

(新聞発表用)

製剤：輸入

1	販 売 名	ベガモックス点眼液 0.5%
2	一 般 名	塩酸モキシフロキサシン
3	申 請 者 名	日本アルコン株式会社
4	成分・含量	1mL 中、塩酸モキシフロキサシン 5.45mg (モキシフロキサシンとして 5mg) 含有
5	用法・用量	<眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎 (角膜潰瘍を含む)> 通常、1回1滴、1日3回点眼する。なお、症状により適宜増減する。  <眼科周術期の無菌化療法> 通常、手術前は1回1滴、1日5回、手術後は1回1滴、1日3回点眼する。
6	効能・効果	<適応菌種> 本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、マイクロコッカス属、モラクセラ属、コリネバクテリウム属、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、インフルエンザ菌、シュードモナス属、バークホルデリア・セパシア、ステノトロホモナス (ザントモナス)・マルトフィリア、アシネトバクター属、アクネ菌  <適応症> 眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎 (角膜潰瘍を含む)、眼科周術期の無菌化療法
7	備 考	本剤はニューキノロン系抗菌点眼剤である。 添付文書 (案) は別紙のとおり

## 広範囲抗菌点眼剤

貯法	室温保存
使用期限	外箱及びラベルに表示（x年）

指定医薬品  
処方せん医薬品<sup>※</sup>

ベガモックス<sup>TM</sup>点眼液 0.5%

承認番号	
薬価基準収載年月	200x年xx月
販売開始年月	200x年xx月
国際誕生年月	2003年4月

VEGAMOX<sup>TM</sup> Ophthalmic Solution 0.5%

(塩酸モキシフロキサシン点眼液)

## 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

本剤の成分又はキノロン系抗菌剤に対し過敏症の既往歴のある患者

## 【組成・性状】

販売名	ベガモックス <sup>TM</sup> 点眼液 0.5%
有効成分の名称	塩酸モキシフロキサシン
1 mL 中含量	5.45 mg (モキシフロキサシンとして 5 mg)
添加物	ホウ酸、等張化剤、pH 調節剤 2 成分
pH	6.3~7.3
浸透圧比	0.9~1.1 (0.9%塩化ナトリウム液に対する比)
色調・性状	淡黄色～緑黄色澄明の無菌水性点眼液

## 【効能・効果】

## 〈適応菌種〉

本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、ミクロコッカス属、モラクセラ属、コリネバクテリウム属、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、インフルエンザ菌、シュードモナス属、バークホルデリア・セバシア、ステノトロホモナス（ザントモナス）・マルトフィリア、アシネトバクター属、アクネ菌

## 〈適応症〉

眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、眼科周術期の無菌化療法

## 〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

本剤が適応を有さない菌種による感染が疑われる場合には、原則として起炎菌の確認等を行うことにより、本剤使用の是非を検討することが望ましい。

## 【用法・用量】

[眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）]

通常、1回1滴、1日3回点眼する。なお、症状により適宜増減する。

## [眼科周術期の無菌化療法]

通常、手術前は1回1滴、1日5回、手術後は1回1滴、1日3回点眼する。

## 〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。

## 【使用上の注意】

## 1. 副作用

承認時までの国内で実施した臨床試験で、総症例 586 例中 32 例（5.5%）に副作用が認められた。主な副作用は、眼痛（しみる）18 件（3.1%）、味覚異常（苦味）8 件（1.4%）、眼充血 3 件（0.5%）、眼刺激 2 件（0.3%）であった。なお、これらの総症例の中に乳児、幼児又は小児（41 日齢以上 12 歳未満）42 例が含まれており、副作用は 42 例中 3 例（7.1%）に認められ、眼痛（しみる）2 件（4.8%）、味覚異常（苦味）1 件（2.4%）であった。

## (1) 重大な副作用

ショック、アナフィラキシー様症状：経口剤でショック、アナフィラキシー様症状（頻度不明）があらわれるとの報告があるので、観察を十分に行い、紅斑、発疹、呼吸困難、血圧低下、眼瞼浮腫等の症状が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

## (2) その他の副作用

次のような症状又は異常があらわれた場合には、投与を中止するなどの適切な処置を行うこと。

種類/頻度	1~5%未満	0.1~1%未満
眼	眼痛（しみる）	充血、刺激、角膜炎、異物感、眼瞼紅斑、霧視
その他	味覚異常（苦味）	投与部位異常感覚

## 2. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳中の婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中及び授乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

