

## AZOPT®

**Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.**

**Đưa xa tầm tay trẻ em.**

**Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc.**

**Nếu cần thêm thông tin xin hỏi ý kiến bác sĩ.**

**Thuốc bán theo đơn.**

### THÀNH PHẦN

Mỗi ml hỗn dịch chứa:

Hoạt chất: Brinzolamid 10 mg

Tá dược:

Benzalkonium clorid, mannitol, carbomer 974P, tyloxapol, dinatri edetat, natri clorid, acid hydrocloric và/hoặc natri hydroxid và nước tinh khiết.

### DẠNG BẢO CHẾ

Hỗn dịch nhỏ mắt.

Hỗn dịch vô trùng màu trắng đến trắng ngà.

### CHỈ ĐỊNH

Hỗn dịch nhỏ mắt brinzolamid 1% (AZOPT) được chỉ định như một liệu pháp đơn trị liệu để làm giảm tăng nhãn áp trên bệnh nhân là người lớn bị tăng nhãn áp hoặc glôcôm góc mở không đáp ứng hoặc có chống chỉ định với thuốc đối kháng thụ thể beta, hoặc điều trị hỗ trợ các thuốc đối kháng thụ thể beta hay nhóm thuốc tương tự prostaglandin.

### LIỀU DÙNG VÀ CÁCH DÙNG

#### Liều khuyến cáo và hiệu chỉnh liều

Liều dùng của brinzolamid 1% (AZOPT) để điều trị tăng nhãn áp cho bệnh nhân người lớn bị tăng nhãn áp hoặc glôcôm góc mở như sau:

- Nhỏ 1 giọt hỗn dịch AZOPT vào mắt bị bệnh, 2-3 lần mỗi ngày. Nếu quên một liều, nên tiếp tục điều trị với liều tiếp theo theo kế hoạch. Không nên nhỏ quá 1 giọt/lần vào mắt bị bệnh 2-3 lần mỗi ngày.

Khi dùng AZOPT thay thế cho một thuốc điều trị glôcôm khác, phải ngưng dùng các thuốc đó một ngày rồi mới bắt đầu dùng AZOPT vào ngày kế tiếp. Nếu bệnh nhân sử dụng đồng thời nhiều hơn một thuốc nhỏ mắt, các thuốc cần phải được nhỏ mắt cách nhau ít nhất là 10 phút.

#### Sử dụng ở trẻ em

Chưa thiết lập được hiệu quả và tính an toàn của brinzolamid 1% ở bệnh nhân dưới 18 tuổi và không khuyến cáo sử dụng cho đối tượng này.

#### Sử dụng ở người suy gan và suy thận

Brinzolamid chưa được nghiên cứu trên bệnh nhân suy gan và vì vậy không khuyến cáo sử dụng cho đối tượng này.

Thuốc chưa được nghiên cứu trên bệnh nhân suy thận nặng (độ thanh thải creatinin < 30 ml/phút) hoặc các bệnh nhân nhiễm toan chuyển hóa tăng do huyết. Vì brinzolamid và các chất chuyển hóa chính được thải trừ chủ yếu qua thận, do đó chống chỉ định sử dụng AZOPT trên những bệnh nhân này (xem mục CHỐNG CHỈ ĐỊNH).

#### Sử dụng ở người cao tuổi

Không quan sát thấy sự khác biệt nói chung về hiệu quả và độ an toàn giữa người già và người trẻ. Không cần hiệu chỉnh liều khi dùng thuốc cho người cao tuổi.

#### Cách dùng

##### Lắc kỹ lọ thuốc trước khi dùng. Chỉ dùng để nhỏ mắt.

Để tránh tạp nhiễm vào đầu nhỏ thuốc và hỗn dịch thuốc, cần thận trọng không được để đầu nhỏ thuốc của lọ thuốc tiếp xúc với mí mắt, vùng xung quanh mắt hoặc bất cứ vật nào.

