



地方独立行政法人 神戸市民病院機構  
神戸市立医療センター中央市民病院  
Kobe City Medical Center General Hospital

**JH**ospitalist  
**N**etwork

# $\beta$ 遮断薬の点眼薬が 循環動態に及ぼす影響

神戸市立医療センター中央市民病院 総合内科

作成：西山 一徳

監修：南井 崇宏

分野：循環器

テーマ：診断

# 症例：74歳男性

【主訴】  
血圧低下

## 【現病歴】

入院1ヶ月前にうつ病の増悪により精神科病院へ入院

転院2日前より食事摂取量が減少したため補液開始

転院当日に胸部X線検査で胸水を認め、利尿薬を開始したところ

短時間で多量の排尿があり、血圧低下したため当院へ転院

## 【既往歴】

うつ病

開放隅角緑内障

白内障

## 【内服・常用薬】

ジメチルポリシロキサン 80mg

モサプリドクエン酸塩 30mg

チモロールマレイン酸塩 0.5% 点眼薬 両眼1日1回

ピレノキシン 0.005% 点眼薬 両眼1日4回

体温：36.4℃, 脈拍数：62回/分, 血圧：90/67 mmHg

呼吸数：10回/分, SpO2：97%（室内気）

身長：175 cm, 体重：40 kg, BMI 13

## 【身体所見】

頭頸部：頸静脈怒張なし

胸部：心音 整, 雑音なし, 肺音 両下肺野で呼吸音減弱

腹部：平坦, 軟, 圧痛なし

四肢：浮腫なし, 末梢冷感あり

## 【検査所見】

血液検査, 心電図で特記所見を認めず

経胸壁心エコーで左心機能良好で有意な弁膜症なし, 下大静脈は虚脱

