2026 年 9 月改訂（第 3 版）

日本標準商品分類番号
871319

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

ヘルペス性角膜炎化学療法剤
日本薬局方 アシクロビル眼軟膏

ゾビラックス®眼軟膏3%

剤形	眼軟膏剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1g 中 日局 アシクロビル 30mg 含有
一般名	和名：アシクロビル（JAN） 洋名：aciclovir（JAN、INN、BAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2007 年 1 月 23 日（販売名変更） 薬価基準収載年月日：2007 年 6 月 15 日（販売名変更） 販売開始年月日：1985 年 10 月 2 日
製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元：日東メディック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日東メディック株式会社 おくすり相談窓口 TEL：03-3523-0345 FAX：03-6264-4086 医療関係者向けホームページ https://www.nittomedic.co.jp/info/

本 IF は 2026 年 9 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 －日本病院薬剤師会－

（2020 年 4 月改訂）

１．医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、ＭＲ）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、ＩＦと略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第２小委員会がＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第３小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領 2008 以降、ＩＦはＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦは、医薬品医療機器総合機構（以下、ＰＭＤＡ）の医療用医薬品情報検索のページ（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のＩＦが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF 記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

２．ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はＩＦの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたＩＦは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

ＩＦの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

３．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってＩＦを作成・提供するが、ＩＦの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やＩＦ作成時に記載し難い情報等については製薬企業のＭＲ等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、ＩＦの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、ＩＦが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、ＩＦの使用にあたっては、最新の添付文書をＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

４．利用に際しての留意点

ＩＦを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。ＩＦは日

病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、ＭＲ等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがＩＦの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、ＩＦを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目　次

Ⅰ.概要に関する項目 …… 1
1. 開発の経緯 …… 1
2. 製品の治療学的特性 …… 1
3. 製品の製剤学的特性 …… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
6. RMP の概要 …… 2

Ⅱ.名称に関する項目 …… 3
1. 販売名 …… 3
2. 一般名 …… 3
3. 構造式又は示性式 …… 3
4. 分子式及び分子量 …… 3
5. 化学名(命名法)又は本質 …… 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 …… 3

Ⅲ.有効成分に関する項目 …… 4
1. 物理化学的性質 …… 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性 …… 4
3. 有効成分の確認試験法、定量法 …… 5

Ⅳ.製剤に関する項目 …… 6
1. 剤形 …… 6
2. 製剤の組成 …… 6
3. 添付溶解液の組成及び容量 …… 6
4. 力価 …… 6
5. 混入する可能性のある夾雑物 …… 6
6. 製剤の各種条件下における安定性 …… 7
7. 調製法及び溶解後の安定性 …… 7
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化) …… 7
9. 溶出性 …… 7
10. 容器・包装 …… 7
11. 別途提供される資材類 …… 7
12. その他 …… 7

Ⅴ.治療に関する項目 …… 8
1. 効能又は効果 …… 8
2. 効能又は効果に関連する注意 …… 8
3. 用法及び用量 …… 8
4. 用法及び用量に関連する注意 …… 8
5. 臨床成績 …… 8

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 …… 10
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 10
2. 薬理作用 …… 10

Ⅶ.薬物動態に関する項目 …… 12
1. 血中濃度の推移 …… 12
2. 薬物速度論的パラメータ …… 12
3. 母集団(ポピュレーション)解析 …… 12
4. 吸収 …… 12
5. 分布 …… 12
6. 代謝 …… 13
7. 排泄 …… 13
8. トランスポーターに関する情報 …… 13
9. 透析等による除去率 …… 13
10. 特定の背景を有する患者 …… 13
11. その他 …… 13

Ⅷ.安全性(使用上の注意等)に関する項目 …… 14
1. 警告内容とその理由 …… 14
2. 禁忌内容とその理由 …… 14
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 14
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 14
5. 重要な基本的注意とその理由 …… 14
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 …… 14
7. 相互作用 …… 14
8. 副作用 …… 15
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 …… 17
10. 過量投与 …… 17
11. 適用上の注意 …… 17
12. その他の注意 …… 17