Cần ấn vào ống lệ mũi hoặc nhắm mắt lại sau khi nhỏ thuốc. Điều này sẽ hạn chế sự hấp thu thuốc toàn thân qua mắt và giúp giảm các phản ứng bất lợi toàn thân.

Sau khi mở nắp, nếu vòng gắn đảm bảo bị rời ra, cần loại bỏ nó đi trước khi dùng thuốc.

### CHỐNG CHỈ ĐỊNH

- Bệnh nhân mẫn cảm với brinzolamid hoặc bất kỳ thành phần nào của thuốc hoặc các sulphonamid.
- Bệnh nhân suy thận nặng.
- Nhiễm toan chuyển hóa tăng clo huyết.

### CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG

- Các phản ứng quá mẫn thường gặp với các dẫn chất sulphonamid có thể xảy ra trên bệnh nhân dùng thuốc nhỏ mắt AZOPT vì thuốc có hấp thu toàn thân. Ngưng sử dụng thuốc nếu có các dấu hiệu của các phản ứng phụ nghiêm trọng hoặc xảy ra quá mẫn.
- Đã có báo cáo về các rối loạn cân bằng acid-base với các thuốc ức chế carbonic anhydrase dùng đường uống. Sử dụng thận trọng với các bệnh nhân có nguy cơ suy thận do có thể có nguy cơ nhiễm acid chuyển hóa.
- Chưa có nghiên cứu về vai trò có thể của brinzolamid trên chức năng nội mô giác mạc ở bệnh nhân có tổn thương giác mạc (đặc biệt trên bệnh nhân có lượng tế bào nội mô thấp).
- Khuyến cáo giám sát cẩn thận các bệnh nhân bị tổn thương giác mạc, như bệnh nhân bị đái tháo đường hay loạn dưỡng giác mạc.
- Hỗn dịch nhỏ mắt AZOPT chứa benzalkonium clorid có thể gây kích ứng mắt và làm biến màu kính áp tròng mềm. Tránh để dịch thuốc tiếp xúc với kính áp tròng mềm. Phải hướng dẫn bệnh nhân tháo kính áp tròng trước khi sử dụng hỗn dịch nhỏ mắt AZOPT và chờ ít nhất 15 phút trước khi đeo lại.

### TƯƠNG TÁC THUỐC

- Các nghiên cứu về tương tác cụ thể giữa AZOPT và các thuốc khác chưa được thực hiện.
- Trong các thử nghiệm lâm sàng, không có bằng chứng về các tương tác bất lợi khi sử dụng đồng thời AZOPT với các chất tương tự prostaglandin và các chế phẩm nhỏ mắt chứa timolol. Sự phối hợp giữa AZOPT và các thuốc có đồng trị hoặc các thuốc

chủ vận adrenergic trong suốt liệu pháp điều trị hỗ trợ bệnh glôcôm chưa được đánh giá.

- AZOPT là thuốc ức chế carbonic anhydrase và mặc dù dùng tại chỗ, thuốc được hấp thu toàn thân. Đã có báo cáo về các rối loạn cân bằng acid-base với các thuốc ức chế carbonic anhydrase đường uống. Phải xem xét đến khả năng tương tác thuốc trên các bệnh nhân dùng hỗn dịch nhỏ mắt AZOPT.
- Có thể có tác dụng phụ ngoài tác dụng toàn thân đã biết của việc ức chế carbonic anhydrase ở những bệnh nhân dùng thuốc ức chế CA đường uống và AZOPT. Không khuyến cáo dùng đồng thời AZOPT và các thuốc ức chế CA đường uống.
- Các isozym cytochrom P-450 có vai trò trong chuyển hóa brinzolamid bao gồm CYP3A4 (vai trò chính), CYP2A6, CYP2C8 và CYP2C9. Các chất ức chế CYP3A4 như ketoconazol, itraconazol, clotrimazol, ritonavir và troleanomycin được dự đoán sẽ ức chế quá trình chuyển hóa brinzolamid thông qua CYP3A4. Do đó cần thận trọng khi sử dụng đồng thời với các chất ức chế CYP3A4. Đường như không có sự tích lũy của brinzolamid do thuốc thải trừ chính qua thận. Brinzolamid không phải là chất ức chế isozym cytochrom P-450.