## 3. 小児等への投与

低出生体重児又は新生児に対する安全性は確立していない（国内における使用経験がない。【臨床成績】の項参照）。

## 4. 適用上の注意

## (1) 投与経路

点眼用のみ使用すること。

## (2) 投与时

点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。

## (3) 投与間隔

他の点眼剤と併用する場合は、間隔を 5 分以上あけるように指導すること。

## 【薬物動態】

1. 血中濃度<sup>1), 2)</sup>

健康成人（日本人 n=7）に 0.5%モキシフロキサシン点眼液を両眼に 1 回 1 滴、1 日 3 回、14 日間点眼したときの血漿中モキシフロキサシン濃度を測定したところ、14 日目点眼後の C<sub>max</sub> は 1.67 ± 0.79 ng/mL（平均 ± SD）であり、T<sub>max</sub> は 0.54 ± 0.34 時間（平均 ± SD）であった。また、健康成人（日本人 n=7）に 0.5%モキシフロキサシン点眼液を右眼に 1 回 1

注）注意—医師等の処方せんにより使用すること

滴、1日8回、14日間点眼したときの血漿中モキシフロキサシン濃度を測定したところ、14日目点眼後のC<sub>max</sub>は1.95±1.00 ng/mL(平均±SD)であり、T<sub>max</sub>は0.50±0.27時間(平均±SD)であった。

## 2. 涙液中濃度<sup>9)</sup>

健常成人(外国人 n=27)に0.5%モキシフロキサシン点眼液を両眼に1回1滴、1日3回、3日間及び4日目1回1滴、1日1回点眼したときの1日目初回点眼後と4日目最終点眼後の涙液中モキシフロキサシン濃度推移は図1のとおりである。投与8時間後のモキシフロキサシンの平均涙液中濃度は1日目初回点眼後が2.35 µg/mL、4日目最終点眼後が1.25 µg/mLであった。

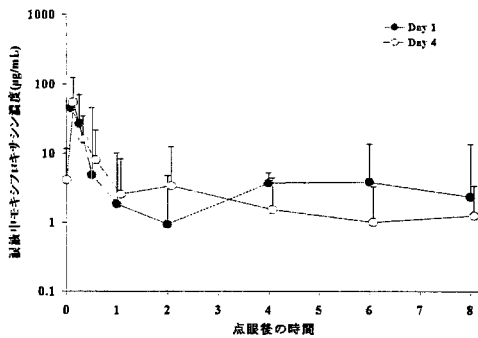


図1 健常成人への0.5%モキシフロキサシン点眼液1日目初回点眼後および4日目最終点眼後の涙液中濃度推移

(参考)

## 3. 眼組織濃度(有色ウサギ)<sup>4)</sup>

有色ウサギを用いて0.3%モキシフロキサシン点眼液を単回点眼投与したときの房水、角膜及び虹彩・毛様体のC<sub>max</sub>はそれぞれ1.78±0.39 µg/g(平均±SD)、12.5±3.8 µg/g(平均±SD)及び10.4±5.6 µg/g(平均±SD)となり、モキシフロキサシンは眼組織中で高い濃度を示した。また、血漿中への移行は低く、最大血漿中濃度は0.013±0.002 µg/g(平均±SD)であった。

## 【臨床成績】

### 1. 疾患別臨床効果<sup>5), 6), 7)</sup>

二重遮蔽比較試験を含む外眼感染症を対象に実施した388例(日本人)における本剤の疾患別臨床効果は以下のとおりである。なお、用法・用量は1回1滴、1日3回であった。ただし、角膜炎(角膜潰瘍を含む)を対象にしたときは1日3回～8回とした。有効率は初診時起炎菌の消失、主症状消失及び臨床症状スコア合計から評価された(眼科的併用療法は可とした)。

疾患名	有効率 [有効以上] (症例数)	主症状
眼瞼炎	96.2% (25/26)	睫毛根部の分泌物、眼瞼発赤、結膜充血
涙嚢炎	87.5% (14/16)	流涙、眼脂、膿汁逆流、涙嚢部の発赤、涙嚢部の腫脹
麦粒腫	89.6% (43/48)	眼瞼発赤、眼瞼腫脹、眼痛
結膜炎	96.7% (260/269)	眼脂、結膜充血
瞼板腺炎	89.5% (17/19)	瞼板腺の発赤、瞼板腺の腫脹、膿点
角膜炎 (角膜潰瘍を含む)	90.0% (9/10)	角膜混濁