Ⅸ.非臨床試験に関する項目 …… 18
1. 薬理試験 …… 18
2. 毒性試験 …… 18

Ⅹ.管理的事項に関する項目 …… 20
1. 規制区分 …… 20
2. 有効期間 …… 20
3. 包装状態での貯法 …… 20
4. 取扱い上の注意 …… 20
5. 患者向け資材 …… 20
6. 同一成分・同効薬 …… 20
7. 国際誕生年月日 …… 20
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 …… 20
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 …… 20
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 …… 20
11. 再審査期間 …… 20
12. 投薬期間制限に関する情報 …… 20
13. 各種コード …… 21
14. 保険給付上の注意 …… 21

XI.文献 …… 22
1. 引用文献 …… 22
2. その他の参考文献 …… 22

XII.参考資料 …… 23
1. 主な外国での発売状況 …… 23
2. 海外における臨床支援情報 …… 23

XIII.備考 …… 24
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 …… 24
2. その他の関連資料 …… 24

Ⅰ.概要に関する項目

1. 開発の経緯

(1) 開発から承認に至るまでの経緯

アシクロビルは、1974 年、米国ウエルカム研究所(現 グラクソ・スミスクライン社)の Schaeffer らにより合成され、米国及び英国のウエルカム研究所により共同開発された非環状側鎖を有するプリン骨格の抗ウイルス剤で、1977 年にヘルペス群ウイルスに対して特異的な活性を示し、かつ細胞毒性が弱く、高い選択性を有する化合物として見い出された。我が国での本剤の開発は、1980 年より開始され、臨床試験の結果、単純ヘルペスウイルスに起因する角膜炎に対して臨床効果及び安全性が確認されたため、1985 年 4 月 16 日に製造販売承認を取得し、同年 10 月販売に至った。なお、平成 12 年 9 月 19 日付医薬発 935 号「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取り扱いについて」に基づき、2007 年 1 月 23 日に『ゾビラックス®眼軟膏 3%』として販売名変更の承認を取得し、同年 6 月に薬価収載された。

その後、2018 年 4 月 2 日にグラクソ・スミスクライン株式会社から、日東メディック株式会社に製造販売承認が承継された。

(2) 承認から再審査に至るまでの経緯

承認後 6 年間(昭和 60 年 4 月 16 日～平成 3 年 4 月 15 日、以下当該期間と称する)に使用成績調査において 1,289 症例を収集した。

1)有効性

当該期間中に収集した 1,289 例中単純ヘルペスウイルスに起因する角膜炎に使用された症例は 1,163 例であった。このうち、判定不能例とされた 13 例を除いた有効性評価対象症例での改善率は 86.17%(991/1,150)であった。

2)安全性

当該期間中に収集した 1,289 例の副作用発現症例率は 10.62%(137/1,289)で承認時までの調査成績 28.29%(73/258)に比較して有意に低かった($p < 0.001$; χ^2 検定、Fisher's exact test)。

以上の結果、1992 年 12 月薬事法第 14 条第 2 項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しないとの再審査結果を得た。

2. 製品の治療学的特性

(1) アシクロビルは、ヘルペスウイルス特異的チミジンキナーゼによるリン酸化により活性化されて、初めてウイルスの DNA ポリメラーゼ阻害作用を発揮するため、正常細胞にはほとんど作用しない選択性の高い抗ヘルペスウイルス剤である。(「VI. 2. 薬理作用」の項参照。)

3. 製品の製剤学的特性

(1) 本剤は無菌製剤である。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、 最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

Ⅱ.名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ゾビラックス®眼軟膏 3%

(2) 洋名

－

(3) 名称の由来

一般名 aciclovir は、非環状側鎖を有する抗ウイルス剤、商品名ゾビラックスは帯状疱疹の“Zoster”及び抗ウイルス剤“Antiviral Agents”から命名。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

