

露明目點眼液劑0.01%

LUMIGAN OPHTHALMIC SOLUTION 0.01%

衛署藥輸字 第 025294 號

本藥限由醫師處方使用

版本日期 2026-01-30

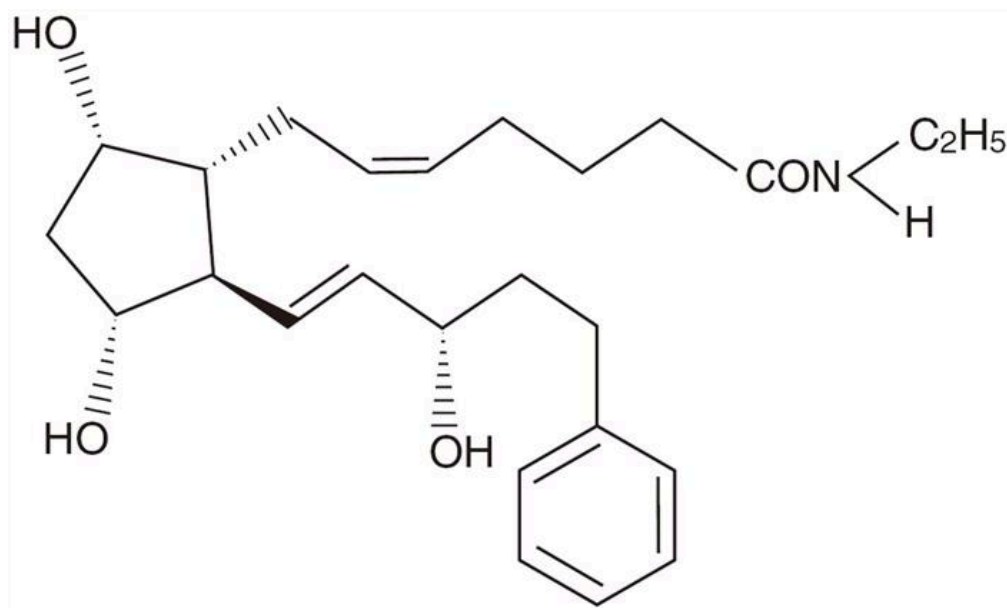
1 性狀

1.1 有效成分及含量

LUMIGAN[®] 0.01%的活性成分：bimatoprost 0.1 mg/mL。

主成分資訊

LUMIGAN[®] 0.01% (bimatoprost眼用溶液劑)是一種具降眼壓活性的prostamide合成衍生物。其化學名稱為(Z)-7-[(1R,2R,3R,5S)-3,5-Dihydroxy-2-[(1E,3S)-3-hydroxy-5-phenyl-1-pentenyl]cyclopentyl]-5-N-ethylheptenamide，分子量為415.58。分子式為C₂₅H₃₇NO₄。化學結構為：



Bimatoprost呈粉末狀，極易溶於甲醇及乙醇，微溶於水。LUMIGAN[®] 0.01%為透明、等滲透壓、無色、無菌的眼藥水，滲透壓約為290 mOsmol/kg。

1.2 賦形劑

保存劑：Benzalkonium chloride。

賦形劑：Sodium phosphate dibasic heptahydrate、Sodium chloride、Citric acid monohydrate、Hydrochloric acid 或 Sodium hydroxide (調整pH值)、Purified water。

1.3 劑型

眼用溶液劑。

1.4 藥品外觀

LUMIGAN[®] 0.01%為透明、等滲透壓、無色、無菌的眼藥水。

2 適應症

LUMIGAN[®] 0.01% (bimatoprost眼用溶液劑)適用於降低慢性隅角開放性青光眼或高眼壓病人之眼內壓。

3 用法及用量

3.1 用法用量

建議劑量為每天晚上在患眼滴一滴眼藥水。每天不可使用LUMIGAN[®] 0.01%超過一次以上，因為已經證實，過度頻繁使用前列腺素衍生物可能會減弱其降眼壓之療效。(請參照5.1警語/注意事項)

LUMIGAN[®] 0.01%可與其他局部眼藥併用，以降低眼壓(請參照5.1警語/注意事項)。如果同時使用的局部眼用藥超過一種以上，這些藥物的使用至少應彼此間隔5分鐘以上。