本剤の臨床試験での388例には、乳児、幼児又は小児患者(41日齢～12歳未満)38例が含まれ、その有効率は97.4%(37/38例)であった。

### 2. 眼科周術期の無菌化療法に対する効果<sup>8)</sup>

内眼手術予定患者を対象とした無菌化療法試験(日本人)において、手術前の無菌化率は85.0%(68/80例)であった。また、手術後15日目の無菌率は98.9%(92/93例)で、術後感染症(眼内炎)を発症した症例はなかった。なお、用法及び用量を手術前は1回1滴、1日5回、手術後は1回1滴、1日3回点眼とした。

### 3. 海外臨床試験における新生児・乳幼児(2歳未満)の成績

海外臨床試験において、新生児100例、乳幼児66例に本剤が使用された結果、有効率(眼脂及び充血が消失した症例の割合)は83.5%(96/115例)、副作用発現率は1.8%(3/166例)であり、発現した副作用は眼充血、眼瞼浮腫であった。

## 【薬効薬理】

### 1. 作用機序<sup>9), 10)</sup>

モキシフロキサシンの主な作用機序は、II型トポイソメラーゼ(DNAジャイレース及びトポイソメラーゼIV)を阻害することにより核酸合成を阻害し、抗菌効果を示す。

### 2. 抗菌作用

#### (1) 抗菌作用

モキシフロキサシンは幅広い抗菌スペクトルを有し、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、マイクロコッカス属、モラクセラ属、コリネバクテリウム属、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、インフルエンザ菌、シュードモナス属、パークホルデリア・セバシア、ステノトロホモナス(ザントモナス)・マルトフィリア、アシネトバクター属、アクネ菌に対して抗菌力を示した(in vitro)。

#### (2) 実験的感染症モデルに対する効果<sup>11), 12)</sup>

黄色ブドウ球菌、緑膿菌及びセラチア菌感染ウサギ角膜炎モデルにおいて、モキシフロキサシン点眼液は無治療群に対し、有意に生菌数の減少を認めた。

## 【有効成分の理化学的知見】

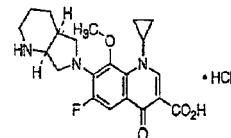
一般名：塩酸モキシフロキサシン

(Moxifloxacin Hydrochloride)

略号：MFLX

化学名：1-Cyclopropyl-6-fluoro-8-methoxy-7-[(4a*S*,7a*S*)-octahydropyrrolo[3,4-*b*]pyridin-6-yl]-4-oxo-1,4-dihydroquinoline-3-carboxylic acid monohydrochloride

構造式：



分子式：C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>·HCl

分子量：437.89

性状：淡黄色～黄色の結晶性の粉末で、水又はメタノールにやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくい。

## 【包装】

5mL×10本

### 【主要文献】

- 1) 社内資料
- 2) 社内資料
- 3) 社内資料
- 4) 社内資料
- 5) 社内資料
- 6) 社内資料
- 7) 社内資料
- 8) 社内資料
- 9) Maxwell A et al. : Mode of action. In: Kuhlmann J, Dalhoff A, Zeiler H-J, editors. Quinolone Antibacterials. Berlin: Springer Verlag; 119-166, 1998
- 10) Schedletzky H, et al.: J Antimicrob Chemother., 43(Suppl B), 31-37, 1999
- 11) Brett A. Thibodeaux, et al. : Current Eye Research., 28(5), 337-342, 2004
- 12) Joseph J Dajcs, et al. : Antimicrob. Agents Chemother., 48(6), 1948-1952, 2004

### 【文献請求先】

日本アルコン株式会社 学術情報室  
〒107-0052 東京都港区赤坂 2-17-7  
電話 03-3588-3221  
FAX 03-3588-3229  
受付時間 9:00~17:30 (土、日、祝日、社休日を除く)

**Alcon**<sup>®</sup>  
JAPAN  
© 200X Alcon, Inc

製造販売元(輸入元)  
日本アルコン株式会社  
東京都港区赤坂 2-17-7