

# 成醫藥誌



## Pharmacy Forum

發行人：楊俊佑  
總編輯：葉鳳英  
主編：藥品諮詢組  
地址：台南市勝利路138號  
電話：(06)2353535 轉 2515  
<http://nckupharmacy.hosp.ncku.edu.tw/NewHomePage/index.asp>  
八十年十月創刊  
新聞局出版事業登記證  
局版台省誌字第1207號

### 藥物介紹：

## Epinastine 與過敏性結膜炎

楊郁茜<sup>1</sup>、楊育菁

### 前言

過敏性結膜炎(allergic conjunctivitis)是由空氣過敏原與眼睛接觸所引起免疫球蛋白E (IgE) 誘導的第一型過敏反應。平均每年影響約20%的人口，且發病率正逐年上升中。主要影響年輕族群，隨著年齡層愈高，出現過敏性結膜炎症狀的人口比例有漸減的趨勢。典型症狀為雙眼紅、癢、結膜水腫、畏光、流淚以及結膜充血。Epinastine為一抗組織胺製劑，以下針對epinastine於過敏性結膜炎的應用進行介紹。

### 過敏性結膜炎

過敏性結膜炎最常見的形式是急性、季節性和常年性過敏性結膜炎，其特徵如下：

- 一、急性過敏性結膜炎：由環境暴露引起的突發性過敏反應，通常為已知的過敏原引起。症狀發生迅速(最快30分鐘內)。一旦移除過敏原，症狀一般在24小時內緩解。因此，過敏性結膜炎的急性特徵是搔癢、充血、流淚、結膜和眼瞼水腫劇烈發作。
- 二、季節性過敏性結膜炎(seasonal allergic

conjunctivitis, SAC)：為對花粉或孢子過敏所引起的結膜發炎現象，發作時相較不明顯，症狀維持在數天到數週。尤其在特定花粉或孢子濃度升高的季節，易好發於有氣喘、過敏性鼻炎等病史患者。

- 三、常年性過敏性結膜炎(perennial allergic conjunctivitis, PAC)：症狀較輕微、慢性，與全年暴露在環境中的過敏原相關，多為家中灰塵、黴菌、寵物等漂浮物過敏所引起。

有關過敏性結膜炎之處置方式，整理於表一及表二。

### 機轉與適應症

Epinastine 為局部直接組織胺 H<sub>1</sub> - 受體拮抗劑，具可逆性地阻斷結膜和眼瞼中組織胺的接受器；此藥同時可抑制肥大細胞(mast cell)的脫顆粒作用(degranulation)，減少發炎物質的釋放。Epinastine 因抑制 leukocyte 的活性，故具有抗發炎效果；另外對於組織胺 H<sub>2</sub>、α<sub>1</sub>、α<sub>2</sub> 受體及 5-HT<sub>2</sub> 受體亦具些微親和力。TFDA 核准於「減緩過敏性結膜炎所引起的眼睛搔癢」。

### 用法用量

建議每日兩次，每次兩眼各滴一滴。

<sup>1</sup>嘉南藥理大學藥學系實習生

表一、常見過敏性結膜炎處置方式

類型	藥物治療
急性過敏性結膜炎	肥大細胞穩定性質的抗組織胺藥物眼滴劑 血管收縮合併抗組織胺眼滴劑
經常性的急性過敏性結膜炎 (一個月≥2天)	肥大細胞穩定性質的抗組織胺藥物眼滴劑
季節性/常年性	首選：肥大細胞穩定性質的抗組織胺藥物眼滴劑 其他：肥大細胞穩定作用眼滴劑、口服抗組織胺
難治性過敏性結膜炎	糖皮質類固醇眼滴劑作輔助用藥
伴隨乾眼之過敏性結膜炎	抗過敏藥物合併人工淚液
輔助治療	
<ol style="list-style-type: none"> <li>1. 冷壓可幫助減少眼瞼水腫</li> <li>2. 使用人造眼淚有助於稀釋過敏原</li> <li>3. 過敏症狀期間應減少或停止使用隱形眼鏡，減少過敏原吸附於隱形眼鏡上的機率</li> <li>4. 定期清洗枕套、被子與衣物</li> </ol>	

表二、過敏性結膜炎外用眼滴劑藥物治療分類

<b>肥大細胞穩定性質的抗組織胺藥物 (Antihistamines with mast cell-stabilizing properties)</b>
<ul style="list-style-type: none"> <li>✓ 目前本院治療過敏性結膜炎常用藥物為 epinastine (銳視代®)及 ketotifen (立敏停®) 眼用液劑 (詳見表三)</li> <li>✓ 作用機轉：抗組織胺作用可逆地阻斷結膜與眼瞼中的組織胺受體，進而抑制肥大細胞媒介物的作用；肥大細胞穩定作用則抑制肥大細胞脫顆粒作用，抑制組織胺、類胰蛋白酶 (tryptase) 和前列腺素 D<sub>2</sub> (PGD<sub>2</sub>) 的釋放</li> <li>✓ 在幾分鐘內即可出現療效；若作為預防性用途，則需至少使用兩週才可達到完整療效</li> </ul>
<b>抗組織胺合併血管收縮劑 (Vasoconstrictor/antihistamine combinations)</b>
<ul style="list-style-type: none"> <li>✓ 適用於短暫性或陣發性(約 2 週內)的過敏性結膜炎，可緩解結膜水腫的現象</li> <li>✓ 嚴重時一天最多可使用四次</li> <li>✓ 含有血管收縮劑，使用兩週以上可能導致反彈性充血</li> </ul>
<b>肥大細胞穩定劑 (Mast cell stabilizers)</b>
<ul style="list-style-type: none"> <li>✓ 主要為預防而非治療，在開始治療後 5 至 14 天才可達到完整療效，因此不適用於急性症狀治療。</li> </ul>
<b>非類固醇抗發炎藥物 (Nonsteroidal anti-inflammatory drugs)</b>
<ul style="list-style-type: none"> <li>✓ 阻斷環氧合酶 (cyclooxygenase) 的作用並抑制花生四烯酸 (arachidonic acid) 轉化為前列腺素</li> <li>✓ 臨床效果有限，療效不優於抗組織胺</li> </ul>
<b>糖皮質類固醇 (Glucocorticoids)</b>
<ul style="list-style-type: none"> <li>✓ 只可輔助用於無法以肥大細胞穩定性質的抗組織胺藥物控制症狀的難治性患者</li> <li>✓ 使用於短期脈衝式治療 (short pulse therapy)，每次使用不得超過兩週</li> </ul>