4 禁忌

LUMIGAN[®] 0.01%禁止用於對bimatoprost或本品其他成分具臨床意義過敏的病人。

5 警語及注意事項

5.1 警語/注意事項

5.1.1 眼內發炎

急性眼內發炎(如：葡萄膜炎)的病人使用LUMIGAN[®] 0.01%時應謹慎，因為可能會使發炎加劇。

5.1.2 黃斑水腫

在以bimatoprost 0.03%眼用溶液劑治療高眼壓期間，曾有黃斑水腫(包括囊樣黃斑水腫)的通報。無晶體病人與假水晶體附帶水晶體後囊撕裂的病人或是已知具有黃斑水腫的風險因子之病人(例如：眼內手術、視網膜靜脈阻塞、眼部炎症性疾病和糖尿病視網膜病變)，使用LUMIGAN[®] 0.01%時，應審慎。

5.1.3 虹膜色素沉著

給予bimatoprost液劑後，虹膜色素沉著曾發生增加。應告知病人褐色虹膜色素沉著增加的可能性，這可能是永久性的。色素沉著的變化是因為黑色素細胞內的黑色素含量增加，而不是因為黑色素細胞數量增加所造成。虹膜色素沉著增加的長期影響目前仍未知。眼部給予bimatoprost時觀察到的虹膜顏色變化可能在幾個月到幾年內不明顯。虹膜的痣和斑點似乎都沒有受到治療的影響。LUMIGAN[®] 0.01%對黑色素細胞的長期影響，以及對黑色素細胞可能造成的傷害和(或)色素顆粒沉積於其他區域的後果，目前仍屬未知。

5.1.4 眼眶周圍組織色素沉著

Bimatoprost眼用溶液劑曾有導致色素組織產生變化的通報。當LUMIGAN[®] 0.03% (多劑量)直接滴入眼睛(用於治療眼壓升高)時，最常通報的色素變化是眼眶周圍組織(眼瞼)、睫毛和虹膜的色素沉著增加。一些病人的眼眶周圍組織色素沉著曾被通報是可逆的。

5.1.5 治療區域外的毛髮生長

LUMIGAN[®] 0.01%反覆接觸的皮膚表面可能會有毛髮生長的現象。因此，需依照指示使用LUMIGAN[®] 0.01%，並避免碰觸到臉頰或其他皮膚表面。

5.1.6 傷害和污染

曾有與使用多劑量之局部眼藥容器有關的細菌性角膜炎的案例通報。在大部分案例中，這些容器曾在無意中被患有眼部疾病的病人污染。眼上皮表面受損的病人罹患細菌性角膜炎的風險更大。

應指導病人避免讓眼藥容器的尖端接觸眼睛或周圍結構，以避免眼睛受傷和溶液污染。

5.1.7 配戴隱形眼鏡者的使用

LUMIGAN[®] 0.01%含有保存劑benzalkonium chloride可能導致軟式隱形眼鏡吸收而變色。應指導病人於使用LUMIGAN[®] 0.01%前，應先取下軟式(親水性)隱形眼鏡，滴入15分鐘後才可重新戴上。

5.1.8 睫毛生長的可能

在療程開始前，應告知病人睫毛生長的可能性，因為在前列腺素類似物(包括LUMIGAN[®])治療期間已觀察到這種情況。

預期僅單眼接受治療病人應被告知：有關接受治療後，該隻眼睛有虹膜、眼周圍組織、和眼睫毛的褐色色素沉著增高的可能，因而可能發生兩眼顏色深度不等，也應被告知兩眼眼睫毛的長度、粗細度和(或)數目可能不同的情況。

5.1.9 炎症或其他青光眼

LUMIGAN[®]尚未在患有炎症性眼部疾病、新生血管型、發炎型、隅角閉鎖型青光眼、先天性青光眼或窄角型青光眼病人中進行研究。

5.1.10 與前列腺素衍生物併用

在青光眼或高眼壓症病人使用LUMIGAN[®] 0.03%的研究發現，bimatoprost的暴露量高於一天一次的使用量，可能減弱降眼壓的效果。當病人併用

LUMIGAN[®]與其他前列腺素衍生物時，應監測其眼壓變化。

5.1.11 角膜病變

LUMIGAN[®] 0.01%所含的benzalkonium chloride濃度為0.02% (0.2mg/mL)，與LUMIGAN[®] 0.03%含有0.005% (0.05mg/mL)不同，benzalkonium chloride曾被通報引起點狀角膜病變，因此乾眼或角膜損傷的病人經常或長期使用應接受監控。嚴重乾眼病人不應使用。

