

△エイゾプト懸濁性点眼液 [外]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】 ブリンゾラミド (U) Brinzolamide 【分類】 眼圧下降剤 [II 型炭酸脱水酵素阻害剤]

【単位】 △5mL/本 [1%]

【常用量】 1回1滴, 1日2回点眼 [最大3回まで]

【用法】 よく振ってから点眼

【透析患者への投与方法】 禁忌 (1) 使用経験がなく, 主薬物を含め腎排泄型であるため, 排泄遅延により副作用が現れるおそれがある (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 重篤な腎障害患者には禁忌 (1) 中等度腎障害患者における経口投与試験では用量調節の必要はないと結論付けられている (1)

【特徴】 二酸化炭素の加水反応や炭酸の脱水を触媒する炭酸脱水酵素-II の阻害剤で, 重炭酸イオンの生成速度を低下させて, Na⁺および水の後房への輸送を抑制することで房水の分泌を抑制し, 眼圧を低下させる。ドルゾラミドの2倍の活性 (Sugrue MF: Prog Retin Eye Res 2000 PMID: 10614682)

【主な副作用・毒性】 眼瞼炎, 皮膚炎, 眼内違和感, 頭痛, 充血, 角膜炎, 眼の過敏症, 脱毛, 複視, 結膜炎, めまい, 呼吸困難感, 筋緊張亢進, 咽頭炎, 蕁麻疹など。点眼による代謝性アシドーシスの報告もある (Menon GJ, Vernon SA: Br J Ophthalmol 90:247-248, 2006) 口腔内の苦み, 酸味などの味覚異常や霧視 (U)

【モニターすべき項目】 眼圧, 血清電解質, 血液の pH (U)

【吸収】 点眼による全身循環への吸収率は5%未満と見積もられ, おそらく初回通過効果を受けない (Menon GJ, Vernon SA: Br J Ophthalmol 90:247-248, 2006) 点眼時の定常状態での赤血球中のブリンゾラミド濃度は炭酸脱水酵素-II が飽和するレベルの20~30 μMに達すると考えられる (1)

【代謝】 主代謝物はN-desethyl 体で, 未変化体より血中濃度は低い (U) N-デスエチル体おほとんど定量限界以下 (1)

【排泄】 主に尿中に未変化体として排泄され, 代謝物も尿中に回収される (U) Ccr 30~60mL/min の患者にブリンゾラミド2mg/日を経口投与した場合の尿中未変化体排泄率は31.4±14.1%, N-desethyl 体は4.38±1.90% [定常状態の12hr 蓄尿] (1)

【t1/2】 点眼後, 全血中で約111hr (U)

【蛋白結合率】 約60% (1,U)

【Vd】 血中では赤血球中の炭酸脱水酵素-II に結合し, ブリンゾラミド存在下でその主代謝物の脱エチル体は炭酸脱水酵素-I と結合する (U)

【MW】 383.5

【透析性】 資料なし (1)

【O/W 係数】 6.56 [1-オクタノール/リン酸 buffer, pH7.4] (1)

【薬物動態】 ブリンゾラミド濃度の定常状態では炭酸脱水酵素-II が飽和する20~30 μMに到達すると推測 (1)

【備考】 溶液の pH7.5 (U) ソフトコンタクトレンズは点眼前に外し, 点眼後の装着は15分あける (U)

【更新日】 20240715

※正確な情報を掲載するように努力していますが, その正確性, 完全性, 適切性についていかなる責任も負わず, いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし, それらを利用した結果, 直接または間接的に生じた一切の問題について, 当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は, 日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。