## 入院当日

細胞外液輸液で血圧は上昇し、収縮期血圧110-120mmHg台となった。  
チモロール点眼薬は前医に忘れたため中止となっていた。

## 第6病日

チモロール点眼薬投与再開した。

## 第7病日

再度収縮期血圧90mmHg台まで低下した。

## 第8病日

チモロール点眼薬の影響も疑い、チモロール点眼薬を中止した。

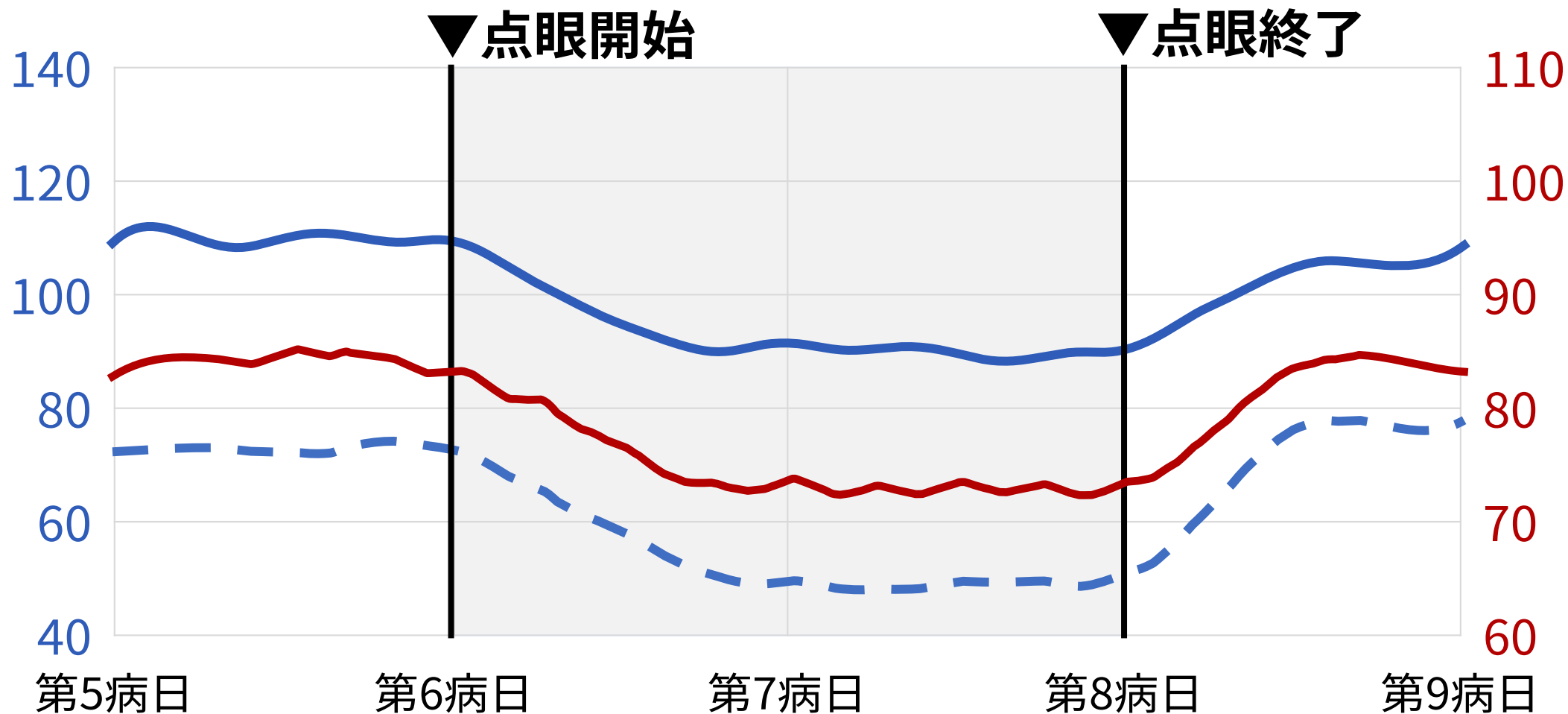
その後低血圧は解消した。

チモロール点眼薬はドルゾラミド点眼薬へ変更した。

—— 收縮期血压    - - - 拡張期血压    —— 心拍数

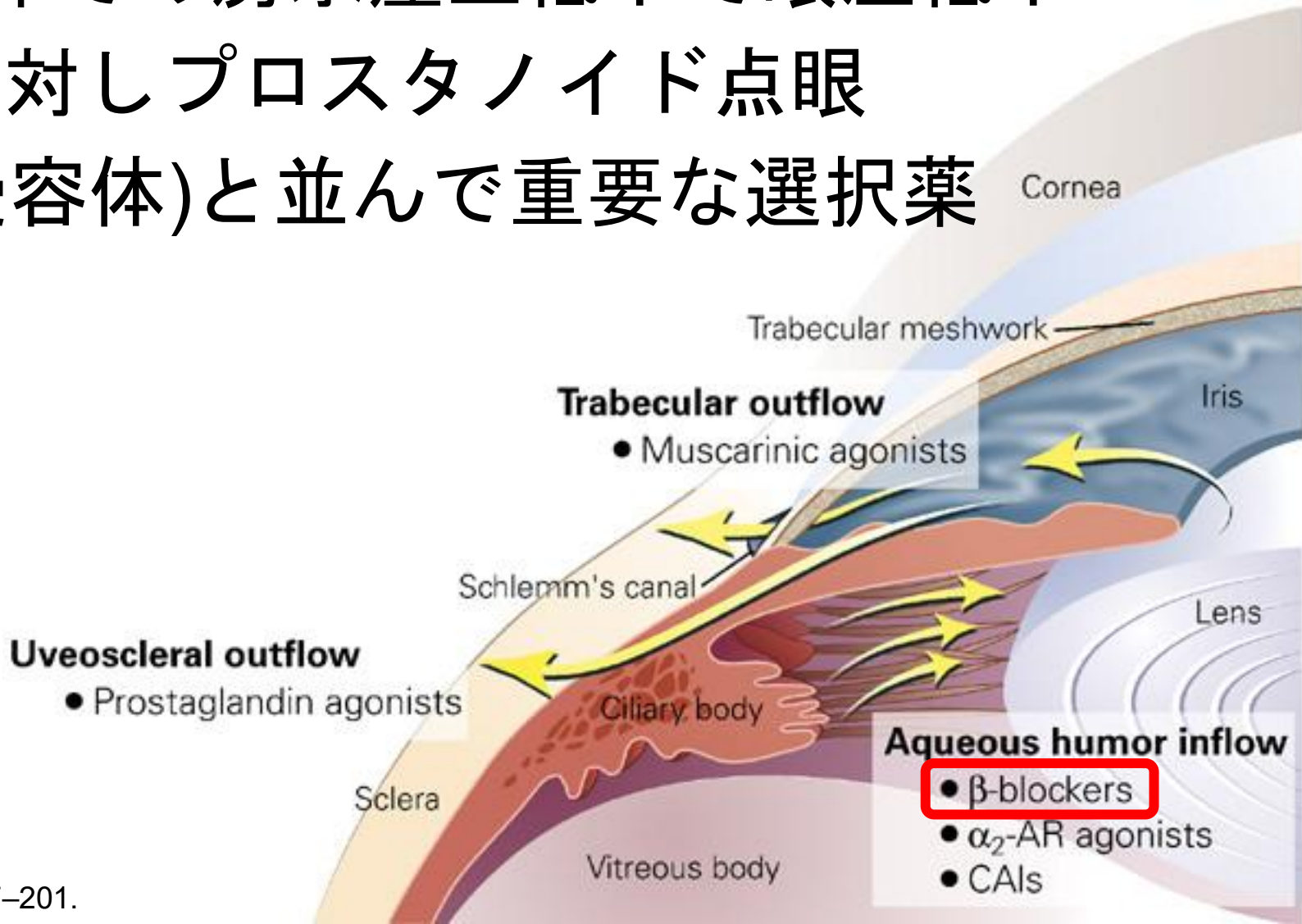
血压 (mmHg)

心拍数 (bpm)