### PHỤ NỮ CÓ THAI, CHO CON BÚ VÀ KHẢ NĂNG SINH SẢN

#### Phụ nữ có thai

Chưa có dữ liệu hoặc dữ liệu còn hạn chế về việc sử dụng thuốc nhỏ mắt brinzolamid trên phụ nữ mang thai.

Các nghiên cứu với brinzolamid trên động vật cho thấy có độc tính liều lặp lại sau khi dùng thuốc đường toàn thân (Xem mục DỮ LIỆU AN TOÀN TIỀN LÂM SÀNG).

Không khuyến cáo sử dụng AZOPT cho phụ nữ mang thai và phụ nữ có khả năng mang thai không dùng biện pháp tránh thai.

#### Phụ nữ cho con bú

Chưa rõ brinzolamid và các chất chuyển hóa của thuốc có bài tiết qua sữa mẹ sau khi nhỏ thuốc hay không; tuy nhiên, nguy cơ đối với trẻ bú mẹ không được loại trừ. Các nghiên cứu trên động vật sau khi dùng đường uống, brinzolamid được phát hiện trong sữa ở mức tối thiểu.

Không thể loại trừ nguy cơ đối với trẻ sơ sinh. Cần quyết định liệu có nên ngưng cho trẻ bú mẹ hoặc ngưng điều trị AZOPT ở mẹ dựa trên cân nhắc về lợi ích khi cho trẻ bú mẹ và lợi ích điều trị của mẹ.

#### Khả năng sinh sản

Các nghiên cứu trên động vật đã chứng minh rằng brinzolamid không ảnh hưởng đến khả năng sinh sản. Chưa có nghiên cứu được thực hiện để đánh giá ảnh hưởng của việc dùng thuốc nhỏ mắt brinzolamid trên khả năng sinh sản ở người.

### ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC ĐỐI VỚI CÔNG VIỆC

Nhìn mờ tạm thời hoặc những rối loạn khác về thị lực có thể ảnh hưởng đến khả năng lái xe hay vận hành máy móc.

Nếu bị nhìn mờ sau khi nhỏ mắt, bệnh nhân phải chờ cho tới khi nhìn rõ lại rồi mới được lái xe và vận hành máy móc.

Ngoài ra, đã có báo cáo về các rối loạn thần kinh khi sử dụng thuốc, có thể ảnh hưởng đến khả năng lái xe hay vận hành máy móc (xem mục PHẢN ỨNG BẤT LỢI).

### PHẢN ỨNG BẤT LỢI

#### Tóm tắt dữ liệu an toàn

Trong các nghiên cứu lâm sàng bao gồm 2732 bệnh nhân được điều trị bằng AZOPT dưới dạng đơn trị liệu hoặc điều trị hỗ trợ với timolol maleat 5 mg/ml, các phản ứng bất lợi hay gặp nhất liên quan tới điều trị được báo cáo bao gồm: thay đổi vị giác (6%) (vị đắng hoặc vị bất thường, xem mô tả bên dưới) và nhìn mờ tạm thời sau khi nhỏ thuốc (5,4%), kéo dài từ vài giây tới vài phút (xem mục ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC ĐẾN CÔNG VIỆC).

