○ダイアモックス錠　・▼末　［内］，○注射用　［注］

【重要度】★★★　【一般製剤名】アセタゾラミド（U）　Acetazolamide　【分類】炭酸脱水酵素阻害剤
【単位】◎250mg/錠，▼末，○500mg/V
【常用量】■内服：250～1000mg/日（適用症により異なる）■注射：250～1000mg/日（適用症により異なる）
【用法】■内服：分割投与■注射：静注または筋注
【透析患者への投与方法】眼圧効果目的に125mgを週2～3回［血中濃度上昇による中枢神経症状の報告があるためTDM実施］（5）
125mg×週3回から，血中濃度30μg/mLを超えないように週5回に増量して投与で眼圧コントロールが得られた可能性のあるHD症例（吉田拓弥，他：日腎薬誌 2024）
【その他の報告】無尿，急性腎不全の患者には本剤の排泄遅延により副作用が強くあらわれるおそれがあるため禁忌（1）データなし（3）
データがほとんどないため提示できないが，できれば投与を避け，もし投与するなら62.5～125mg/日とし，症状と血清濃度をモニターする（17）
眼科周術期に使用して代謝性アシドーシスや中枢神経症状（昏睡）を認めた腎不全患者の症例［2000mg/日で開始］（Kerber JM, et al: Case Rep Crit Care 2020 PMID: 32082641）
眼圧への影響を調査するため750mg/日×7日間を適用した集団では全例が代謝性アシドーシスを発現（De Marchi S, et al: Ren Fail 1989 PMID: 2623197）

【PD】遊離型分率は上昇するがEmaxは低下する（Yue CS, et al: J Pharm Pharm Sci 2013 PMID: 23683608）
データがなく提示できないが，可能なら避ける．もし必要なら低用量から開始して注意してモニターする（17）
125mg/日以下に設定（Schwenk MH, et al: Adv Perit Dial 1994 PMID: 7999862）
代謝性アルカローシスを合併した体液貯留に250mg/日を適用して改善したPD症例（Nagaoka K, et al: Saudi J Kidney Dis Transpl 2021 PMID: 35102939）
【CRRT】250mgを12hr毎（17）避ける（3）
【保存期CKD患者への投与方法】Ccr＞50mL/min：1回250mgを1日2～3回，Ccr 10～50mL/min：125～375mg/日，Ccr＜10mL/min：125mgを48hr毎（5）
【その他の報告】Ccr＞50mL/min：常用量を6hrごと，Ccr 10～50mL/min：常用量を12hrごと，Ccr＜10mL/min：避ける（10）
GFR＞50mL/min：250mgを6～12hrおき，GFR 10～50mL/min：250mgを12hrおき，GFR＜10mL/min：避ける（3,12）無尿、急性腎不全では禁忌（1）
Ccr 70mL/min：750mg/日（分3），Ccr 50mL/min：375mg/日（分3），Ccr 30mL/min：250mg/日（分2），Ccr 10mL/min：125mg/日（分1）（Yano I, et al: Eur J Clin Pharmacol 1998 PMID: 9591933，矢野育子：医療薬学 28:1-8, 2002）
GFR＞50mL/min：250mgを6hr毎，GFR 10～50mL/min：125mgを12hr毎，GFR 10mL/min未満：データがなく提示できないが，可能なら避ける．もし必要なら低用量から開始して注意してモニターする（17）
腎機能低下傾向の高齢者では減量すべき（Chapron DJ, et al: J Clin Pharmacol 1989 PMID: 2498399）
【特徴】スルホンアミド誘導体の炭酸脱水酵素阻害剤．緑内障で他剤の補助療法として用いられる．眼圧低下（緑内障の緩解），中枢神経系の刺激伝達抑制（てんかん発作の抑制），呼吸賦活（呼吸性アシドーシス・睡眠時無呼吸の改善）及び利尿などの作用を示す．糸球体ろ過された炭酸水素Naの再吸収抑制により尿中Na排泄を促進するが，利尿作用としては弱い．アルカリ尿となり代謝性アシドーシスの原因となる．
【主な副作用・毒性】代謝性アシドーシス，低K血症，低Na血症，ショック，アナフィラキシー，再生不良性貧血，溶血性貧血，血球減少，急性腎不全，腎・尿路結石，精神錯乱，痙攣，肝機能障害，睡眠時無呼吸症候群，知覚異常，血糖変化，発熱，精神症状，消化器症状など．
【安全性に関する情報】連用する場合には電解質異常に注意（1）降圧作用によるめまい，ふらつきがあらわれることがあるので，高所作業，自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させる（1）
透析患者における血中濃度依存的な中枢毒性の2症例［倦怠感，傾眠，不穏］（Schwenk MH, et al: Pharmacotherapy 1995 PMID: 7479208）
HD患者への過量投与による神経毒性発現症例（Roy LF, et al: Am J Kidney Dis 1992 PMID: 1462998）
高山病予防において短期間投与で発現した腎後性AKI（Neyra JA, et al: J Investig Med High Impact Case Rep 2: 2324709614530559, 2014 PMID: 25264540）
CKDの指摘のない患者に白内障術後に750mg×3日間使用し発現した結晶性腎後性腎障害（Abou-Mrad RM, et al: Am J Case Rep 2021 PMID: 33888675）
1型DMでの高山病治療にアセタゾラミドを使用してDKAを助長（Pandit K, et al: Ann Med Surg (Lond) 2020 PMID: 32637094）
0.5～0.75g/日投与3日で意識障害を認めた腎不全症例（庄野義幸，他：透析会誌 23: 1403-1405, 1990）
【モニターすべき項目】CBC，血清電解質，尿所見，腎結石
【F】100%（14）不明．吸収は良好（U）ほとんど完全に吸収される（11）
【tmax】2～4hr［po］（1,U）5mg/kg経口投与後のCmax 20～30μg/mL（1）
【代謝】代謝されない（11）
【排泄】尿中未変化体排泄率100%（1,10,12,U）90～100%（U）80%以上が尿細管分泌により残りが糸球体濾過により未変化体のまま尿中に排泄される（U, Bull Johns Hopkins Hosp 106: 1,1960）90%（14）アルカリ尿で排泄が促進される．わずかに胆汁排泄されるが腸肝循環をするという確証は得られていない（11）
【CL】45mL/min（10）PD患者で1.2L/hr（Yue CS, et al: J Pharm Pharm Sci 2013 PMID: 23683608）【非腎CL/総CL】20%（10）
【t1/2】10～12hr（1）10～15hr（U）6～9hr（11）1.7hr（10）1.7～5.8hr（10）3.5hr（12,14）【透析患者のt1/2】内服：26hr（Am J Kidney Dis 1992 PMID: 1462998）49hr［自験例］（5）PD患者で20hr［iv］（Yue CS, et al: J Pharm Pharm Sci 2013 PMID: 23683608）PD患者で28.5hr（Schwenk MH, et al: Adv Perit Dial 1994 PMID: 7999862）
【蛋白結合率】95%（1,10）90%（U）70～90%（11,12）PD患者で遊離型分率8.6%（Yue CS, et al: J Pharm Pharm Sci 16: 89-98, 2013）

