

ヘルペス性角膜炎化学療法剤  
日本薬局方

承認番号	21900AMX00026000
薬価収載	2007年6月
販売開始	1985年10月
再審査結果	1992年12月

# アシクロビル眼軟膏

# ゾビラックス®眼軟膏3%

貯 法：高温を避け、室温保存  
使用期限：包装に表示



**【禁 忌】**(次の患者には投与しないこと)  
本剤の成分あるいはバラシクロビル塩酸塩に対し過敏症の既往歴のある患者

## 【組成・性状】

- 組成  
本剤は、1g中に日局アシクロビル30mgを含有する。  
添加物として白色ワセリンを含有する。
- 性状  
白色の軟膏剤で、においはない。日局無菌試験に適合する。

## 【効能・効果】

単純ヘルペスウイルスに起因する角膜炎

## 【用法・用量】

通常、適量を1日5回塗布する。なお、症状により適宜回数を減じる。

## 【使用上の注意】

- 重要な基本的注意  
本剤を7日間使用し、改善の兆しが見られないか、あるいは悪化する場合には、他の治療に切り替えること。また、投与を継続する場合は副作用の発現に十分注意し、長期投与はできるだけ避けること。
- 副作用  
総症例1547例中、副作用が報告されたのは210例(13.57%)であり、主な副作用はびまん性表在性角膜炎等181例(11.70%)、結膜びらん10例(0.65%)であった。(再審査終了時)  
次のような症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	5%以上	0.1%~5%未満	0.1%未満	頻度不明 <sup>注1)</sup>
眼	びまん性表在性角膜炎 <sup>注2)</sup>	結膜炎、角膜潰瘍、結膜びらん、眼瞼炎、一過性刺激		
皮膚			接触皮膚炎	
過敏症				血管浮腫、蕁麻疹

注1) 自発報告又は海外のみで認められている副作用については頻度不明とした。

注2) このような症状があらわれた場合には、必要最小限の使用にとどめるなど適切な処置を行うこと。

## 3. 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。[動物実験(ラット)の妊娠10日目に、母動物に腎障害のあらわれる大量(200mg/kg/day以上)を皮下投与した実験では、胎児に頭部及び尾の異常が認められたと報告されている<sup>1)</sup>。]

## 4. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

## 5. 適用上の注意

- 投与経路：眼科用のみに使用すること。
- 投与時：使用中はコンタクトレンズの着用を避けるように指導すること。[本剤がコンタクトレンズに付着する可能性がある。]

## 【薬物動態】

- 吸収  
健康成人に1日5回14日間塗布した後の血漿中アシクロビル濃度は検出限界以下(<0.23 $\mu$ g/mL)であった。
- 眼房水中移行<sup>注1)</sup>  
白内障患者に5時間毎に4~6回塗布した後の眼房水中アシクロビル濃度は、平均1.7 $\mu$ g/mLであった。<sup>注2)</sup>  
注1) 外国人における成績である。  
注2) ゾビラックス眼軟膏3%の効能・効果は単純ヘルペスウイルスに起因する角膜炎である。

## 【臨床成績】

国内延べ36施設において258例につき実施された臨床試験の結果<sup>3)~5)</sup>

- 単純ヘルペス性角膜炎に対する有効率は91.2%(227/249)、平均潰瘍消失日数は約5.7日であった。
- 単純ヘルペス性角膜炎の初発例及び再発例に対する有効率は、それぞれ92.4%(97/105)及び92.5%(111/120)であった。

## 【薬効薬理】

### 1. 抗ウイルス作用

- アシクロビルは、単純ヘルペスウイルス1型及び2型のin vitroにおける増殖を抑制し、IC<sub>50</sub>はそれぞれ0.01~1.25 $\mu$ g/mL及び0.01~3.20 $\mu$ g/mLであった<sup>6),7)</sup>。
- ウサギの角膜に単純ヘルペスウイルス1型を接種し、3日後から3%アシクロビル眼軟膏を結膜嚢に1日5回塗布した結果、塗布後4日目に角膜潰瘍はほぼ治癒した<sup>8)</sup>。

## 2. 作用機序<sup>9)~12)</sup>

アシクロビルは、単純ヘルペスウイルスが感染した細胞内に入ると、ウイルス性チミジンキナーゼにより一リン酸化された後、細胞性キナーゼによりリン酸化され、アシクロビル三リン酸(ACV-TP)となる。ACV-TPは正常基質であるdGTPと競合してウイルスDNAポリメラーゼによりウイルスDNAの3'末端に取り込まれると、ウイルスDNA鎖の伸長を停止させ、ウイルスDNAの複製を阻害する。

アシクロビルリン酸化の第一段階である一リン酸化は感染細胞内に存在するウイルス性チミジンキナーゼによるため、ウイルス非感染細胞に対する障害性は低いものと考えられる。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

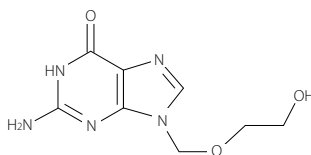
一般名：アシクロビル (Aciclovir)

化学名：2-Amino-9-[(2-hydroxyethoxy)methyl]-1,9-dihydro-6H-purin-6-one

分子式：C<sub>8</sub>H<sub>11</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>

分子量：225.20

化学構造式：



性状：白色～微黄白色の結晶性の粉末である。水に溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。0.1mol/L塩酸試液又は希水酸化ナトリウム試液に溶ける。

### 【包装】

チューブ入り 5g×1

### 【主要文献及び文献請求先】

<主要文献>

- 1) Stahlmann, R., et al. : Infection, **15**, 261-262 (1987) [54653]
- 2) Poirier, R. H., et al. : Arch Ophthalmol, **100**, 1964-1967 (1982) [54649]
- 3) 塩田 洋ほか：臨床眼科, **36**, 1405-1414 (1982) [54650]
- 4) 北野周作ほか：眼科臨床医報, **77**, 1273-1280 (1983) [54651]
- 5) 西田輝夫ほか：日本眼科紀要, **34**, 1173-1178 (1983) [54652]
- 6) Al-Hasani, A. M., et al. : J Antimicrob Chemother, **18** (Suppl. B), 113-119 (1986) [57838]
- 7) McLaren, C., et al. : Am J Med, **73** (1A), 376-379 (1982) [57837]
- 8) Bauer, D. J., et al. : Br J Ophthalmol, **63**, 429-435 (1979) [54645]
- 9) St. Clair, M. H., et al. : Antimicrob Agents Chemother, **18**, 741-745 (1980) [58209]
- 10) Furman, P. A., et al. : J Virol, **32**, 72-77 (1979) [54647]
- 11) Furman, P. A., et al. : Antimicrob Agents Chemother, **20**, 518-524 (1981) [54648]
- 12) Miller, W. H., et al. : J Biol Chem, **255**, 7204-7207 (1980) [58208]

<文献請求先・製品に関するお問い合わせ先>

参天製薬株式会社 製品情報センター

〒530-8552 (個別郵便番号) 大阪市北区大深町4-20

TEL 0120-921-839 06-6321-7056

受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)

販売元

**参天製薬株式会社**

大阪市北区大深町4-20

※※  
※ 製造販売元

**日東メデイック株式会社**

富山県富山市八尾町保内1-14-1