#### Bảng tóm tắt các phản ứng bất lợi

Các phản ứng bất lợi sau đã được báo cáo qua các thử nghiệm lâm sàng với hỗn dịch nhỏ mắt AZOPT và được phân loại theo quy ước như sau:

Rất thường gặp ( $\geq 1/10$ ), thường gặp ( $\geq 1/100$  đến  $<1/10$ ), ít gặp ( $\geq 1/1.000$  đến  $<1/100$ ), hiếm gặp ( $\geq 1/10.000$  đến  $<1/1.000$ ) và rất hiếm gặp ( $<1/10.000$ ), hoặc chưa rõ (không thể ước tính từ các dữ liệu có sẵn). Trong mỗi nhóm tần suất, các phản ứng bất lợi được trình bày theo thứ tự độ nghiêm trọng giảm dần. Các phản ứng bất lợi được báo cáo từ các thử nghiệm lâm sàng và các báo cáo tự phát hậu mãi.

Phân loại hệ cơ quan	Phản ứng bất lợi Thuật ngữ của MedDRA (phiên bản 15.1)
Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng	<i>Ít gặp:</i> viêm mũi họng, viêm họng, viêm xoang. <i>Chưa rõ:</i> viêm mũi.
Rối loạn máu và hệ bạch huyết	<i>Ít gặp:</i> giảm hồng cầu, tăng clo máu
Rối loạn hệ thống miễn dịch	<i>Chưa rõ:</i> quá mẫn
Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng	<i>Chưa rõ:</i> giảm thèm ăn
Rối loạn tâm thần	<i>Ít gặp:</i> thờ ơ, trầm cảm, chán nản, giảm ham muốn tình dục, ác mộng, căng thẳng <i>Hiếm gặp:</i> mất ngủ
Rối loạn thần kinh	<i>Ít gặp:</i> rối loạn chức năng vận động, mất trí nhớ, chóng mặt, dị cảm, đau đầu. <i>Hiếm gặp:</i> suy giảm trí nhớ, buồn ngủ <i>Chưa rõ:</i> run, giảm cảm giác, mất vị giác

Rối loạn mắt	<b>Thường gặp:</b> nhìn mờ, kích ứng mắt, đau mắt, cảm giác có vật lạ ở mắt, sung huyết mắt. <b>Ít gặp:</b> mòn giác mạc, viêm giác mạc, viêm giác mạc chấm, bệnh giác mạc, lắng cặn ở mắt, đổi màu giác mạc, viêm loét biểu mô giác mạc, rối loạn biểu mô giác mạc, viêm bờ mi, ngứa mắt, viêm kết mạc, sung mắt, viêm tuyến bã, chói mắt, chứng sợ ánh sáng, khô mắt, viêm kết mạc dị ứng, mộng mắt, sắc tố cụp mắt, mỏi mắt, khó chịu ở mắt, cảm giác bất thường trong mắt, hội chứng khô mắt, u nang giác mạc, sung huyết kết mạc, ngứa mi mắt, tiết gỉ mắt, bờ mi đóng vảy, tăng chảy nước mắt. <b>Hiếm gặp:</b> phù giác mạc, nhìn đôi, giảm thị lực, lóa mắt, giảm cảm giác ở mắt, phù quanh hốc mắt, tăng áp lực nội nhãn, tăng tỉ lệ lõm/đĩa ở mắt. <b>Chưa rõ:</b> rối loạn giác mạc, rối loạn thị giác, dị ứng mắt, chứng rung lỏng mi, rối loạn mi mắt, đỏ xung quanh mí mắt.
Rối loạn tai và méo đạo	<b>Hiếm gặp:</b> ù tai <b>Chưa rõ:</b> chóng mặt
Rối loạn tim	<b>Ít gặp:</b> suy tim-hở hấp, chậm nhịp tim, đánh trống ngực <b>Hiếm gặp:</b> đau thắt ngực, nhịp tim bất thường <b>Chưa rõ:</b> loạn nhịp tim, nhịp tim nhanh, cao huyết áp, tăng huyết áp, giảm huyết áp, tăng nhịp tim
Rối loạn hô hấp, ngực và trung thất	<b>Ít gặp:</b> khó thở, chảy máu cam, đau hầu họng, đau hầu-thanh quản, rát cổ họng, triệu chứng ho đường hô hấp trên, chảy nước mũi, hắt hơi <b>Hiếm gặp:</b> phế quản mãn tính, tắc nghẽn đường hô hấp trên, nghẹt xoang, nghẹt mũi, ho, khó mũi <b>Chưa rõ:</b> hen
Rối loạn tiêu hóa	<b>Thường gặp:</b> loạn vị giác <b>Ít gặp:</b> viêm thực quản, tiêu chảy, buồn nôn, nôn, khó tiêu, đau bụng trên, khó chịu ở bụng, khó chịu ở dạ dày, đầy hơi, hay bị tiêu chảy, rối loạn tiêu hóa, giảm cảm giác ở miệng, dị cảm miệng, khó miệng <b>Chưa rõ:</b> kiểm tra chức năng gan bất thường
Rối loạn gan-mật	<b>Chưa rõ:</b> kiểm tra chức năng gan bất thường
Rối loạn da và mô dưới da	<b>Ít gặp:</b> ban đỏ, phát ban có mụn đỏ ở da, cầng da <b>Hiếm gặp:</b> nổi mề đay, rụng tóc, ngứa toàn thân <b>Chưa rõ:</b> viêm da, phát ban
Rối loạn cơ xương và mô liên kết	<b>Ít gặp:</b> đau lưng, co thắt cơ, đau cơ <b>Chưa rõ:</b> đau khớp, đau đầu chi
Rối loạn thận và tiết niệu	<b>Ít gặp:</b> đau thận <b>Chưa rõ:</b> đa niệu
Rối loạn hệ sinh sản và vú	<b>Ít gặp:</b> rối loạn chức năng cương dương
Rối loạn toàn thân và tại chỗ dùng thuốc	<b>Ít gặp:</b> đau, bất thường ở ngực, suy nhược, cảm giác bất thường <b>Hiếm gặp:</b> đau ngực, cảm giác bồn chồn, mệt mỏi, bú rít <b>Chưa rõ:</b> phù ngoại biên, khó chịu
Chấn thương, ngộ độc và các biến chứng	<b>Ít gặp:</b> cảm giác có vật lạ ở mắt