アシクロビル（JAN）

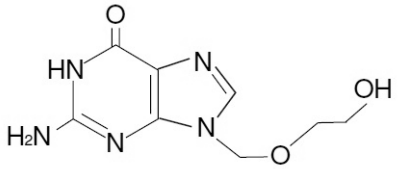
(2) 洋名（命名法）

aciclovir（JAN、INN、BAN）
acyclovir（USAN）

(3) ステム

抗ウイルス剤、複素二環化合物：-ciclovir

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_8H_{11}N_5O_3$
分子量：225.20

5. 化学名（命名法）又は本質

（和名）：2-アミノ-9-[(2-ヒドロキシエトキシ)メチル]-1,9-ジヒドロ-6*H*-プリン-6-オン（IUPAC）
（洋名）：2-Amino-9-［(2-hydroxyethoxy) methyl］-1,9-dihydro-6*H*-purin-6-one（IUPAC）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：ACV
記号番号：BW-248U

Ⅲ.有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

認められない。

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点:約 300℃(分解)

(5) 酸塩基解離定数

pKa1=9.35、pKa2=2.52

(6) 分配係数

溶　　媒	分配係数
1-オクタノール／pH 1.1 緩衝液	＜0.001
1-オクタノール／pH 7.0 緩衝液	0.06

(7) その他の主な示性値

吸光度(λmax):254～258nm

2. 有効成分の各種条件下における安定性

アシクロビルの各種条件下における安定性は以下であった。

温度、湿度、光に対する安定性

保存条件	保存期間	保存形態	結　果
25℃・75%RH	24 箇月	無色透明ガラス瓶(密栓)	規格内※1
40℃	6 箇月		
50℃	3 箇月		
40℃・75%RH	6 箇月		
室内散光	3 箇月		
蛍光灯 1000lx	2 箇月		
25℃・60%RH	60 箇月	ポリエチレン袋＋3 重ラミネートアルミ袋＋Fiber ドラム	規格内※2

※1 試験項目:性状、確認試験、溶状、分解生成物、水分、定量

※2 試験項目:性状、水分、類縁物質、定量

水溶液中での安定性

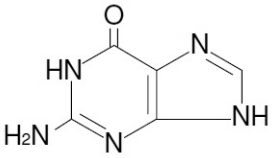
保存液	保存方法	保存条件	保存期間	結　果
pH3～11 の緩衝液	試料 0.2g に、緩衝液 5mL を加え懸濁液とし、無色アンプル中に保存	100℃	1 時間	規格内だが、pH3 において液体クロマトグラフィーにより、わずかにグアニンの増加を認める。※3
		室　温	7 日間	規格内※3

※3:試験項目:分解生成物、定量

＜強制分解による生成物＞

0.1N 塩酸、100℃・1 時間の酸性条件下で強制分解を行った結果、薄層クロマトグラフィーよりグアニンが認められている。

グアニン



3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：日局「アシクロビル」による。

定量法：日局「アシクロビル」による。

Ⅳ.製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

眼軟膏剤

(2) 製剤の外観及び性状

白色の無菌眼軟膏剤

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

販売名	ゾビラックス眼軟膏 3%
有効成分	1g 中　日局 アシクロビル　30mg
添加剤	白色ワセリン

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

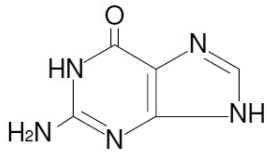
該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

グアニン



6. 製剤の各種条件下における安定性

ゾビラックス眼軟膏 3%において、各種条件下における安定性試験の結果を以下に示す [1)]。
なお、アルミニウムチューブ入りであるため、光に対する影響は検討されなかった。

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	25℃ 75%RH	24 箇月	アルミニウムチューブ	規格内※1
定期安定性試験	25℃ 60%RH	36 箇月		規格内※2
加温保存試験	40℃	6 箇月		規格内※1
加温保存試験	50℃	3 箇月		規格外（1 箇月で、基剤の融解による原薬との分離を認める）※1