## 藥物動力學

Epinastine 的起始作用時間約 3-5 分鐘，作用時間約 8 小時。眼藥水為局部使用，因此造成全身性吸收的比例相當低；另外，此藥不會通過血腦障壁，因此不會誘發中樞神經系統副作用。

## 不良反應

不良反應大多屬輕微，最常出現的眼部不良反應為眼睛燒灼感、充血、眼乾及搔癢，發生率約 1-10%；另外約 1% 患者可能出現視力障礙及眼部不明分泌物。

非眼部的不良反應為感染(通常為感冒症狀、上呼吸道感染)，發生率約 10%；頭痛、鼻炎、鼻竇炎、咳嗽、氣喘、味覺異常和咽喉炎的發生率則約 1-3%。

## 注意事項

Epinastine (Relestat<sup>®</sup>) 中的防腐劑成分 benzalkonium chloride 可能吸附在隱形眼鏡上，所以應在使用 epinastine 前取下隱形眼鏡，使用藥物 10~15 分鐘後再戴回。此外，此品項開封後一個月，若仍未用完即應丟棄，避免使用中產生污染而造成細菌性角膜炎。

## 臨床試驗

根據 Abelson MB 等人發表的隨機、雙盲、第三期試驗，使用 conjunctival antigen challenge (CAC) 的方式評估過敏性結膜炎患者使用 epinastine 的療效。共有 67 名受試者，一眼接受 epinastine 0.05%，另一眼接受安慰劑，並於第 3 週時進行 onset 的試驗，第 5 週時進行 duration 的試驗。試驗結果顯示，epinastine 在接觸抗原 3 分鐘後，mean itching score 顯著低於對照組(vehicle)，達統計學上的差異( $p < 0.001$ )，且在給藥後 8 小時

仍然有效。

另一篇 2009 年發表的隨機、雙盲研究，探討 5 種季節性過敏性結膜炎藥物治療的療效(olopatadine HCl 0.1%、ketotifen 0.025%、epinastine HCl 0.05%、emedastine 0.05%、fluorometholone 0.1%)。以隨機雙盲的方式將 100 名受試者分作五組，分別給予五種不同藥物，患者一眼接受藥物，另一眼給予安慰劑。結果顯示，除了 fluorometholone 在改善眼睛癢與紅腫症狀的幅度較小之外，其餘四種藥物用在改善過敏性結膜炎的症狀上並沒有顯著差異。

## 結論

Epinastine 用於過敏性結膜炎，可在 3-5 分鐘內迅速開始作用，且不會誘發中樞神經系統副作用，同時兼具抗組織胺與肥大細胞穩定的雙重作用，可顯著降低過敏性結膜炎之症狀。

## 參考資料

1. Relestat<sup>®</sup> 藥品仿單。
2. Takamura E et al. Japanese guidelines for allergic conjunctival diseases. *Allergol Int.* 2017;66(2):220-229.
3. 台大眼科部  
<https://www.ntuh.gov.tw/OPH/DocLib10/%E9%81%8E%E6%95%8F%E6%80%A7%E7%B5%90%E8%86%9C%E7%82%8E%E7%B0%A1%E4%BB%8B.aspx>
4. Abelson MB et al. Efficacy and tolerability of ophthalmic epinastine assessed using the conjunctival antigen challenge model in patients with a history of allergic conjunctivitis. *Clin Ther.* 2004;26(1):35-47.

表三、本院具有抗組織胺及安定肥大細胞作用之眼用製劑

學名	Epinastine HCl	Ketotifen
商品名	Relestat 銳視代	Zaditen 立敏停
成分含量	0.05%, 5 mL/btl	0.025%, 5 mL/btl
適應症	減緩過敏性結膜炎所引起的眼睛搔癢	暫時預防因過敏性結膜炎引起之眼睛癢
劑量頻次	1 gtt BID	1 gtt BID
起始作用時間	3~5 分鐘	數分鐘
副作用	眼睛灼熱感、充血、 眼睛乾澀、搔癢	眼睛灼熱感、乾澀、刺痛、 點狀角膜上皮損傷
懷孕分級	C	C
健保價	93 元	62 元

5. Borazan M et al. Efficacy of olopatadine HCl 0.1%, ketotifen fumarate 0.025%, epinastine HCl 0.05%, emedastine 0.05% and fluorometholone acetate 0.1% ophthalmic solutions for seasonal allergic conjunctivitis: a placebo-controlled environmental trial. Acta Ophthalmol. 2009;87(5):549-54.