

科技照亮未來視界

新穎標靶青光眼救星問世

世界衛生組織統計，青光眼是全球第二大致盲因素，2020年全球有超過8,000萬人罹患青光眼，四分之一的患者有失明風險。臺灣青光眼患者約45萬人，且因用眼過度，罹病年齡有下降趨勢。工研院研發新穎標靶青光眼藥物，榮獲2023年全球百大科技研發獎肯定。



工研院研發新穎標靶青光眼藥物，造福廣大患者。

撰文／賴宛靖

青光眼帶走許多人的視力，人生從明亮變黑暗，其罹病成因之一是小樑網（Trabecular Meshwork）堵塞，導致眼內分泌的「房水」排流受阻，造成眼壓升高、視神經萎縮，使得視野逐

漸缺損，最終釀成失明。最可怕的是，青光眼早期症狀不明顯，病程如同「溫水煮青蛙」，當察覺視力模糊時，視神經通常已經受損40%以上，堪稱視神經的隱形殺手，目前尚無根治方法，只

能靠定期檢查，早發現、早治療。

運用標靶治療概念研發新藥物

目前市面上約有6、7種治療青光眼的藥物，治療原理是透過減少房水生成或將眼睛堵塞的小樑網舒張，使房水順利排除以降低眼壓，但時間一久，身體容易產生抗藥性，因此醫師只能在有限選擇中輪流使用，多年後病患就會面臨無藥可用的窘境。此外，醫界選擇的一線用藥，對眼睛容易發炎的患者，或是罹患糖尿病導致眼睛血管組織更脆弱的病人，副作用相當明顯，包括紅眼、發炎，嚴重甚至會使眼球受損。

青光眼患者增多、用藥需求日增，但藥品選擇有限，因此工研院6年前投入「新穎標靶青光眼藥物開發計畫」，領先國際研發出效果理想、低副作用的青光眼救星，病患每日只需點藥1次，既能維持藥效又能減少抗藥性，成為國內首款自主研发成功的新穎標靶青光眼藥物。

工研院生醫與醫材研究所副所長呂瑞梅表示，工研院生醫領域一向以高門檻、高難度的腫瘤標靶藥物研發見長，得知青光眼用藥需求後，運用標靶治療的概念來開發新藥。研究團隊以一種新發現的蛋白激酶ROCK（Rho-associated Protein Kinase）為標靶，由於眼中ROCK過多易造成小樑網收縮，讓房水難排出，眼壓就會升高，因此團隊以ROCK為研究標的，開發出新一代青光眼ROCK抑制劑藥物。

降眼壓效果比現行藥物更優

呂瑞梅解釋，由於眼球構造特別且獨立，工研院團隊必須從零開始摸索，分成2個小組，各自開發不同的藥物化合物組合，再驗證哪種結構最有效以加快研發速度，在嘗試200多組化合物組合後，終於找到比現行藥物藥效更佳的青光眼藥。

更令人振奮的是，團隊發現該項藥物不僅能抑制ROCK，對另一種蛋白激酶MYLK-4也具抑制效用，比起市售藥物AR-13324，對MYLK-4的抑制效

果可達39倍以上，是全球首款可同時抑制2個新穎標靶的青光眼藥物，等於是雙管齊下，一起關掉2種蛋白質生成機制，使小樑網更能舒張、增加排水，且一天只需點1次就有效果，不僅副作用低，也降低抗藥風險。

這款青光眼新藥具有「3S」特色：精準疏通（Smart），世界首創雙標靶機制，兩路並進，提升小樑網排水功能，降眼壓效果優於市售藥物；有效降眼壓（Sharp），瞄準市售新標靶藥物不適用的高眼壓青光眼，給藥6至8小時後，仍能維持最大的降眼壓藥效，效力是市售藥水的3倍以上；安全（Safe），避免目前眼藥造成紅眼及藥物交互副作用的情況，用藥更安心，現已布局6個國家與地區的專利，進入臨床試驗準備階段。這款新藥在2022年12月底已授權臺灣的信力生技，今年已完成第一期臨床試驗，預計2027年上市。

眼藥技術平台強化臺灣眼藥研發實力

新穎標靶青光眼藥物成功問世後，不僅證明臺灣有能力自主研发新藥，也代表臺灣醫藥產業將航向眼科用藥的藍海市場。呂瑞梅指出，有別於全球醫藥開發多集中在腫瘤、心血管疾病等熱門領域，獨門又小眾的眼科市場相對不受青睞，工研院另闢蹊徑，建置一站式生產研發平台，從藥物設計合成、藥效、藥動、毒理、藥物試製及GMP生產等流程，提供業者一站式服務，引領臺灣醫藥產業航向眼科用藥的藍海市場。

工研院的眼藥生產研發平台，除「新穎標靶青光眼藥物」、「治療濕式黃斑部病變滴劑」之外，還投入乾眼症、葡萄膜炎、視網膜神經等眼科疾病的藥物開發，預料都將縮短開發時程與成本，加快商品化腳步。現正協助8家生技業者強化眼科新藥研發能量，加值國內眼藥產業，提升整體競爭力；而亞洲也有新創公司將其眼科新藥研發交由工研院評估，有望催生臺灣成為亞洲新穎眼藥開發的「產業加速器」，助攻我國生技藥物研發實力。■