5.3 操作機械能力

如同其他眼用製劑，滴入本藥後若有短暫視線模糊，應等到視線恢復清晰後再行開車或操作機械。

6 特殊族群注意事項

6.1 懷孕

目前尚未針對懷孕婦女進行適當、充分對照的LUMIGAN[®] 0.01%治療研究。由於動物生殖研究未必能夠預測人類反應，只有在潛在效益大過於對胎兒的潛在風險時，才應讓懷孕女性使用LUMIGAN[®] 0.01%。

動物數據

懷孕大鼠在孕期第6至17天，口服bimatoprost高達0.3或0.6 mg/kg/day會造成流產，但並無藥物相關發育作用。小鼠在孕期第6至15天接受0.3 mg/kg/day，也觀察到此作用。對於小鼠或大鼠，bimatoprost的母體無不良作用劑量(NOEL)分別為0.1或0.3 mg/kg/day。流產被認為是齧齒類特有的藥理學作用，於小鼠和大鼠產生該作用的最低有效劑量分別為0.3或0.6 mg/kg，所達到的全身藥物暴露量(AUC)相當於人類使用臨床劑量後(眼部局部用給予0.03% bimatoprost)所觀察到之全身藥物暴露量的33或103倍。

F₀雌性大鼠給予0.3 mg/kg/day (全身暴露量估計為預期臨床劑量的41倍)或更高劑量治療，會造成母體毒性，包括孕期縮短、晚期再吸收增加、胎兒死亡和產後死亡，以及幼崽體重減輕(齧齒類特有的藥理學作用)。

6.2 哺乳

目前還不知道LUMIGAN[®] 0.01%是否會分泌至人類乳汁中，不過動物研究證實，bimatoprost確實會分泌至乳汁中。因為很多藥物都會進入人類乳汁，所以哺乳中的婦女使用LUMIGAN[®] 0.01%時，應審慎。

6.4 小兒

兒童病人的使用尚未被評估，因此不建議使用於兒童或青少年病人。

6.5 老年人

年長與其他成年病人間並未出現安全性或療效的整體臨床差異。

6.6 肝功能不全

LUMIGAN[®] 0.01%尚未對中度至重度肝功能不全病人做相關研究，因此此類病人需謹慎使用LUMIGAN[®] 0.01%。對曾患有輕度肝臟疾病或基準期時ALT異常、AST異常和/或膽色素異常的受試者而言，使用LUMIGAN[®] (bimatoprost 0.03%)超過48個月對肝功能並無任何不良影響。

6.7 腎功能不全

尚未有針對腎功能不全病人的研究資料，因此此類病人需謹慎使用LUMIGAN[®]。

6.8 呼吸功能不全

尚未對呼吸功能不全病人做相關研究，因此此類病人需謹慎使用LUMIGAN[®]。

7 交互作用

尚未有交互作用相關研究。

由於眼部使用0.03% bimatoprost眼用溶液後，bimatoprost的全身濃度極低(低於0.2 ng/mL)，因此預計不會在人類中發生交互作用。

當與其他前列腺素衍生物一起使用時，前列腺素衍生物(例如 LUMIGAN[®])對青光眼或高眼壓病人的降眼壓作用可能會降低(請參照**5.1警語/注意事項**)。

8 副作用/不良反應

8.1 臨床重要副作用/不良反應

仿單中其他章節描述了以下不良反應：

- 眼內發炎 [參照警語/注意事項 (5.1.1)]
- 黃斑水腫 [參照警語/注意事項 (5.1.2)]
- 色素沉著，包括虹膜色素沉著和眼瞼色素沉著 [參照警語/注意事項 (5.1.3, 5.1.4)]
- 睫毛變化 [參照警語/注意事項 (5.1.8)]
- 過敏 [參照禁忌 (4)]

8.2 臨床試驗經驗

在一項為期12個月的3期臨床試驗中，在接受bimatoprost 0.01%眼用溶液治療的青光眼或高眼壓病人中約38% (71 /185)出現了不良反應，這些不良反應被認為與治療有關。最常被通報與治療相關的不良事件是29%的病人出現結膜充血(大多數為輕度，非炎症性的)。在bimatoprost 0.01%組中，大約4% (8/185)的病人因12個月試驗中的任何不良事件而中止試驗，其中1.6% (3/185)因結膜充血而中止。

