

△チモプトール点眼液・OXE点眼液 [外]

【重要度】 【一般製剤名】チモロールマレイン酸塩 (U) timolol maleate 【分類】緑内障・高眼圧症治療剤

【単位】△0.5%・▼0.25% (1本5mL), OXE0.5%・▼XE0.25% (1本2.5mL)

【常用量】■0.25%を1日2回, 1回1滴. 効果不十分の場合は0.5%製剤を1日2回, 1回1滴

■XE: 1日1回, 1回1滴. キャップをしたまま点眼瓶を下に向けて1回振ってから点眼

【適用上の注意】他の点眼剤と併用する場合には5分あける. 点眼に際しては原則として患者は仰臥位をとり、患眼を開眼させ結膜嚢内に点眼し、1~5分間閉眼して涙嚢部を圧迫させた後開眼する. XEは点眼前に1回混和

【透析患者への投与方法】常用量 (3)

【保存期 CKD患者への投与方法】常用量 (3)

【特徴】β受容体非選択的遮断薬. 眼圧下降作用機序の詳細は明らかでないが、主に房水産生の抑制によることが示唆されている. しかし房水流出率の増加が関与するとの報告もある. 全身投与した場合、β受容体遮断作用はピンドロールと同程度、プロプラノロールより数倍強力である. また有意の直接心筋抑制作用、ISA、MSAを示さない.

【主な副作用・毒性】喘息発作、心不全の増悪、眼類天疱瘡、結膜充血、心ブロック、脳虚血、失神、浮腫、レイノー現象、四肢冷感、不整脈、低血圧、抑うつ、重症筋無力症の増悪、悪夢、不眠 <XE>霧視

【モニターすべき項目】眼圧、全身性のβ受容体遮断作用

【吸収】経口投与時100% (11) 点眼後、全身吸収される (U) 健康成人に0.5%点眼液を1滴点眼し、1時間後の平均血漿中濃度は、涙嚢部圧迫処置群では、0.41ng/mL、閉眼処置群では0.46ng/mL、無処置群では1.28~1.34ng/mLを示し、これらの処置による血漿中移行が抑制される (1)

【F】78% [点眼] (1) 経口投与時に初回通過効果で40%消失 (1)

【代謝】CYP2D6で代謝される (1) 一部の代謝物にはチモロールの1/7のβ遮断作用がある (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率20%以下 (U,11) 17% [po, 24hrまで] (1) 尿中主代謝物はモルホリン環の開裂物で尿中回収率10~30% [po, 24hrまで] (1) 【CL】7.3mL/min/kg [iv] (1)

【t1/2】4hr (U) 2.8hr (1) 2~5hr, 腎不全でも変化しない (11)

【蛋白結合率】10%以下 (U) 10~88% (11)

【Vd】1.74~3.64L/kg (11) 3.5L/kg [iv] (1)

【MW】432.49

【透析性】除去されない (U) 資料なし (1)

【O/W分配係数】1.16 [1-オクタノール/buffer, pH7.4] (1,11)

【相互作用】β遮断剤 (全身投与) : 眼圧下降あるいはβ遮断剤の全身的な作用が増強されることがある. Ca拮抗剤 : 房室伝導障害、左室不全、低血圧を起こすおそれがある. ジギタリス製剤 : 心刺激伝導障害 (徐脈、房室ブロック等) があらわれるおそれがあるので、心機能に注意する. CYP2D6を阻害する薬物 [パロキセチン、テルピナフィン、キニジンなど] による血中濃度上昇の可能性 (1)

【効果発現時間】点眼後30分以内 (U)

【効果持続時間】点眼後24時間 (U)

【備考】製剤のpH: 6.5~7.5 (1)

【XE】他の点眼剤併用時には、本剤を最後に点眼する. やむを得ない場合は十分な間隔をあける. 点眼直後、眼の表面で涙液と接触することにより点眼液がゲル化するため、霧視又はばたつきが数分間持続することがある.

【更新日】20201207

※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。