アイラミド配合懸濁性点眼液

CTD 第 2 部 CTD の概要（サマリー）

2.6 非臨床試験の概要文及び概要表

2.6.1 緒言

千寿製薬株式会社

2.6.1 緒言

本項で使用した用語及び略号を表 2.6.1-1 に示した。

表 2.6.1-1　用語及び略語一覧表

用語及び略号	内容
cAMP	Cyclic adenosine monophosphate（環状アデノシン 1 リン酸）
HCO_3^-	重炭酸イオン
Na^+	ナトリウムイオン
RGC	Retinal ganglion cell（網膜神経節細胞）
α_2受容体	α_2アドレナリン受容体

2.6.1.1 名称及び構造式

0.1%ブリモニジン酒石酸塩／1%ブリンゾラミド配合懸濁性点眼剤は、緑内障及び高眼圧症治療を目的とした配合点眼剤である。ブリモニジン酒石酸塩及びブリンゾラミドは、それぞれ 0.1%ブリモニジン酒石酸塩点眼剤及び 1%ブリンゾラミド懸濁性点眼剤の有効成分として既に承認、上市されている。ブリモニジン酒石酸塩の化学構造式を図 2.6.1-1 に、ブリンゾラミドの化学構造式を図 2.6.1-2 にそれぞれ示した。

2.6.1.1.1 ブリモニジン酒石酸塩

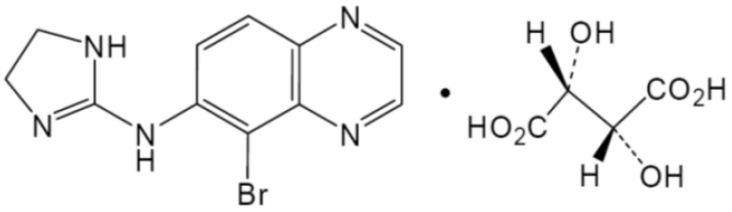
化学名：5-Bromo-*N*-(4,5-dihydro-1*H*-imidazol-2-yl)quinoxalin-6-amine mono-(2*R*,3*R*)-tartrate

分子式：$C_{11}H_{10}BrN_5 \cdot C_4H_6O_6$

分子量：442.22

構造式：

図 2.6.1-1　ブリモニジン酒石酸塩の化学構造式



2.6.1.1.2 ブリンゾラミド

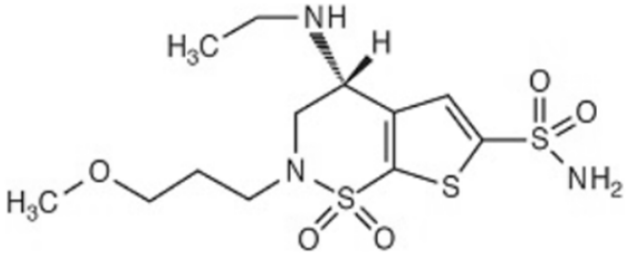
化学名：(*R*)-4-(Ethylamino)-3,4-dihydro-2-(3-methoxypropyl)-2*H*-thieno[3,2-*e*]-1,2-thiazine-6-sulfonamide 1,1-dioxide

分子式：$C_{12}H_{21}N_3O_5S_3$

分子量：383.51

構造式：

図 2.6.1-2　ブリンゾラミドの化学構造式



2.6.1.2 薬理作用

本剤は、緑内障及び高眼圧症治療を目的とした配合点眼剤で、その有効成分はブリモニジン酒石酸塩及びブリンゾラミドである。

ブリモニジンは、α_2受容体を選択的に作動させ、毛様体上皮における cAMP 産生を抑制することで房水産生を抑制し、更に、ぶどう膜強膜流出路を介した房水流出を促進させることにより眼圧下降作用を示すと考えられている。また、これらの眼圧下降作用とは別に、直接的な神経保護作用を有しており、RGC を保護することによっても緑内障の視野障害の進行を抑止できると考え

られている。一方、ブリンゾラミドは毛様体突起部のII型炭酸脱水酵素を特異的に阻害してHCO_3^-の生成を抑制し、それに伴いNa^+及び水の後房への輸送を抑えることで、房水産生を抑制して眼圧下降作用を示すと考えられている。ブリンゾラミドはこの眼圧下降作用とは別に、視神経乳頭血流増加作用を有しており、眼血流障害を改善することによっても緑内障の視野障害の進行を抑止できると期待される。

本剤は0.1%ブリモニジン酒石酸塩及び1%ブリンゾラミドの配合により相加的な眼圧下降作用を示し、更に、直接的な神経保護作用及び視神経乳頭血流増加作用も示すと考えられることから、ほかの緑内障治療薬が効果不十分又は使用できない緑内障及び高眼圧症患者に対する治療のための新たな選択肢として期待される。

2.6.1.3 本剤の予定する効能・効果及び用法・用量

【効能・効果】
次の疾患で、他の緑内障治療薬が効果不十分な場合：
緑内障、高眼圧症
〈効能・効果に関連する使用上の注意〉
単剤での治療を優先すること。
【用法・用量】
1回1滴、1日2回点眼する。