※1 試験項目：性状、確認試験、類縁物質、定量（%）、薄層クロマトグラム
※2 試験項目：性状、粒子径、定量（%）、無菌

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

5g［1 チューブ］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

キャップ：ポリエチレン
チューブ：アルミニウム

11. 別途提供される資材類

「X. 5. 患者向け資材」を参照すること。

12. その他

該当しない

Ⅴ.治療に関する項目

1. 効能又は効果

単純ヘルペスウイルスに起因する角膜炎

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

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。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし（2009 年 3 月以前承認品目）

(2) 臨床薬理試験

国内第Ⅲ相試験（臨床薬理試験）

日本人健康成人 10 例（20～45 歳）の片眼に 3%アシクロビル眼軟膏をチューブより約 1cm 圧出し 1 日 5 回、14 日間連続点眼した。点眼時の自覚症状は 1 例において最初 1 週間点眼時に軽微な刺激が認められたが、2 週目には消失した。他覚症状としては結膜の充血・浮腫・分泌物増加のような所見は認められなかったが、10 例中 4 例に軽微なびまん性表在性角膜炎が発生し、軽微ではあるがびまん性表在性角膜炎をおこす傾向があることが推定された [2)]。

(3) 用量反応探索試験

単純ヘルペス性角膜炎患者のうち、基本型（上皮型である樹枝状角膜炎及び地図状角膜炎）を主病変とする患者を対象とし、3%アシクロビル眼軟膏をチューブより約 1cm 圧出し、原則として 1 日 5 回（角膜潰瘍消失後は 3 回）点眼、投与期間は角膜潰瘍消失後 1 週間、総計 2 週間までを原則とした。有効率は 96.7%（89/92 例）であった [2)]。

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

1. 国内第Ⅲ相試験（一般臨床試験）

単純ヘルペス性角膜炎患者を対象に、3%アシクロビル眼軟膏をチューブより約 1cm 圧出し 1 日 5 回、原則 2 週間投与した結果、有効率は 91.5%（150/164 例）であった。なお、7 日目の治療により効果の兆候がないか、あるいは悪化する場合には治療法を変更した。

副作用発現頻度は 34.3%（57/166 例）であり、主な副作用は、びまん性表在性角膜炎 30.7%（51/166 例）であった [2)]。

2. 国内第Ⅲ相試験（臨床ウイルス学的試験）

単純ヘルペス性角膜炎患者を対象に、3%アシクロビル眼軟膏をチューブより約 1cm 圧出し 1 日 5 回、原則 2 週間投与した結果、有効率は 80%（20/25 例）であった。なお、7 日目の治療により効果の兆候がないか、あるいは悪化する場合には治療法を変更した。

副作用発現頻度は 25.8%（8/31 例）であり、副作用は、全てびまん性表在性角膜炎であった [3)]。

3. 国内第Ⅲ相試験（二重盲検比較試験）

単純ヘルペス性角膜炎患者のうち基本型（上皮型である樹枝状角膜炎及び地図状角膜炎）を主病変とする患者を対象に、3%アシクロビル眼軟膏及び 0.25%イドクスウリジン眼軟膏をチューブより約 1cm 圧出し、原則として 1 日 5 回（潰瘍消失後は 3 回）点眼、投与期間は潰瘍消失後 1 週間、総計

2 週間までを原則とし、7 日間規定の治療を行い、改善の徴候がないか、又は症状が悪化した場合にはクロスオーバーする比較試験を実施した。有効率はアシクロビル眼軟膏群 98.1%（53/54 例）、イドクスウリジン眼軟膏群 81.8%（45/55 例）であり、アシクロビル眼軟膏群はイドクスウリジン眼軟膏群に対して有意に高かった。クロスオーバーの基準に従って、無効によりクロスオーバーされた症例はアシクロビル眼軟膏群では 1 例（イドクスウリジン眼軟膏群も無効）、イドクスウリジン眼軟膏群では 7 例（アシクロビル眼軟膏群では 4 例が著効、3 例が有効）であった。

