ARTWORK IS ACTUAL SIZE * DROP TEMPLATE AND NOTES BEFORE PROCESSING * PAGE 2 OF 2	
Part Number:	**71726UT13**
Drawing Number:	**0218401**
V-code (Code 128 C):	**3823**