# チモロール点眼薬(チモプトル®)

- $\beta$ 遮断作用で毛様体での房水産生低下で眼圧低下
- 開放隅角緑内障に対しプロスタノイド点眼 (FP受容体, EP2受容体)と並んで重要な選択薬



# Clinical Question

- **β遮断薬の点眼薬が全身に及ぼす影響とその対策は？**
- **β遮断薬の点眼薬の使用時に注意すべき患者背景は？**



# Clinical Question

- **β遮断薬の点眼薬が全身に及ぼす影響とその対策は？**
- β遮断薬の点眼薬の使用時に注意すべき患者背景は？

# チモロール点眼薬を点眼すると

- ✓ **最大80%**が鼻粘膜から吸収される

Graefes Arch Clin Exp Ophthalmol. 2002;240:430-5

- ✓ 点眼後**20-30分**で全身の $\beta$ 遮断作用  
が出現

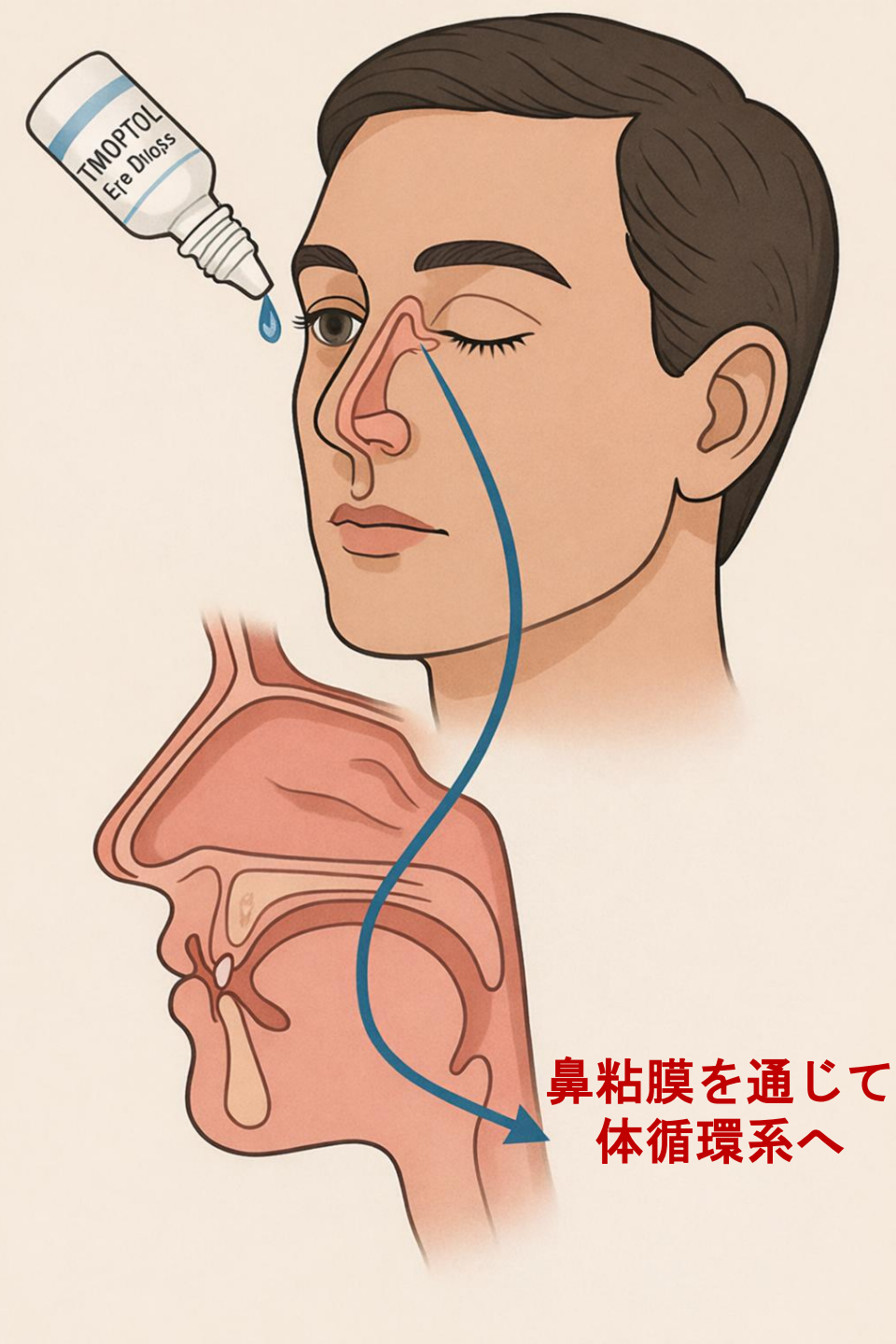
Int J Cardiol.2001;80:257-9

- ✓ 主に **CYP2D6**で代謝

Basic clin pharmacol toxicol 2011;108:297-303

- ✓ 全身作用は最大**24時間持続**する

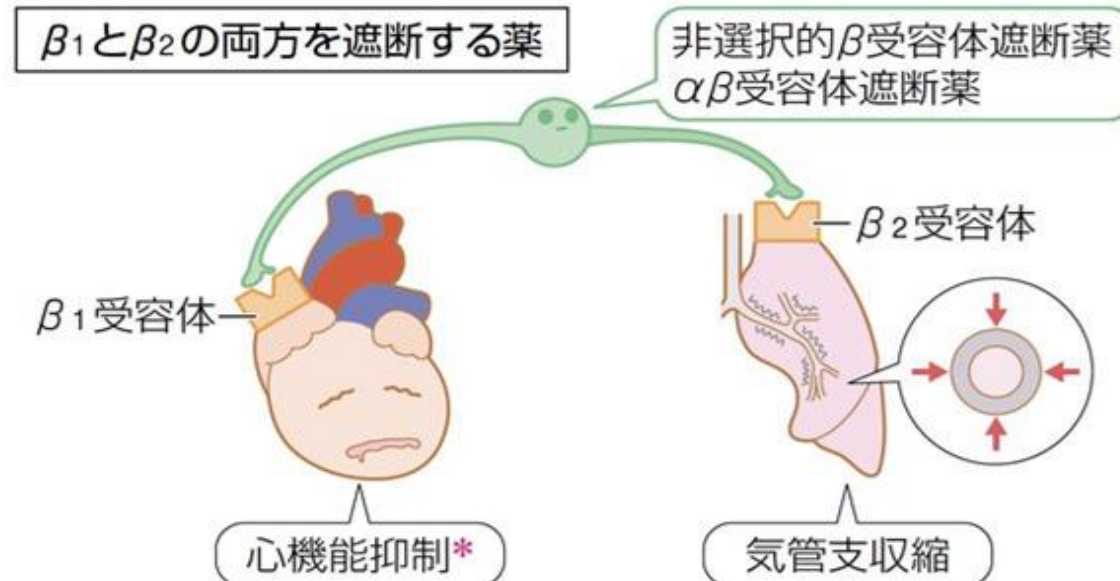
Int J Cardiol.2001;80:257-9



鼻粘膜を通じて  
体循環系へ

# $\beta$ 受容体遮断薬による全身作用

( $\beta_1$ :心臓,  $\beta_2$ :気管支などの平滑筋に存在)



添付文書にも  
記載あり

## 11.1.2 気管支痙攣、呼吸困難、呼吸不全 (いずれも頻度不明)

$\beta$ -受容体遮断による気管支平滑筋収縮作用により、気管支痙攣、呼吸困難、呼吸不全があらわれることがある。