試驗中使用bimatoprost 0.01%眼用溶液治療期間，通報了以下被認為與治療相關的不良反應。大多數是眼部的，輕微的，沒有嚴重的不良反應。

頻率定義如下：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($<1/10,000$)。

眼部疾病

非常常見：眼/結膜充血

常見：眼睛刺激、眼瞼紅斑、眼睛搔癢、眼瞼搔癢、睫毛增生、點狀角膜炎

皮膚和皮下組織疾病

常見：多毛症、皮膚色素沉著過度

一般疾病和給藥部位狀況

常見：點藥部位刺激

8.3 上市後經驗

以下為LUMIGAN[®]於上市後曾發生的不良反應。因為上市後通報為自發性，且族群大小不明，因此無法可靠推估這些不良反應發生的頻率：

LUMIGAN[®] 0.01%

眼睛疾病

眼瞼色素沉澱、乾眼、眼部分泌物、眼睛水腫、眼瞼水腫、眼睛痛、眼內異物感、虹膜色素沉澱、淚液增加、黃斑水腫、眼睛不適、與眼眶周圍脂肪萎縮和皮膚緊收相關的眼眶周圍和眼瞼的改變造成眼瞼溝加深、眼瞼下垂、眼球凹陷和眼瞼後縮、畏光、視覺模糊。

免疫系統疾病

過敏反應，包括眼睛過敏和過敏性皮膚炎的徵兆和症狀。

神經系統疾病

暈眩、頭痛。

呼吸道、胸腔及縱膈疾病

氣喘、氣喘發作、呼吸困難。

血管疾病

高血壓。

9 過量

目前並無人類藥物劑量過量的相關資訊。如果發生藥物劑量過量，應採取症狀和支持性治療。如果意外攝入LUMIGAN® 0.01%，以下資訊可能有用：在為期2週大鼠與小鼠經口餵食的研究顯示，bimatoprost劑量高達100 mg/kg/day時並不會產生任何毒性。此劑量若以mg/m²表示，相較於10 kg孩童誤食整瓶bimatoprost 0.03%時的劑量，至少高出70倍。

10 藥理特性

10.1 作用機轉

Bimatoprost是一種合成前列腺醯胺(prostamide)。結構與前列腺素F_{2a} (PGF_{2a})類似。

藥物治療分類：其他抗青光眼製劑

ATC code: S01EE03

Bimatoprost是一種具降眼壓活性的製劑。

Bimatoprost的效果可能與房水(aqueous humour)流出的雙重作用機制有關，涉及葡萄膜鞏膜(uveoscleral)與小樑網(trabecular meshwork)許萊姆氏管(Schlemm's canal)。人類的小樑網/許萊姆氏管流出途徑的研究表明bimatoprost增加前列腺醯胺受體媒介的水樣液流量。

10.2 藥效藥理特性

兩項試驗評估了0.03% bimatoprost眼用溶液劑在給藥後12小時內的效果。早上給藥時，bimatoprost在初次滴入後4小時內開始生效，並在8至12小時左右達到最大療效。

根據這些資訊，建議每天晚上給藥一次，以使藥物在早晨(上午08:00至11:00)眼壓通常最高的時段發揮預期最高的療效。

10.3 臨床前安全性資料

10.3.1 一般毒性試驗

食蟹猴接受0.03%或0.1% bimatoprost眼用劑型滴入眼中，每日一次或兩次，持續1年，並未觀察到治療相關的全身性作用。在所有治療組中，某些動物觀察到虹膜色素沉著增加。色素沉著並未伴隨觀察到黑色素細胞數量增加。虹膜色素沉著增加的機轉，似乎是黑色素細胞中的黑色素產生刺激增加，而非黑色素細胞數量增加所致。可逆性的眼周溝隆起程度與劑量增加相關，導致治療眼的瞼裂加寬，未觀察到與眼周變化相關的功能或顯微變化。

