

## ◎トルソプト点眼液 [外]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】

★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】 ドルゾラミド塩酸塩 (U) Dorzolamide Hydrochloride 【分類】 炭酸脱水酵素阻害剤

【単位】 ◎1%・▼0.5% (1本5mL)

【用法】 1回1滴、1日3回

【透析患者への投与方法】 重篤な腎障害患者には禁忌 (1)

【その他の報告】 副作用に注意しながら通常用量で使用 (5)

【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) CCr 30 未満には推奨されない (U)

【特徴】 点眼用の炭酸脱水酵素阻害剤 (CA-II 阻害)。眼毛様体に存在する炭酸脱水酵素を阻害し、房水産生を抑制し、眼圧を下降させる。アイソザイム II への選択性が高い (Kobayashi M, et al: Nihon Yakurigaku Zasshi 2000 PMID: 10948564)

【主な副作用・毒性】 アレルギー性結膜炎、眼瞼炎、しみる、流涙、疼痛、異物感、搔痒感、眼のかすみ、結膜充血、結膜浮腫、頭痛、悪心など

【安全性に関する情報】 有益性を検討して適用する状態として、急性狭隅角緑内障、肝機能障害、腎結石既往、高度腎障害 (U)

【吸収】 長期にわたり 2%点眼液を 1 日 3 回点眼した場合には 2mg を経口投与した場合と同程度の血中濃度になる (U)

【Tmax】 ピーク効果は点眼後 2hr (U)

【代謝】 N 脱エチル体が認められ、炭酸脱水酵素タイプ 1 に親和性を有する (U,11) 主に CYP2C9, 2C19, 3A4 で代謝 (1) 脱エチル体の活性は未変化体の 1/2 (1)

【排泄】 腎 (1) 腎排泄が主な消失経路 (11) 未変化体および N-脱エチル体として尿中に回収 (U) 1 回 1 滴、1 日 3 回、7 日間点眼後の尿中未変化体排泄率は投与量の 0.6% [8 日目まで] (1)

【t1/2】 2 相性消失であり、半減期 4 か月 (U) 点眼における血中の定常状態到達期間は 8 週 (U)

【蛋白結合率】 27.8~30.1% (1) 33% (U)

【分布】 赤血球中の CA-II に結合し、赤血球中への移行率が高い (11) 代謝物の N-脱エチル体は赤血球中の CA-I に結合 (U)

【MW】 360.90

【透析性】 血球中薬物は除去できない (5)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない (5) 通常、血中濃度は検出限界 15nM 以下である (U) 【O/W 係数】 1.42 [1-オクタノール/buffer, pH7] (1)

【効果発現時間】

【最大効果発現時間】

【効果持続時間】

【備考】 スルホンアミド誘導体

【更新日】 20220929

※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。