#### Mô tả các phản ứng bất lợi chọn lọc

Loạn vị giác (vị đắng hoặc bất thường trong miệng sau khi nhỏ thuốc) là phản ứng bất lợi toàn thân thường gặp nhất liên quan đến sử dụng thuốc nhỏ mắt AZOPT trong các thử nghiệm lâm sàng. Phản ứng này xảy ra do thuốc đi qua ống lệ mũi. Ấn vào ống lệ mũi hoặc nhắm mắt sau khi nhỏ thuốc có thể làm giảm phản ứng bất lợi này (xem mục LIỀU DÙNG VÀ CÁCH DÙNG).

Thuốc nhỏ mắt AZOPT là một dẫn chất sulphonamid có tác dụng ức chế carbonic anhydrase được hấp thu toàn thân. Các tác dụng trên hệ tiêu hóa, hệ thần kinh, huyết học, thận và chuyển hóa liên quan chủ yếu đến các chất ức chế carbonic anhydrase toàn thân. Các phản ứng bất lợi tương tự do các chất ức chế carbonic anhydrase gây ra có thể xuất hiện khi nhỏ mắt. Khi sử dụng AZOPT như một liệu pháp điều trị bổ trợ với travoprost, không thấy xuất hiện các phản ứng bất lợi không mong đợi. Các phản ứng bất lợi trong liệu pháp điều trị bổ trợ xuất hiện khi sử dụng mỗi hoạt chất riêng lẻ.

#### Trẻ em

Trong các thử nghiệm lâm sàng nhỏ, ngắn hạn, xấp xỉ 12,5% bệnh nhân nhi xuất hiện các phản ứng bất lợi, chủ yếu là phản ứng bất lợi tại chỗ, phản ứng ở mắt không nghiêm trọng như sung huyết kết mạc, ngứa mắt, tiết gỉ mắt và tăng chảy nước mắt (xem mục ĐẶC TÍNH ĐƯỢC LỰC HỌC).

