

苄达赖氨酸 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文
https://www.100test.com/kao_ti2020/315/2021_2022__E8_8B_84_E8_BE_BE_E8_B5_96_E6_c22_315354.htm 药品名称苄达赖氨酸
药物别名百达克 Baidake 英文名称bendazac lysine 类别眼科用
药制剂滴眼液：40 mg/8 ml。10 ml塑料眼药水瓶装。分子式
成分L-赖氨酸(1-苄基-1H-吡啶啉-3-氧基)乙酸盐 药理毒理苄
达赖氨酸(简称BDZL)为醛糖还原酶抑制剂，对晶状体醛糖还
原酶有抑制作用，通过局部滴眼使BDZL进入眼组织和房水，
并在晶状体内浓集，从而抑制眼睛中醛糖还原酶活性，达到
预防和治疗白内障的目的。本品对体外培养小鼠晶状体白内
障模型有抗氧化作用；对大鼠糖性白内障模型，通过裂隙灯
照相观察晶状体混浊度和采用电子显微镜检查晶状体蛋白纤
维的超微结构等手段，证实有预防和治疗作用；对热引起
的小鼠、兔、猪晶状体蛋白的变性，在体内外试验均有保护
作用，且与剂量呈相关性；对X-射线引起的家兔白内障晶
状体有保护作用；对2,4-二硝基酚引起的家兔白内障晶状
体的细胞膜的内膜溶解和胞浆流失有保护作用；这些均提示
BDZL有抗白内障作用。药动学大鼠口服¹⁴C-BDZL后，肝、脾、
肌肉、血浆和晶状体中均有分布，各组织消除速度相似，唯
晶状体中药物消除比其他组织慢。如大鼠po¹⁴C-BDZL 200
mg/(kg*d)，连续6d，测得血浆中药物浓度为190.2 mg/L，晶
状体中为1.7 mg/kg；停药72 h后再测，血浆中已降至10.7mg/L，
此时晶状体中仍有0.9 mg/kg。家兔静注后，在眼组织和血浆
中能测得原药及其代谢物5-羟苄达酸，其中虹膜浓度最高，
其他依次为睫状体、视网膜、角膜、泪液、房水、玻璃体和
晶状体；血浆、房水、玻璃体、睫状体和视网膜的消除半衰

期($t_{1/2}$)分别为2.47, 4.56, 3.59, 3.22h, 而晶状体中 $t_{1/2}$ 为17.1h, 明显长于其他组织。兔眼滴入0.5 C-BDZL滴眼液0.05ml后, 测得角膜、虹膜、睫状体、视网膜和房水中药物浓度较高, 玻璃体和晶状体中浓度较低; 但24h后除晶状体外, 各组织中药物浓度均显著下降。如用BDZL滴眼液给家兔滴眼, 0.05 ml/次, tid, 连续滴药6d的药物浓度与一次用药相比, 晶状体可提高10倍左右, 而其他组织仅增加2倍, 表明药物在晶状体中有浓集现象。6例老年性白内障手术患者术前滴用一次0.5L滴眼液2滴, 术中抽取0.5ml房水, 用高效液相色谱法测得滴药后1 h房水中药物浓度为20 ~ 40 μ g/ml。以上结果说明BDZL无论口服、静注还是局部滴眼, 均能进入眼组织和房水, 并在晶状体内浓集发挥抗白内障作用, 这在临床用于治疗白内障的现有药物中是极为少见的。适应症早期老年性白内障 不良反应一过性灼烧感、流泪等反应。用法用量1 ~ 2滴/次, tid, 或遵医嘱, 滴后闭目3 ~ 5 min, 使药物充分吸收。注重事项眼外伤及严重感染时, 暂不使用, 或遵医嘱。部分病例出现一过性刺激感, 如灼热感、刺痛等, 但不影响使用。发现药液污染或混浊弃去不用。100Test 下载频道开通, 各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com