

** 2015年6月改訂(第10版)
* 2012年6月改訂

日本標準商品分類番号	871317
承認番号	21900AMX01095
薬価収載	2007年12月
販売開始	1988年2月
再審査結果	1995年6月
再評価結果	2004年9月

貯 法：【取扱い上の注意】の項参照
* 使用期限：製造後2年(溶解後の使用期限は【取扱い上の注意】の項参照)

** 処方箋医薬品^(注)

セフェム系抗生物質製剤
ベストロン[®]点眼用0.5%
BESTRON[®] FOR OPHTHALMIC 0.5%
眼科用セフメノキシム塩酸塩 (略号：CMX)

**注)注意—医師等の処方箋により
使用すること

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分によるショックの既往歴のある患者

【原則禁忌(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)】

本剤の成分又はセフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

粉末	成分・含量 (1瓶中)	セフメノキシム塩酸塩25mg(力価)
	添加物	乾燥炭酸ナトリウム
	色	白色～帯橙淡黄色
溶解液 (5mL)	添加物 (1mL中)	エドト酸ナトリウム水和物0.2mg パラオキシ安息香酸メチル0.26mg パラオキシ安息香酸プロピル0.14mg ホウ酸、リン酸水素ナトリウム 水和物、リン酸二水素ナトリウム、 塩化ナトリウム
	色	無色澄明
添付の 溶解液 に 溶解後	成分・含量 (1mL中)	セフメノキシム塩酸塩5mg(力価)
	剤形	水性点眼剤
	色	無色～淡黄色澄明
	pH	6.0～8.0
その他		無菌製剤

【効能・効果】

〈適応菌種〉セフメノキシムに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、モラクセラ・ラクナータ(モラー・アクセンフェルト菌)、セラチア・マルセスセンス、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプチウス(コッホ・ウィークス菌)、緑膿菌、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

【用法・用量】

本剤を添付の溶解液で1mL当たりセフメノキシム塩酸塩として5mg(力価)の濃度に溶解し、通常1回1～2滴を1日4回点眼する。

なお、症状により適宜回数を増減する。

ただし、症状に改善がみられない場合は漫然と長期間の連続投与を行わないこと。

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少限の期間の投与にとどめること。

※溶解方法については最終頁をご参照ください。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1)ペニシリン系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2)本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者〔アレルギー素因が遺伝し、アレルギー症状を起こすおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

- (1)ショックがあらわれるおそれがあるので、十分な問診を行うこと。
- (2)本剤の使用にあたっては、4週間の投与を目安とし、その後の継続投与については漫然と投与しないよう、慎重に行うこと。

3. 副作用

承認時及び使用成績調査での総症例5,866例中41例(0.70%)に副作用が認められた。

主な副作用は、刺激感19件(0.32%)、痒痒感10件(0.17%)、結膜充血6件(0.10%)であった(再審査終了時)。

以下の副作用は上記の調査あるいは自発報告等で認められたものである。

(1)重大な副作用

ショック(頻度不明)を起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗等の異常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

	頻度不明	0.1～5%未満
過敏症 ^(注)	発疹、蕁麻疹	
眼 ^(注)	眼瞼炎、眼瞼発赤・腫脹	刺激感、痒痒感、結膜充血

注)発現した場合には、投与を中止すること。

4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児又は乳児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

- (1)投与経路：点眼用のみ使用すること。
- (2)投与時：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。

【薬物動態】

(参考)

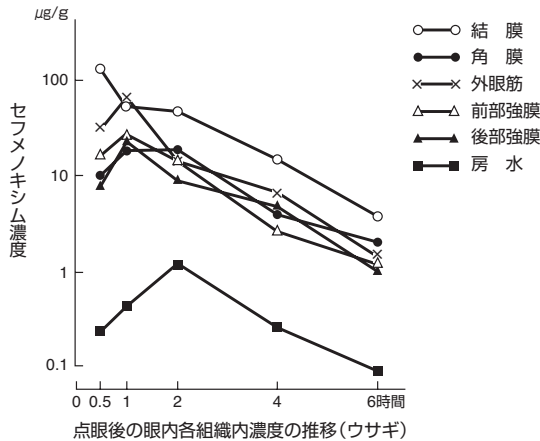
眼内移行(ウサギ)

ウサギにセフメノキシム点眼液(1%力価)を1回1滴、5分間隔で5回点眼した試験での、点眼30分、1、2、4、6時間後の外眼部各組織への推移は図のとおりである。

セフメノキシム点眼液(1%力価)の外眼部各組織内濃度は、点眼30分後に結膜で最高値を示し、以降漸次減少していくが、角膜では点眼1時間と2時間後でほとんど同じ濃度となり、それ以後減少した。

一方、外眼筋、前部強膜、後部強膜では点眼1時間後に最大となり、以後角膜とほぼ同様の傾向を示した。

房水については、点眼後2時間で最高値を示した。



【臨床成績】

二重盲検比較対照試験を含む外眼部感染症470例についての成績概要は、次のとおりである。1日投与量、投与期間は大部分が1回2滴、1日4回、4週間以内であった。

表. 外眼部感染症に対する臨床効果

疾患名	有効率(%)	有効以上
眼瞼炎	94.1	(16/17)
涙嚢炎	80.0	(48/60)
麦粒腫	92.9	(39/42)
結膜炎	93.8	(259/276)
瞼板腺炎	100	(15/15)
角膜炎(角膜潰瘍を含む)	87.8	(43/49)
その他*	100	(11/11)
合計	91.7	(431/470)

