

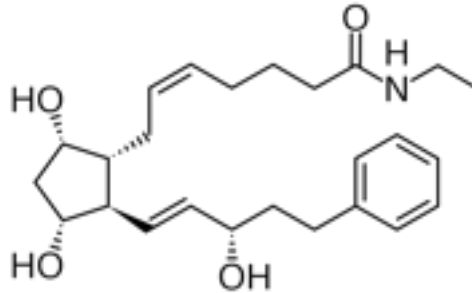
ยานำรู้

Bimatoprost

พัชรินทร์ เเดชราตล, วท.ม. (เภสัชศาสตร์)*

* กลุ่มงานเภสัชกรรม โรงพยาบาลพระปกเกล้า

สูตรโครงสร้าง



ชื่อสามัญทางยา : Bimatoprost

ชื่อการค้า : Lumigan®

รูปแบบของยา : Ophthalmic Solution

ประเภทของยา : Hypotensive Liquid กลุ่ม Prostanoid

ข้อบ่งใช้: ยา Bimatoprost มีข้อบ่งใช้สำหรับการลดความดันภายในลูกตาในคนไข้ต้อหินชนิดมุมเปิด และคนไข้ที่มีความดันภายในลูกตาสอง เมื่อคนไข้ทนต่อยาลดความดันภายในลูกตาตัวอื่นไม่ได้ หรือเมื่อยาลดความดันภายในลูกตาตัวอื่น ๆ ไม่สามารถลดความดันภายในลูกตาให้ถึงระดับเป้าหมาย หลังจากการวัดผลแล้วหลายครั้ง

กลไกการออกฤทธิ์

Bimatoprost เป็นสารกลุ่ม prostamide ซึ่งเป็นสารสังเคราะห์ที่มีสูตรโครงสร้างคล้าย prostaglandin มีฤทธิ์ในการลดความดันภายในลูกตา โดยออกฤทธิ์ที่ prostamide-sensitive receptor ทำให้เพิ่มการไหลออกของ aqueous

humor ผ่านทาง trabecular meshwork และ uveosclera

เภสัชจลนศาสตร์

การดูดซึม

หลังจากหยอดยา Bimatoprost 0.03 percent eyedrop ที่ตาทั้งสองข้างของอาสาสมัครสุขภาพดีจำนวน 15 คน วันละ 1 ครั้ง เป็นเวลา 2 สัปดาห์ พบว่าระดับยาในเลือดเพิ่มถึงระดับสูงสุดภายในเวลา 10 นาที หลังหยอดยา และความเข้มข้นของยาจะลดลงต่ำกว่าระดับที่สามารถวัดได้ (0.025 นาโนกรัม/ มิลลิลิตร) ภายในเวลา 1 ชั่วโมงครึ่ง ระดับยาสูงสุดเฉลี่ย เมื่อใช้ยา 1 สัปดาห์ และ 2 สัปดาห์ มีค่าเท่ากัน คือประมาณ 0.08 นาโนกรัม/มิลลิลิตร เมื่อใช้ยาเป็นเวลานาน ไม่พบว่าระดับยา มีการสะสมเพิ่มขึ้นอย่างมีนัยสำคัญ

การกระจายยา

ยา Bimatoprost กระจายเข้าสู่เนื้อเยื่อของร่างกายได้ปานกลาง มีค่าปริมาตรการกระจายยาเท่ากับ 0.67 ลิตร/กิโลกรัม ประมาณร้อยละ 12 ของยาในพลาสมา อยู่ในรูปยาอิสระ

การเปลี่ยนแปลงยา

เมื่อยาเข้าสู่กระแสเลือดจะถูกทำลายโดยปฏิกิริยา oxidation, N-deethylation และ glucuronidation

การกำจัดยาออกจากร่างกาย

จากการทดลองให้ยา Bimatoprost ทางหลอดเลือด ปริมาณ 3.12 ไมโครกรัม/กิโลกรัม ในอาสาสมัครสุขภาพดี 6 คน จะพบระดับยาสูงสุดในเลือดในรูปที่ไม่เปลี่ยนแปลงปริมาณ 12.2 นาโนกรัม/มิลลิลิตร และลดลงอย่างรวดเร็ว ค่าครึ่งชีวิตประมาณ 45 นาที ยาส่วนใหญ่ถูกขับออกทางปัสสาวะ และส่วนน้อยถูกขับออกทางอุจจาระ

ขนาดยา และ วิธีบริหารยา

หยอดตาข้างที่เป็นต้อหิน หรือมีความดันภายในลูกตาสูง ครั้งละ 1 หยด วันละ 1 ครั้ง (เวลาเย็น)

ข้อห้ามใช้

ห้ามใช้ในผู้ที่มีประวัติแพ้ส่วนประกอบต่างๆ ของยา

ข้อควรระวัง

- ผู้ป่วยที่ใช้คอนแทคเลนส์ ควรถอดคอนแทคเลนส์ออกก่อนหยอดยา และคอยประมาณ 15 นาทีหลังจากหยอดยาแล้ว จึงใส่คอนแทคเลนส์