アシクロビル眼軟膏群の副作用発現頻度は 24.1%（13/54 例）であり、主な副作用は、びまん性表在性角膜炎 22.2%（12/54 例）であった [4)]。

2）安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1）使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

「Ⅰ．1．(2)承認から再審査に至るまでの経緯」を参照すること。

2）承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当しない

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

バラシクロビル塩酸塩、イドクスウリジン、ビダラビン、ファムシクロビル
注意：関連のある化合物の効能・効果は最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

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[5)~8)]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 抗ウイルス作用

a) *in vitro*

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_{50} はそれぞれ 0.01～1.25 μg/mL 及び 0.01～3.20 μg/mL であった[11), 13)]。

アシクロビルの抗ウイルス作用

ウイルス	IC_{50}（平均値）［μg/mL］	ウイルス株	宿主細胞	測定法
HSV-1	0.05～0.32（0.13）[9)]	臨床分離株	Vero	プラーク減少法
	0.07～0.30（0.16）[10)]		HEF	マイクロタイター法
	0.02～0.09（0.05）[3)]			プラーク減少法
	0.01～0.07（0.02）[11)]		Vero	
	0.08～1.25（0.44）[11)]			定量的ニュートラル・レッド摂取法
	0.01～0.08（0.03）[12)]			プラーク減少法
	0.02～0.70（0.17）[13)]			定量的ニュートラル・レッド摂取法
HSV-2	0.17～0.70（0.42）[9)]	臨床分離株	Vero	プラーク減少法
	0.01～0.02（0.02）[11)]			
	0.24～0.63（0.41）[11)]			定量的ニュートラル・レッド摂取法
	0.04～0.70（0.23）[14)]			プラーク減少法
	0.10～0.68（0.36）[12)]			
	0.01～3.20（0.46）[13)]			定量的ニュートラル・レッド摂取法

b) *in vivo*

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（長さ 1cm～1.5cm、重量 20～30mg）を結膜嚢に 1 日 5 回 2 時間毎塗布した結果、塗布後 4 日目に角膜潰瘍はほぼ治癒した[15)]。

2) 薬剤耐性

HSV 及び水痘・帯状疱疹ウイルス（VZV）のアシクロビルに対する耐性は、ウイルス性チミジンキナーゼ（TK）又は DNA ポリメラーゼの質的又は量的変化によるものであると考えられる。
アシクロビルに対する感受性が低下した HSV、VZV の臨床分離株が免疫機能低下患者、特に進行性 HIV 感染症患者から検出されている。
免疫機能低下患者からこれまで分離されたアシクロビル耐性株の大部分が TK 欠損株であるが、ウイルス性 TK 変異株（TK の一部欠損及び TK の変異）及び DNA ポリメラーゼ変異株も分離されている。TK 欠損株は、乳児及び免疫機能の低下した成人患者において重篤な疾患を引き起こす

ことがある。アシクロビルによる治療に対する反応が低い患者では、アシクロビルに対する耐性の可能性を考慮すべきである。（経口剤 Zovirax 米国電子添文より）

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ.薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

健康成人 10 例(20～45 歳)の片眼に 3%アシクロビル眼軟膏をチューブより約 1cm 圧出し 1 日 5 回、14 日間連続投与し、最終投与時に採血した。最終投与後の血漿中アシクロビル濃度を HPLC 法にて定量した結果、すべての検体において定量下限未満(＜0.23μg/mL)であった[2)]。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

白内障患者 25 眼に、3%アシクロビル眼軟膏 1cm を 5 時間毎に 4～6 回投与した後の房水中アシクロビル濃度は、平均 1.7±0.2μg/mL であった(外国人データ)[16)]。

注)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。

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

〈参考〉

その他の組織への移行性(ウサギ)

0.3%^{14}C-アシクロビル溶液 0.1mL をウサギ左眼に 1 時間間隔で 4 回連続投与後の眼組織、血液、主要臓器濃度を測定したところ、投与眼組織の放射活性は、眼房水、角膜、網膜で比較的高かった。非投与眼組織では放射活性は認められず、その他の組織では投与後 1 時間では血漿、全血、腎にわずかに、また 5 時間では腎のみに認められている。