#### Báo cáo các phản ứng bất lợi nghiêm trọng

Việc báo cáo các phản ứng bất lợi nghi ngờ là rất quan trọng sau khi thuốc được lưu hành. Điều này cho phép tiếp tục theo dõi sự cân bằng lợi ích/nguy cơ của thuốc. Yêu cầu các nhân viên y tế báo cáo bất kỳ phản ứng bất lợi nghi ngờ thông qua hệ thống báo cáo quốc gia được liệt kê dưới đây:

#### Việt Nam:

Trung tâm Quốc gia về Thông tin thuốc và Theo dõi phản ứng có hại của thuốc

13-15 Lê Thánh Tông, Quận Hoàn Kiếm, Hà Nội

Điện thoại: 024 39335618

Fax: 024 39335642

Website: <http://canhgiacduoc.org.vn>

Email: [di.pcenter@gmail.com](mailto:di.pcenter@gmail.com)

**Thông báo cho bác sĩ hoặc dược sĩ của bạn những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc**



#### QUẢ LIỀU

Chưa có trường hợp quả liều nào được báo cáo.

Cần phối hợp điều trị triệu chứng, điều trị hỗ trợ.

Có thể xảy ra mất cân bằng điện giải, phát triển trạng thái nhiễm toan chuyển hóa, và những ảnh hưởng trên hệ thần kinh. Phải theo dõi mức điện giải huyết tương (đặc biệt là mức kali) và độ pH máu.

#### ĐẶC TÍNH ĐƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: thuốc chống tăng nhãn áp và ức chế carbonic anhydrase, co đồng tử.

Mã ATC: S01EC04

#### Cơ chế tác dụng

Carbonic anhydrase (CA) là một men có trong nhiều loại mô của cơ thể kể cả mắt. Carbonic anhydrase xúc tác các phản ứng thuận nghịch gồm phản ứng hydrat hoá carbon dioxide và phản ứng khử nước của acid carbonic.

Sự ức chế carbonic anhydrase ở tua thể mi ở mắt làm giảm tiết thủy dịch, điều này có thể được cho là bằng cách làm chậm sự hình thành các ion bicarbonat tiếp theo với sự giảm chuyển vận ion natri và dịch. Kết quả là làm giảm áp lực nội nhãn (IOP) - một yếu tố nguy cơ chủ yếu trong quá trình sinh bệnh học của tổn thương thần kinh thị giác và mất thị trường ở bệnh glôcôm. Brinzolamid ức chế carbonic anhydrase II (CA-II), là isoenzym chủ yếu ở mắt, với chỉ số kháng CA-II trên in vitro IC50 là 3,2 nM và Ki là 0,13 nM.

#### Tính an toàn và hiệu quả lâm sàng

Đã nghiên cứu về hiệu quả giảm áp lực nội nhãn của AZOPT như một điều trị hỗ trợ cho travoprost, là một chất tương tự prostaglandin. Sau 4 tuần sử dụng travoprost, các bệnh nhân có áp lực nội nhãn  $\geq 19$  mmHg được lựa chọn ngẫu nhiên để điều trị thêm với brinzolamid hoặc timolol. Quan sát thấy sự giảm thêm trung bình áp lực nội nhãn hàng ngày từ 3,2 đến 3,4 mmHg với nhóm điều trị với brinzolamid và 3,2 đến 4,2 mmHg với nhóm điều trị với timolol. Ở nhóm điều trị brinzolamid/travoprost, có một tỷ lệ chung cao hơn các phản ứng bất lợi không nghiêm trọng ở mắt, chủ yếu liên quan đến các dấu hiệu kích ứng tại chỗ. Các phản ứng này nhẹ và không ảnh hưởng đến tỉ lệ ngừng sử dụng thuốc nói chung trong nghiên cứu.

