

“愛爾康比利時廠”愛舒特開明眼藥水 2%

ISOPTO* CARPINE 2%

衛署藥輸字第 016483 號

本藥須由醫師處方使用

1. 藥品名稱

ISOPTO* CARPINE 2%

2. 成分含量

每 ml 含活性成份 Pilocarpine Hydrochloride 20 mg。

防腐劑：每 ml 溶液含有 benzalkonium chloride 0.1 mg。

完整的賦形劑請參閱第 6.1 節。

3. 劑型

無菌點眼液。

透明、無色至淡黃色/棕色的無菌溶液。

4. 臨床特性

本點眼液含有 pilocarpine hydrochloride，為一種縮瞳劑（擬副交感神經藥物（Parasympathomimetics））。

4.1 適應症

縮瞳劑用於控制慢性青光眼之眼壓。

4.2 用法用量

劑量

每次點二滴於眼睛，每日點三次，或依醫師指示使用。

4.3 禁忌

- 對活性成分或任何第 6.1 節中所列的賦形劑過敏者。
- 本品禁用於瞳孔收縮的情況（例如急性虹彩炎或前葡萄膜炎）。

4.4 警語和注意事項

- 較敏感者使用縮瞳劑時曾通報發生視網膜剝離，例如年輕近視病患或具有視網膜剝離病史的病患。以 ISOPTO* CARPINE 點眼液治療前，建議先進行眼底檢查。
- 前房發生急性發炎性疾病時應避免使用縮瞳劑。
- 小樑組織的房水排出功能嚴重受損病患，可能會出現眼內壓反而升高的情況。
- 角膜或結膜損傷時，建議謹慎使用，以避免過度滲透而造成全身毒性。
- ISOPTO CARPINE 點眼液應謹慎使用於急性心臟衰竭、支氣管性氣喘、消化性潰瘍、甲狀腺功能亢進、胃腸道痙攣、巴金森氏症、泌尿道阻塞、近期曾發生心肌梗塞、高血壓與低血壓的病患，因為可能有使上述病況惡化的風險。
- 長期使用可能導致接觸性過敏。
- ISOPTO CARPINE 點眼液含有 benzalkonium chloride，此成分可能會引起眼部刺激，且已知會使軟性隱形眼鏡變色。應避免軟式隱形眼鏡接觸本品。請務必指示病患在使用 ISOPTO CARPINE 前取下隱形眼鏡，並在用藥至少 15 分鐘後再重新配戴。
- 點藥時注意事項
 - 眼睛用藥。

- 蓋子打開以後，如果防開啟束環鬆脫，請先將其移除再開始使用產品。
- 為了防止藥水瓶尖端及藥水受到污染，請小心不要使藥水瓶尖端接觸到眼瞼、周邊或其他表面。未使用時，請保持瓶蓋蓋緊。
- 建議在點藥後閉合鼻淚管或輕輕閉上眼睛。這可以減少點眼藥物經由眼部通道所造成的全身性吸收、因而降低全身性不良反應。
- 若須使用超過一種外用點眼劑，則每次用藥應相隔至少 5 分鐘。眼用藥膏須最後使用。

4.5 與其他藥品的交互作用

並未有臨床相關的交互作用被描述。

4.6 生殖能力、懷孕及哺乳

懷孕

目前幾乎沒有 ISOPTO CARPINE 點眼液使用於懷孕女性的資料。然而，動物研究顯示，大鼠全身性暴露於 pilocarpine 時會造成生殖毒性的有害作用。

不建議於懷孕期間使用 ISOPTO CARPINE 點眼液。

哺乳

目前未知 pilocarpine 是否會分泌至人類乳汁中。然而，應預期會分泌至母乳中。目前也未有哺乳期間使用 pilocarpine 眼用製劑的安全性資料。然而，無法排除對哺乳嬰兒的風險。應考量哺乳對於嬰兒的利益以及母親接受治療的利益，來決定是否停止哺乳或停止/避免以 ISOPTO CARPINE 點眼液治療。

生殖能力

尚未進行相關研究以評估眼部局部給予 ISOPTO CARPINE 點眼液對於生育力影響。

4.7 對駕駛及機械操作能力的影響

ISOPTO CARPINE 點眼液會大幅影響駕駛與操作機器的能力。

縮瞳劑可能會造成視線模糊與難以適應黑暗。應建議病患，於夜間駕駛時或於光線不佳處進行危險工作時，應格外謹慎。

4.8 不良反應

下列的不良反應依 MedDRA 系統器官分類與發生率列示：非常常見($\geq 1/10$)、常見($\geq 1/100$ 至 $< 1/10$)、不常見($\geq 1/1,000$ 至 $< 1/100$)、罕見($\geq 1/10,000$ 至 $< 1/1,000$)、非常罕見($< 1/10,000$) 或未知(無法由現有資料評估)。在各頻率組中，不良反應依嚴重度遞減的順序排列。在臨床試驗及上市後監測中曾有不良反應的通報。

| 系統器官分類 | 不良反應 |
|-----------|---|
| 免疫系統的異常 | 未知：過敏 |
| 神經系統的異常 | 非常常見：頭痛 常見：頭暈 |
| 眼睛視力方面的異常 | 非常常見：視線模糊 常見：視力減退(因睫狀肌痙攣引起)、眼部疼痛、閃光幻覺、玻璃體漂浮物、眼部刺激、眼部充血 不常見：視網膜破裂、玻璃體出血、眼皮水腫、瞳孔縮小、玻璃體剝離、眩光、眼部異物感 |

| | |
|-----------|----------------|
| | 未知：眼內壓升高、角膜水腫 |
| 胃腸消化系統的異常 | 常見：噁心 未知：嘔吐 |