(6) 血漿蛋白結合率

9～33%[17), 18)]

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 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

（解説）
医薬品全般に対する一般的な注意事項として設定した。本剤の成分及びプロドラッグであるバラシクロビル塩酸塩に対して過敏症の既往のある患者では、本剤の投与によりさらに重篤な過敏症状が発現するおそれがある。

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「Ⅴ．4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦
妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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）で、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[19]。

(6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

9.7 小児等
小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

設定されていない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用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。

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	5%未満	頻度不明
眼	びまん性表在性角膜炎（27.5%）	眼瞼炎、一過性刺激	結膜炎、角膜潰瘍、結膜びらん
皮膚			接触皮膚炎
過敏症			血管性浮腫、蕁麻疹

〈副作用発現頻度〉

対象	承認時迄の調査	使用成績の調査の累計	合計
調査施設数	22	247	258
調査症例数	258	1289	1547
副作用発現症例数	73	137	210
副作用発現件数	78	175	253
副作用発現症例率（%）	28.29	10.62	13.57
副作用の種類			
視覚障害	73（28.29）	137（10.63）	210（13.57）
角膜浮腫	0	1（0.08）	1（0.06）
多発性角膜びらん	0	10（0.78）	10（0.65）
びらん形成	1（0.39）	0	1（0.06）
びまん性表在性角膜炎	71（27.52）	99（7.68）	170（10.99）
角膜潰瘍形成	0	3（0.23）	3（0.19）
眼瞼炎	0	5（0.39）	5（0.32）
アレルギー性眼瞼炎	1（0.39）	0	1（0.06）
眼痛	1（0.39）	9（0.70）	10（0.65）
結膜炎	0	5（0.39）	5（0.32）
アレルギー性結膜炎	0	2（0.16）	2（0.13）
結膜びらん	0	10（0.78）	10（0.65）
眼球結膜充血	0	1（0.08）	1（0.06）
眼球充血	0	1（0.08）	1（0.06）
眼刺激	1（0.39）	5（0.39）	6（0.39）
一過性充血	1（0.39）	0	1（0.06）
結膜充血	1（0.39）	12（0.93）	13（0.84）
球結膜浮腫	0	1（0.08）	1（0.06）
結膜乳頭増殖	0	1（0.08）	1（0.06）
眼やに	0	1（0.08）	1（0.06）
羞明	0	1（0.08）	1（0.06）
流涙異常	0	2（0.16）	2（0.13）
血管（心臓外）障害	0	2（0.16）	2（0.13）

眼瞼発赤	0	2（0.16）	2（0.13）
一般的全身障害	1（0.39）	3（0.23）	4（0.26）
眼瞼腫脹	0	3（0.23）	3（0.19）
眼瞼浮腫	1（0.39）	0	1（0.06）
適用部位障害	0	1（0.08）	1（0.06）
接触性皮膚炎	0	1（0.08）	1（0.06）

〈使用成績調査〉

要因		調査症例数	副作用発現症例数	副作用発現件数	副作用発現症例率（%）
使用理由	単純ヘルペスウイルスに起因する角膜炎	1163	125	161	10.75
	その他	126	12	14	9.52
年齢	2 歳未満	9	1	2	11.11
	2～6 歳	41	3	3	7.32
	7～15 歳	69	6	6	8.70
	16～40 歳	302	28	35	9.27
	41～64 歳	546	57	80	10.44
	65 歳以上	322	42	49	13.04
平均投与回数（回/日）	3 回未満	312	27	37	8.65
	3 回以上 5 回未満	563	70	87	12.43
	5 回以上 6 回未満	327	29	35	8.87
	6 回以上	29	6	10	20.69
	不明	58	5	6	8.62
合併症	無	956	94	117	9.83
	有	333	43	58	12.91
	眼疾患	227	32	45	14.10
	ブドウ膜障害	5	1	1	20.00
	緑内障	63	13	16	20.63
	水晶体障害	30	7	15	23.33
	角膜障害	16	3	5	18.75
	結膜及び眼瞼障害	110	9	9	8.18
	その他の障害	18	2	2	11.11
	皮膚疾患	107	10	12	9.35
	その他	43	4	4	9.30
併用薬剤	無	168	5	6	2.98
	有	1114	132	169	11.85
	抗ウイルス剤	307	27	34	8.79
	抗生物質	707	100	133	14.14
	ステロイド剤	364	47	61	12.91
	その他	615	81	107	13.17
	不明	7	0	0	0.00
過敏症	無	1261	124	157	9.83
	有	27	13	18	48.15
	不明	1	0	0	0.00
併用療法	無	1164	108	136	9.28
	有	116	29	39	25.00