Bimatoprost最高劑量(0.1%，每日2次)所產生的全身藥物暴露量，相較於人體每眼1滴0.03%，每日1次，持續2週，至少為65倍。

在雄性和雌性荷蘭黑帶兔6個月眼部毒性試驗中，給予荷蘭黑帶兔眼部用藥0.01% bimatoprost/200 ppm BAK眼用溶液，或0.0125% bimatoprost/200 ppm BAK眼科溶液，每日最多三次，持續6個月，皆未出現全身或眼部毒性。整體而言，這些資料支持0.01% bimatoprost/200 ppm BAK眼用溶液的安全性。

10.3.2 致癌性

在小鼠或大鼠中，分別口服灌食bimatoprost最多2 mg/kg/day和1 mg/kg/day的劑量(相當於局部眼部給予後，依血中AUC濃度，人體最大建議暴露量的192和291倍)，持續給予104週，並無致癌性發現。

10.3.3 致突變作用

在Ames試驗、小鼠淋巴瘤試驗或體內小鼠微核試驗中，Bimatoprost並無致突變或致裂作用。

10.3.4 損害生育能力

雄性大鼠在共居前給藥70天，雌性大鼠在交配前給藥15天時，並未影響生殖能力。雄性持續給藥，直到觀察到交配為止，雌性則持續到孕期第7天為止。

Bimatoprost最高劑量(0.6 mg/kg/day)所產生的全身藥物暴露量，相較於人體每眼1滴0.03%，每日1次，持續2週時的103倍。

11 藥物動力學特性

吸收與全身藥物暴露量

Bimatoprost在體外可輕易穿透人類角膜及鞏膜。平均角膜通透性係數為 3.24×10^{-6} cm/sec。Bimatoprost穿透人類鞏膜的通透性優於角膜組織，平均鞏膜通透性係數為 14.5×10^{-6} cm/sec。眼部給予後，bimatoprost的全身暴露量極低，且不會隨著時間累積。健康受試者兩眼各1滴0.03% bimatoprost，每日1次，持續2週，血液濃度在給藥後10分鐘內達到高峰，給藥後1.5小時並降到低於偵測下限(0.025 ng/mL)。第7天和第14天的平均 C_{max} 和 $AUC_{0-24hrs}$ 數值相近，分別為約0.08 ng/mL和0.09 ng•hr/mL，顯示眼部用藥的藥物濃度在第一週內可達到穩定。

在兩項第3期安全性及療效試驗中，測量青光眼或高眼壓病人的bimatoprost血中濃度(每日一次治療 N=88，每日兩次治療 N=89)。在第0天以及第3、第6、第12個月晚上給藥後約5分鐘時採檢。Bimatoprost血中濃度與正常健康受試者的觀察結果相近，且並沒有顯著的長期全身性藥物累積。這些試驗的血液檢體，通常無法測得C-1酸代謝物(AGN 191522)。

分佈

Bimatoprost中度分佈於身體組織，人體在穩定態下全身分佈體積為0.67 L/kg。在人類血中，bimatoprost主要位於血漿內。Bimatoprost濃度1至250 ng/mL的範圍內，約88%會結合至人類血漿蛋白，而結合與濃度無關。

代謝

Bimatoprost在人眼中並未廣泛代謝，進入全身循環時主要以bimatoprost形式存在。

Bimatoprost會進行葡萄糖醛酸化、羥化、N-脫乙基和脫醯胺化，形成多樣化的多種代謝物。Bimatoprost的葡萄糖醛酸苷接合物，是尿液和糞便排除佔最大量的代謝物。

排除

六名健康受試者以靜脈方式給予放射標記bimatoprost (3.12 µg/kg) · bimatoprost最高血中濃度為12.2 ng/mL · 且會迅速降低 · 排除半衰期為45分鐘 · bimatoprost的血中總清除率(Clb)為1.50 L/hr/kg · 靜脈給予的劑量中 · 67%會排入尿液 · 只有少量以原型態藥物排除 · 25%的劑量可從糞便回收 · 其中15-40%以原型態藥物形式排除 ·