Một thử nghiệm lâm sàng tiến hành với AZOPT trên 32 bệnh nhân nhi dưới 6 tuổi, được chẩn đoán bị glôcôm hoặc tăng nhãn áp. Một số bệnh nhân chưa từng được điều trị tăng nhãn áp trong khi các bệnh nhân khác đã điều trị với các thuốc hạ nhãn áp khác nhau. Những bệnh nhân đang được điều trị với thuốc tăng nhãn áp trước đó không cần ngừng thuốc cho đến khi bắt đầu điều trị với AZOPT.

Trong số các bệnh nhân chưa từng được điều trị tăng nhãn áp (10 bệnh nhân), hiệu quả của AZOPT tương tự như đã thấy trước đó trên người lớn, với nhãn áp trung bình giảm so với ban đầu lên đến 5 mmHg. Trong nhóm bệnh nhân đang điều trị với thuốc giảm nhãn áp (22 bệnh nhân), nhãn áp trung bình tăng nhẹ so với mức cơ bản ở nhóm điều trị với AZOPT.

#### ĐẶC TÍNH ĐƯỢC ĐỘNG HỌC

##### Hấp thu

Sau khi nhỏ thuốc nhỏ mắt AZOPT, brinzolamid được hấp thu vào hệ tuần hoàn và tích lũy trong các tế bào hồng cầu (RBCs) với thời gian bán thải là 111 ngày. Nồng độ brinzolamid trong các tế bào hồng cầu sau thời gian dài uống và nhỏ mắt đạt tới nồng độ bão hòa trung bình là 20  $\mu$ M. Nồng độ brinzolamid này tương tự với nồng độ trong hồng cầu (22-27  $\mu$ M) đạt được sau khi uống liều brinzolamid 1mg, ngày 2 lần trong 32 tuần. Ngoài ra, chất chuyển hóa N-desacetyl brinzolamid cũng tích lũy trong các tế bào hồng cầu sau khi nhỏ mắt và uống thuốc. Tuy nhiên, mức độ ức chế carbonic anhydrase ở mức bão hòa này không đủ có tác dụng toàn thân. Ngoài ra, nồng độ brinzolamid và N-desacetyl brinzolamid trong huyết tương sau khi nhỏ mắt liều AZOPT thường gần hoặc dưới giới hạn định lượng.

##### Phân bố

Brinzolamid gắn kết vừa phải với protein huyết tương (khoảng 60%); do đó nguy cơ tương tác với các thuốc khác mà cũng gắn kết với protein huyết tương là thấp. Dựa trên các nghiên cứu trên thỏ lông trắng hoặc thỏ lông màu cho thấy brinzolamid gắn kết vừa phải với melanin. Tuy nhiên, thời gian bán thải của brinzolamid trên các mô của thỏ bị ảnh hưởng nhiều hơn bởi sự gắn kết hồng cầu so với gắn kết melanin.

Trên thỏ, sau khi nhỏ mắt AZOPT, brinzolamid được phân bố vào các mô của mắt. Sau nhiều liều dùng, nồng độ ở các mô tiền phòng cao hơn so với các mô hậu phòng; trong khi đó sau khi dùng nhiều liều, thuốc tích lũy trong nhiều mô của mắt, do ái lực cao và gắn chặt với enzym carbonic anhydrase II. Điều này dẫn đến kéo dài thời gian bán thải ở con người - thể mi, màng mạch, võng mạc và thấu kính tương tự như thời gian bán thải trong máu (ngoại trừ ở thấu kính có kéo dài thời gian bán thải hơn trong máu). Sau nhiều liều dùng, sự tích lũy brinzolamid trong các mô hậu phòng như võng mạc và màng mạch là kết quả của sự lưu thông máu trong các mô này, kết quả là kéo dài thời gian  $T_{max}$  cũng như thời gian bán thải.