	擦過	56	21	29	37.50
	不明	9	0	0	0.00

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

・使用中は、コンタクトレンズの装用を避けること。
・薬剤汚染防止のため、塗布するとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
・患眼を開瞼して結膜嚢内に塗布し、閉瞼して軟膏が全体に広がった後、開瞼すること。
・軟膏が眼瞼皮膚等についた場合には、すぐにふき取ること。
・他の点眼剤を併用する場合には、本剤を最後に塗布すること。その際、少なくとも 5 分以上間隔をあけること。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」を参照すること。

(2) 安全性薬理試験

一般薬理について主として最高用量 100mg/kg の静脈内投与により検討した。中枢神経系、呼吸・循環器系、末梢自律神経系、平滑筋、消化器系等に対する作用、尿量・電解質排泄、抗炎症及びアジュバント関節炎に対する作用、蛋白凝固及び溶血性、抗菌性、抗腫瘍性活性、及び免疫能に及ぼす影響について検討した結果、一部に作用を認めたが、いずれも高用量又は高濃度におけるものであった[20), 21)]。

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

（LD_{50}、mg/kg）

動物 / 投与経路	CD-1 系マウス		Wistar 系ラット	
	♂	♀	♂	♀
経口	＞10,000	＞10,000	＞20,000	＞20,000
皮下	1,375	1,118	620	660
静脈内	1,268	1,118	910	750
腹腔内	724	約 724	860	1,125

(2) 反復投与毒性試験

1) イヌ及びサル 1 ヵ月間静脈内投与試験
イヌに 20、40、50、100、200mg/kg/day[22)]、サルに 20、50、100mg/kg/day をそれぞれ 1 日 2 回 1 ヵ月間静脈内投与した実験において、イヌでは 40mg/kg 以上、サルでは 50mg/kg 以上で、アシクロビルの結晶析出による用量相関性の腎障害（BUN 上昇、尿量増加、腎重量増加、尿細管の病理組織学的変化）が認められた。

2) ラット 1 ヵ月間腹腔内投与試験
ラットに 20、80、320mg/kg/day を 1 日 1 回 1 ヵ月間腹腔内投与した実験において、80mg/kg 以上で 1）と同様な腎障害、320mg/kg で精巣の縮小・重量減少、精子低形成が認められた。これらの試験では、休薬により腎及び他の障害は回復した。最大無作用量は 20mg/kg/day と推定された。

3) ラット 6 ヵ月間腹腔内投与
ラットに 5、20、80mg/kg/day を 1 日 1 回 6 ヵ月間腹腔内投与した実験において、20mg/kg 以上で、アシクロビルの結晶析出による用量相関性の腎障害（BUN 上昇、尿量増加、腎重量増加、尿細管の病理組織学的変化）、及び精巣の縮小が認められ、80mg/kg で精巣重量の減少、及び精子低形成が認められた。5mg/kg では異常は認められなかった。
本試験では、休薬により腎障害は回復しなかった。
最大無作用量は 5mg/kg/day と推定された。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

1) ラットの妊娠前・妊娠初期に 12.5、25、50mg/kg/day を 1 日 2 回皮下投与した実験では、50mg/kg 群の着床後胚及び胎児死亡が軽度増加した以外には異常所見はみられず、器官形成期及び周