特殊臨床情況中的藥物動力學

老年病人的特性

年輕(18-44歲 · 平均=28.5)或老年病人(65-80歲 · 平均=71.0) · 每日2次 · 持續7天 · bimatoprost皆無顯著的全身性累積 · 這兩個年齡層中 · bimatoprost會快速在血中出現 · 且多數病人於1.5小時便低於LLOQ · 在單次和多次給藥後 · 老年病人的全身藥物暴露量皆高於年輕病人(分別為124%和213%) · 老年受試者的平均AUC_{0-24hrs}數值為0.0634 ng·hr/mL · 顯著高於年輕受試者0.0218 ng·hr/mL · 顯示具有年齡效應 · 不過 · 此發現並未認定具臨床意義 · 因為bimatoprost用於年輕和老年族群 · 其療效和安全特性相近 ·

12 臨床試驗資料

在一項12個月樞紐性試驗中 · 已證明使用LUMIGAN[®] 0.01%眼藥水每日1次是有效的降眼壓療法 · LUMIGAN[®] 0.01%不劣於LUMIGAN[®] 0.03% ; 在全部 (17/17) 時間點時 · 平均眼內壓治療差異之間的信賴區間上限(95%或97.5%依據Hochberg程序)皆在1.50 mm Hg邊界內 · 在所有追蹤時間點時 · 相較於基準點眼內壓的平均降幅 · 兩個組別皆達到統計顯著且具臨床意義($p < 0.001$) · 相較於基準點眼內壓 · LUMIGAN[®] 0.01%的平均變化介於-5.2至-7.8 mm Hg · LUMIGAN[®] 0.03%介於-5.6至-8.0 mm Hg · 在任何回診日 · LUMIGAN[®] 0.01%在12個月期間測得的日間眼內壓數值 · 一整天內相差不超過1.1 mmHg · 且未曾超出17.9 mmHg · 此臨床試驗中 · 並未觀察到對心跳速率和血壓產生治療相關且具臨床意義的作用 ·

13 包裝及儲存

13.1 包裝

LUMIGAN[®] (多劑量)以無菌不透明(白色)低密度聚乙烯(LDPE)塑膠瓶盛裝 · 並附有滴管尖和耐衝擊的聚苯乙烯(HIPS)蓋 ·

13.2 效期

架儲期為2年 ·

13.3 儲存條件

保存 : LUMIGAN[®] 0.01%的儲存溫度應在2°至25°C之間 ·

14 病人使用須知

14.1 色素沉著的可能性

應告知病人發生虹膜棕色色素沉著增加的可能性 · 且可能為永久性增加 · 並應告知病人眼瞼皮膚變深的可能性 · 以及在停用LUMIGAN[®] 0.01% (bimatoprost眼用溶液劑)後即可能逆轉 ·

14.2 睫毛變化的可能性

並應告知病人，在接受本品治療的期間，患眼可能會出現睫毛與柔毛變化。這些變化可能會導致雙眼睫毛或柔毛有不同的長度、厚度、色素沉著、數量，和/或不同的睫毛生長方向。睫毛變化通常在停止治療後即可逆轉。

14.3 藥瓶使用

應指示病人避免讓藥瓶碰觸到眼睛及其周圍結構、手指或任何其他表面，以避免眼睛的傷害及藥水受到汙染。使用受汙染的藥水，可能會造成眼睛嚴重傷害，進而可能導致視力喪失。

14.4 何時該尋求醫囑

也應建議病人，如果他們出現併發的眼睛問題(如：外傷或感染)、接受眼睛手術或是眼睛出現任何反應，特別是結膜與眼瞼方面的反應，應該立刻徵詢醫師的建議，是否可以繼續使用本品。

14.5 配戴隱形眼鏡者的使用

LUMIGAN[®] 0.01%含有氯化銨(Benzalkonium chloride)，可能會被軟式隱形眼鏡吸收而導致脫色。應指導病人於使用LUMIGAN[®] 0.01%前，應先取下軟式隱形眼鏡，滴入15分鐘後再重新戴上。

14.6 與其他眼藥併用

如果使用的局部眼用藥超過一種以上，這些藥物的使用至少應彼此間隔5分鐘以上。

14.7 本品開封後，28日內丟棄

15 其他

譯自CCDS V13.0 TW3

中華民國發明專利第I399207號

製造廠

: Allergan Pharmaceuticals
Ireland

地址：Castlebar Road, Westport, County Mayo, Ireland

二級包裝廠：裕利股份有限公司

地址：桃園市大園區和平里1鄰開和路91號

藥商

: 瑞士商艾伯維藥品有限公司台灣
分公司

地址：臺北市中山區遼寧街179號17及19樓