- Pregnancy category C

อาการข้างเคียง

อาการไม่พึงประสงค์ที่พบบ่อยที่สุด (เกิดประมาณร้อยละ 15 ถึง 45 ของผู้ใช้ยาทั้งหมด) เรียงลำดับของอุบัติการณ์จากมากไปน้อย ได้แก่ ตาแดง ขนตางอกยาวขึ้น และหน้าขึ้น และคันตาประมาณร้อยละ 3 ของผู้ป่วย ต้องหยุดใช้ยา

เนื่องจากอาการตาแดง

อาการไม่พึงประสงค์ที่เกิดประมาณร้อยละ 3 ถึง 10 เรียงลำดับของอุบัติการณ์จากมากไปน้อย ได้แก่ ตาแห้ง แสบตา เคืองตา ปวดตา เนื้อเยื่อรอบๆ ตาสีคล้ำขึ้น หนังตาอักเสบ และขนตาสีเข้มขึ้น อาการเหล่านี้จะหายไปเมื่อหยุดใช้ยา

อาการไม่พึงประสงค์ที่เกิดประมาณร้อยละ 1 ถึง 3 เรียงลำดับของอุบัติการณ์จากมากไปน้อย ได้แก่ มีของเหลวไหลออกจากตา น้ำตาไหล ตาสู้แสงไม่ได้ เยื่อบุตาอักเสบเนื่องจากการแพ้ ตาอ่อนเพลียง่าย เยื่อบุตาบวม และม่านตามีสีเข้มขึ้น ซึ่งอาการม่านตามีสีเข้มขึ้นนี้เป็นอาการข้างเคียงที่เกิดขึ้นถาวร

อาการไม่พึงประสงค์ที่พบน้อยกว่าร้อยละ 1 ได้แก่ ม่านตาอักเสบ

จากผลของยาที่ทำให้ขนตางอกยาวขึ้น หน้าขึ้น และสีเข้มขึ้น องค์การอาหารและยา ของประเทศสหรัฐอเมริกา (USFDA) ได้อนุมัติให้ขึ้นทะเบียนยานี้ในรูปแบบเครื่องสำอาง ในปีพ.ศ. 2551 โดยมีข้อบ่งใช้สำหรับอาการขนตางา (eyelash hypotrichosis) อย่างไรก็ตามการใช้ยาสำหรับข้อบ่งใช้นี้ จำเป็นต้องคำนึงถึงอาการข้างเคียงอื่นๆ และผลการลดความดันภายในลูกตาที่จะเกิดขึ้นกับผู้ใช้ด้วย

วิธีเก็บรักษา และความคงตัวของยา

เก็บที่อุณหภูมิห้อง (25 องศาเซลเซียส) ไม่จำเป็นต้องเก็บในตู้เย็น

อายุของยา

อายุของยา 24 เดือน นับจากวันผลิต

การศึกษาทางคลินิก

การศึกษาของ Robert S Noecker และคณะ

เปรียบเทียบประสิทธิภาพการลดความดันในลูกตาระหว่างยา Bimatoprost และยา Latanoprost โดยการใช้ยาติดต่อกันเป็นเวลา 6 เดือน ในผู้ป่วยโรคต้อหิน พบว่ายา Bimatoprost มีประสิทธิภาพในการลดความดันภายในลูกตามากกว่ายา Latanoprost และพบอาการตาแดง และขนตาวาวขึ้น ในผู้ป่วยที่ใช้ยา Bimatoprost มากกว่าผู้ใช้ยา Latanoprost

Rikkert van der Valk และคณะ ได้ทำการศึกษาโดยรวบรวมผลงานทางคลินิก ที่เกี่ยวข้อง กับผลของยาต่อการลดความดันภายในลูกตาของ ยาทุกชนิดที่ใช้ในผู้ป่วยต้อหินชนิดมุมเปิด และผู้ป่วยที่มีความดันในลูกตาสูง ซึ่งได้รับการตีพิมพ์ จนถึงเดือนธันวาคม ปี พ.ศ. 2546 (Meta-analysis of Randomized Clinical Trials) พบว่ากลุ่มยาที่มีผลในการลดความดันในลูกตามากที่สุดได้แก่ยา Bimatoprost, Travoprost, Latanoprost และ Timolol

บรรณานุกรม

1. Cantor LB. Bimatoprost: a member of a new class of agents, the prostamides, for glaucoma management. Expert Opin Investig Drugs 2001; 10:721-31.
2. Noecker RS, Dirks MS, Choplin NT, Bernstein P, Batoosingh AL, Whitcup SM. A six-month randomized clinical trial comparing the intraocular pressure-lowering efficacy of bimatoprost and latanoprost in patients with ocular hypertension or glaucoma. Am J Ophthalmol 2003; 135: 55-63.
3. Van der Valk R, Webers CA, Schouten JS, Zeegers MP, Hendrikse F, Prins MH. Intraocular pressure-lowering effects of all commonly used glaucoma drugs : a meta-analysis of randomized clinical trials. Ophthalmology 2005;112:1177-85.
4. Law SK. Bimatoprost in the treatment of eyelash hypotrichosis. Clin Ophthalmol 2010; 4: 349- 58.