## 11.1.3 心ブロック、うっ血性心不全、心停止 (いずれも頻度不明)

$\beta$ -受容体遮断による陰性変時・変力作用により、心ブロック、うっ血性心不全、心停止があらわれることがある。

# 全身副作用を予防するために

## 点眼直後の

“5分間の涙点圧迫/鼻涙管閉塞”で血中移行67%低下

“5分間の閉瞼”で血中移行65%低下



**点眼後に閉瞼・涙点圧迫を指導することが大切**

本例は自己点眼しており点眼後の閉瞼・涙点圧迫が実施されていなかった



日東メディック, 東亜薬品.  
チモロールXE点眼薬「ニットー」患者向け説明書.

<

1

点眼前には手をきれいに洗ってください。



>

2

ご使用前にキャップをしたまま一度軽く振ってください。  
点眼時に容器の先が目やまぶた、まつ毛に触れないように注意してください。  
(点眼時、多少ベタツキや目のかすみを感じることがあります。)



3

点眼後は目を閉じて、しばらくの間目頭を軽く押さえてください。

薬液が鼻などに流れ込むのを防ぐため、目頭のあたりを指で押さえるようにしてください。



# 交感神経受容体遮断作用のある緑内障点眼薬

薬剤名	主な受容体作用	主な作用機序	代謝
チモロールマレイン酸塩	$\beta_1 \cdot \beta_2$ 遮断	房水産生抑制	肝
カルテオロール塩酸塩	$\beta_1 \cdot \beta_2$ 遮断	房水産生抑制	肝
塩酸ペタキシロール	$\beta_1$ 選択的遮断	房水産生抑制	肝
塩酸レボブノロール	$\beta_1 \cdot \beta_2$ 遮断（+ $\alpha_1$ 遮断）	房水産生抑制 + 流出促進	肝 + 眼
ニプラジロール	$\beta_1 \cdot \beta_2$ 遮断（+ NO放出）	房水産生抑制 + 血流増加	肝
塩酸ブナゾシン	$\alpha_1$ 遮断	房水流出促進	肝