4.9 用藥過量

眼部使用本點眼液過量時，可利用微溫的水沖洗眼睛。

若過量使用，毒性症狀可能包括：頭痛、唾液分泌過多、盜汗、昏倒、心搏過緩、低血壓、腹部痙攣、嘔吐、氣喘與腹瀉。

藥物過量時可給予支持性治療。嚴重全身性毒性可能需要以抗膽鹼劑治療。

5. 藥理特性

5.1 藥效學特性

藥理治療分類：抗青光眼製劑和縮瞳劑、擬副交感神經藥（Parasympathomimetics）。

ATC 碼：S01EB01

Pilocarpine 是一種具有乙醯膽鹼活性的擬副交感神經藥物，具有縮瞳作用，可使用於降低眼內壓。Pilocarpine 可直接收縮睫狀肌，促進房水流出，以降低眼內壓力。可刺激瞳孔括約肌引起縮瞳作用。作用時間約為六小時。

5.2 藥物動力學特性

吸收

曾以 14 名健康受試者兩眼分別給予 2 滴 pilocarpine hydrochloride 4% 點眼液，每日四次，共八日，以評估 pilocarpine 的全身性曝藥量。在比較第 5 與第 8 日的 C_{max} 後，顯示 pilocarpine 濃度在局部給藥後達到血漿穩定態。第 8 日的平均(±標準差) C_{max} 與 AUC 數值分別為 3.7 ± 3.2 ng/ml 與 7.7 ± 8.4 ng*h/ml。第 8 日的 T_{max} 範圍在 0.5 至 1 小時間。

分佈

Pilocarpine 幾乎不會與血漿蛋白結合。

生物轉化

Pilocarpine 會由血漿酯酶代謝成為 pilocarpic acid，並由細胞色素 P450 異酵素 CYP2A6 代謝為 3-hydroxypilocarpine。上述兩種代謝物均不具有藥理活性。在口服劑量 pilocarpine 3 mg 後，pilocarpic acid 的 C_{max} 與 AUC 均近似於 pilocarpine。3-hydroxypilocarpine 的 C_{max} 與 AUC 約為 pilocarpine 的 C_{max} 與 AUC 的一半以下。CYP2A6 基因的基因多型性會影響藥動學資料。然而，由於 pilocarpine 的全身性曝藥量低，也具有其他的排除途徑，因此，本藥對於 CYP2A6 代謝緩慢者應不會造成任何安全性風險。

排除

在大鼠靜脈注射與口服 ^{14}C -pilocarpine hydrochloride 的恆量試驗中，顯示 pilocarpine 與其代謝物一般由尿液排除，約有 90% 的劑量會在給藥後 24 小時內排除。

特殊族群

腎功能不全病患

在針對腎功能正常及不全（計算肌酸酐廓清率 10-112 ml/min）者進行的一項臨床研究中，顯示不同程度腎功能不全病患的 pilocarpine 廓清率並未受到影響。

肝功能不全病患

輕微至中度肝功能不全會降低血漿廓清率與增加曝藥量。在一項以輕微至中度肝功能不全病患進行的臨床研究中，相較於正常受試者，輕微與中度肝功能不全病患單次給予口服劑量 5 mg

pilocarpine 後的擬似血漿廓清率降低 1.4 與 3.3 倍，並導致全身性曝藥量(C_{max})增加 20-40%。

6. 藥劑學特性

6.1 賦型劑列表

Benzalkonium chloride、boric acid、sodium citrate、hypromellose、hydrochloric acid/sodium hydroxide (調整 pH 值)、純水。

6.2 不相容性

無相關資料。

6.3 貯存特殊注意事項

室溫貯存 (8°C -30°C)。

請勿使用超過包裝上所載保存期限的藥品。

請將本品置於孩童無法看見及取得之處。

6.4 容器性質與內容物

100 ml 以下塑膠瓶裝

6.5 棄置時的特殊注意事項

無特殊需求。

*商標為 Novartis 所擁有

© 2015 Novartis

Alcon[®]

a Novartis company

製造廠：s.a. ALCON-COUVREUR n.v.

廠址：Rijksweg 14, B-2870 Puurs, Belgium.

藥商：瑞士商愛爾康大藥廠股份有限公司台灣分公司

地址：新北市新店區寶中路 119 號 4 樓

電話：(02) 2917-2468

英文版次：75060-0/02-2015