【Vd】0.2L/kg（11,12,14）0.231L/kg（Yano I, et al: Eur J Clin Pharmacol 1998 PMID: 9591933）
【分布】脳・腎・赤血球内分布が高い．赤血球中には大量の carbonic anhydrase が存在する．髄液内には血中総アセタゾラミド濃度の約 1%移行する（Bull Johns Hopkins Hosp 106: 1,1960）赤血球内にも移行する（精神医学 21: 551,1979）
【MW】244.23
【透析性】4hr の HD で 30%除去（Southern Medical J 72:422-3,1980）PS 膜を用いた 4hrHD での血漿濃度変化率は約 20%（TDM 研究 14: 325,1997）透析後のリバウンドは認められない（Pharmacotherapy 15: 522, 1995）蛋白結合率が高いため透析では除去されにくいと考えられる（5）HF での除去率 0.32%，HD での除去率約 20%，PD での除去率 6.8%（1）PD での除去率 6.8%とわずか（1）PD クリアランス 1.2L/hr（Yue CS, et al: J Pharm Pharm Sci 16: 89-98, 2013 PMID: 23683608）HD が中毒治療の補助となる［アシドーシス補正］（Kerber JM, et al: Case Rep Crit Care 2020 PMID: 32082641）
【TDM のポイント】有効濃度には必ずしも一定の見解は得られていないが緑内障では 10～15μg/mL，小児てんかんでは 8～14μg/mL と報告されている（1）一般に 20μg/mL 以上で中毒症状（傾眠，めまい，無気力，倦怠感，しびれ，手指振戦など）があらわれやすく，30μg/mL 以上が中毒域とされる（1）有効治療域 5～15μg/mL，中毒濃度 20μg/mL 以上．採血時間は服用直前のトラフ値が望ましいが，服用後 4hr 以降ならいつでもかまわない［服用後から tmax までの時間は避ける］（5）治療濃度 4～10μg/mL（17）健常人よりも PD 患者の眼圧への Emax が低い（Yue CS, et al: J Pharm Pharm Sci 16: 89-98, 2013）
有効域は 5～20μg/mL としてよいかもしれない（平田純生，他: 日本臨床 57: 440-442, 1999）緑内障治療において赤血球中濃度 20μg/mL で種々の副作用に関連（Inatani M, et al: J Ocul Pharmacol Ther 1999 PMID: 10229487）
【pKa】7.4（1）【O/W 係数】資料なし（1）

【相互作用】利尿や電解質異常による相互作用に注意（1）降圧剤の作用増強（1）カルバマゼピンの血中濃度上昇（1）SGLT2 阻害薬併用で利尿作用の増強（1）ビグアナイド併用下では脱水に注意（1）
【主な臨床報告】HD と HDF では眼圧への影響は変わらず，個人差がある（Saavedra-Fuentes N, et al: Ther Apher Dial 2018 PMID: 30009462）
急性心不全の体液貯留に対して，うっ血の解除におけるループ利尿薬への上乗せ効果が認められた［尿量と Na 排泄量が増加］（Mullens W, et al: N Engl J Med 2022 PMID: 36027559）
呼吸器障害による代謝性アルカローシスの改善に適用しても呼吸不全への効果は認めなかった（Bemand TJ, et al: Thorax 2023 PMID: 37217290）
【効果発現時間】内服：1～1.5hr（U）注射：0.5～1hr（眼圧降下作用）内服は投与後 20 分～1hr で利尿作用が発現し約 12hr 持続する．眼圧低下作用は投与後 0.5～1hr で発現し，多くは 6～8hr で最低眼圧に達し，24hr 後には再び上昇する（1）
【最大効果発現時間】内服：2～4hr（U）
【効果持続時間】内服：8～12hr（U）
【更新日】20240807

---

※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。