# Clinical Question

- $\beta$ 遮断薬の点眼薬が全身に及ぼす影響とその対策は？
- **$\beta$ 遮断薬の点眼薬の使用時に注意すべき患者背景は？**

# β遮断点眼薬の使用を注意すべき患者背景

## ✓ 高齢者

CYP2D6の活性が低下 + 肝腎機能低下 → 薬物代謝遅延

## ✓ 喘息や心臓伝導障害の既往のある患者

β遮断薬としての注意事項

## ✓ 薬物相互作用

CYP2D6阻害薬との併用 → 薬物代謝遅延

“循環抑制作用薬(Ca拮抗薬, 抗不整脈薬など)”との併用 → 薬力学的相加

- ベラパミルとの併用で徐脈ショックの例あり Intern Med. 2021;60:79-83.

## ✓ CYP2D6の遺伝子多型 (Poor Metabolizer)



血中に移行したチモロールは  
肝で**CYP2D6**により代謝される



**CYP2D6の酵素活性が低い患者**では、  
高代謝群よりも半減期が長く、  
全身性の有害事象を起こしやすい

# CYP2D6の遺伝子多型について

代謝表現型	酵素活性	頻度 (日本人)
<b>PM</b> (Poor Metabolizer)	著しく低い	0.5～1.0%程度
<b>IM</b> (Intermediate Metabolizer)	活性が低い	～15%程度
<b>EM</b> (Extensive Metabolizer)	正常な活性	70～80%程度
<b>UM</b> (Ultrarapid Metabolizer)	活性が過剰に高い	1～2%程度

横井毅. CYP2D6の遺伝子多型の検出法. 臨床検査. 2004;48:163-169

日本人において“PM”はまれであるが“IM”は一定数存在する

# CYP2D6阻害薬の例について

大塚製薬株式会社. CYP2D6/CYP3A4阻害剤一覧 [PDF] .  
大塚製薬 eライブラリ. 2025年6月改訂. (参照 2025年12月27日)



この資料に詳しくまとまっている

阻害強度	薬効分類	一般名 (主な販売名)
<b>強い阻害薬</b> (相互作用を受ける薬剤のクリアランスが1/5以下に減少)	精神神経用剤	パロキセチン (パキシル)
<b>中等度の阻害薬</b> (相互作用を受ける薬剤のクリアランスが1/2以下1/5未満に減少)	精神神経用剤	デュロキセチン (サインバルタ) エスシタロプラム (レクサプロ)
	泌尿器用薬	ミラベグロン (ベタニス)
	解熱鎮痛消炎剤	セレコキシブ (セレコックス) トラマドール (トラマール)
<b>弱い阻害薬</b> (相互作用を受ける薬剤のクリアランスが4/5以下1/2未満に減少)	精神神経用剤	クロルプロマジン (コントミン) アナセピン (シクレスト) セルトラリン (ジェイゾロフト) ベンラファキシン (イフェクサー) フルボキサミン (デプロメール)
	鎮暈剤	ジフェンヒドラミン (トラベルミン)
	不整脈用剤 血圧降下剤・血管拡張剤	アミオダロン (アンカロン) ベラパミル (ワソラン) ニカルジピン (ペルジピン) ジルチアゼム (ヘルベッサー)
	痛風治療剤	フェブキソスタット (フェブリク)
	糖尿病用剤	アログリプチン (ネシーナ)

# まとめ

- $\beta$ 遮断薬の点眼薬は徐脈や低血圧を起こし得る.
- 徐脈や低血圧の患者では点眼薬も含めて薬歴を確認, 点眼方法も確認する.
- 高齢者, CYP2D6阻害薬併用, 既往歴 (喘息, 伝導障害等) に注意する.

内科医と眼科医の密な診療連携が必要  
点眼指導による全身副作用対策も大切