*麦粒腫・結膜炎1例、涙嚢炎・結膜炎4例

結膜炎・瞼板腺炎3例、結膜炎・角膜炎3例

眼手術患者を対象に実施した手術前結膜嚢無菌法の効果の検討においては、術前無菌化率は86.1%(31/36)であった。なお、全例において術後感染症は認められなかった。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用

(1)グラム陰性・グラム陽性の好気性菌及び嫌気性菌に対する抗菌作用¹⁻³⁾

緑膿菌、プロテウス属等のグラム陰性菌及びブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌のグラム陽性菌に強い抗菌力を示し、その作用は殺菌的である(*in vitro*)。

(2)眼科臨床分離菌に対する抗菌作用

眼感染症患者から分離した緑膿菌、インフルエンザ菌、モラクセラ・ラクナータ(モラー・アクセンフェルト菌)、プロテウス属等のグラム陰性菌及び黄色ブドウ球菌、表皮ブドウ球菌、レンサ球菌属、肺炎球菌のグラム陽性菌に強い抗菌力を示す(*in vitro*)。

(3)実験的緑膿菌角膜感染症に対する治療効果

マウスの角膜実質に傷をつけ、これに緑膿菌の臨床分離株(ET-1081、1082、1111)を接種し、角膜炎の発症を確認(菌接種9~10時間)後にベストロン点眼用0.5%又は対照として生理食塩水を、30分ごとに2滴(1日25回)3日間点眼した試験では、ベストロン点眼用0.5%点眼群において有意な角膜病変の進行抑制効果が認められた。

(4)実験的黄色ブドウ球菌角膜感染症に対する治療効果

ウサギの角膜実質にトブラマイシン耐性黄色ブドウ球菌を接種し作成した角膜感染症に対し、ベストロン点眼用0.5%又は対照として生理食塩水を菌接種直後とその後1時間ごとに1回1滴、1日9回、7日間点眼した試験では、ベストロン点眼用0.5%点眼群において感染症状の抑制効果が認められた。

2. 作用機序¹⁾

作用機序は、細菌細胞壁の合成阻害である。

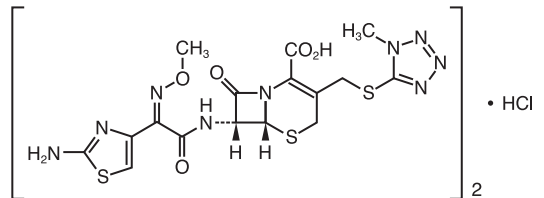
【有効成分に関する理化学的知見】**

一般名：セフメノキシム塩酸塩

(Cefmenoxime Hydrochloride) [JAN] 略号：CMX

化学名：(6R,7R)-7-[(Z)-2-(2-Aminothiazol-4-yl)-2-(methoxyimino)acetylamino]-3-(1-methyl-1H-tetrazol-5-ylsulfanylmethyl)-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylic acid hemihydrochloride

**構造式：



**分子式：(C₁₆H₁₇N₉O₅S₃)₂ · HCl

**分子量：1059.58

融点(分解点)：130℃付近から黄変し始め、徐々に褐変し約190℃で炭化するが、明確な融点及び分解点を示さない。

性状：セフメノキシム塩酸塩は、白色~淡だいたい黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

ホルムアミド又はジメチルスルホキシドに溶けやすく、メタノールに溶けにくく、水に極めて溶けにくく、エタノール(95)にほとんど溶けない。

**力価：セフメノキシム塩酸塩は定量するとき、換算した脱水物1mg当たり890~975μg(力価)を含む。ただし、本品の力価は、セフメノキシム(C₁₆H₁₇N₉O₅S₃：511.56)としての量を質量(力価)で示す。

【取扱い上の注意】

貯法：1. 室温保存

2. 溶解後は、冷所に保存し、7日以内に使用すること。

【包装】

[25mg(力価)・溶解液5mL] × 5

【主要文献】

1) 土屋皖司他：Chemotherapy, 29(S-1), 96, 1981.

2) 西野武志他：Chemotherapy, 29(S-1), 57, 1981.

3) 上野一恵他：Chemotherapy, 29(S-1), 42, 1981.

【文献請求先】

〈文献請求先・製品情報お問合せ先〉

千寿製薬株式会社 カスタマーサポート室

〒541-0046 大阪市中央区平野町二丁目5番8号

TEL ☎ 0120-06-9618 FAX 06-6201-0577

受付時間 9:00~17:30(土、日、祝日を除く)

溶解方法

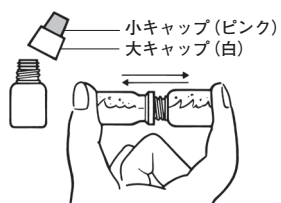
※1 粉末及び溶解液は分割して調製しないでください。

(溶解後の薬液中の粉末成分が均一とならず、白濁することがあるため)

※2 溶解後は、冷所保存で7日以内に使用し、その期間を過ぎたものは使用しないでください。



①粉末瓶の矢印(↑)の部分から親指で強く押し上げてください。



②溶解液瓶の白い大キャップをまわしてとりはずし、液がこぼれないように開封した粉末瓶にしっかり差し込み、よく振って粉末を完全に溶かしてください。



③溶解液瓶の方に薬液を移した後、粉末瓶をとりはずし、大キャップをし、固くしめてください。



④ピンクの小キャップだけをとりはずし、使用してください。
また、使用後は必ず冷所に保存してください。