産期・授乳期に投与した実験においても、特記すべき異常所見はみられなかった。ウサギの器官形成期に 12.5、25、50mg/kg/day を 1 日 2 回静脈内投与した実験では、特記すべき異常所見はみられなかった。

非標準的手法でラットの器官形成期（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[19]。

(6) 局所刺激性試験

眼刺激性試験

ウサギの角膜に 3%アシクロビル眼軟膏を塗布（1 日 5 回 21 日間）した実験では、眼刺激性はほとんど認められず、同様に 7 日間塗布した実験では、角膜毒性、角膜創傷治癒の遅延及び障害は認められなかった[23), 24), 25)]。

(7) その他の特殊毒性

1）変異原性

Ames 試験、マウス優性致死試験等では陰性であったが[26)]、マウスに 180、360、720mg/kg を腹腔内 1 回投与した骨髄小核試験では、小核出現頻度に用量相関性の有意な増加が認められた。

2）がん原性

マウス及びラットに 50、150、450mg/kg/day を 110～126 週間経口投与した試験では、がん原性は認められなかった[27)]。

3）溶血性

In vitro で 0.5～2.0%アシクロビル溶液 0.1mL に全血 5mL 添加では無作用であるが、0.5～2.0%アシクロビル溶液 5mL に全血、又は 50%赤血球懸濁液 0.1mL 添加で溶血が認められている。

4）抗原性

ウサギ、モルモット及びラットにおいて、アシクロビル及びその主代謝物（CMMG）は抗原性を示さなかった。

Ⅹ. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製　　剤:該当しない
有効成分:該当しない

2. 有効期間

有効期間:3 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド:無
くすりのしおり:有
その他の患者向け資材:眼軟膏の使い方

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬:ゾビラックス点滴静注用 250、ゾビラックス錠 200、ゾビラックス錠 400、
ゾビラックス軟膏 5%、ゾビラックス顆粒 40%、ゾビラックスクリーム 5%
同　効　薬:バラシクロビル塩酸塩、ビダラビン、ファムシクロビル

7. 国際誕生年月日

1981 年 6 月 10 日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ゾビラックス®眼軟膏	1985 年 4 月 16 日	(60AM)586	1985 年 10 月 2 日	1985 年 10 月 2 日
販売名変更 ゾビラックス®眼軟膏 3%	2007 年 1 月 23 日 (代替新規承認)	21900AMX00026000	2007 年 6 月 15 日	2007 年 6 月 15 日
製造販売承認継承	〃	〃	〃	2018 年 4 月 2 日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当資料なし

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果通知年月日:1992 年 12 月 2 日
内容:薬事法第 14 条第 2 項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しない。

11. 再審査期間

6 年間:調査期間:1985 年 4 月 16 日～1991 年 4 月 15 日(終了)

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める掲示事項等(平成 18 年厚生労働省告示第 107 号)の一部を改正した平成 20 年厚生労働省告示第 97 号(平成 20 年 3 月 19 日付)の「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJ コード）	HOT（9 桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
ゾビラックス®眼軟膏 3%	1319719M1046	1319719M1046	102169104	620005271

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI.文献

1. 引用文献

1） 社内資料:ゾビラックス眼軟膏 3%の安定性試験
2） 塩田洋ほか:臨床眼科. 1982;36(11):1405-1414
3） 西田輝夫ほか:日本眼科紀要. 1983;34(5):1173-1178
4） 北野周作ほか:眼科臨床医報. 1983;77(8):1273-1280
5） St Clair MH, et al. :Antimicrobial Agents and Chemotherapy. 1980;18(5):741-745
6） Furman PA, et al. :Journal of Virology. 1979;32(1):72-77
7） Furman PA, et al. :Antimicrobial Agents and Chemotherapy. 1981;20(4):518-524
8） Miller WH, et al. :The Journal of Biological Chemistry. 1980;255(15):7204-7207
9） Hasegawa T, et al. :Journal of Medical Virology. 2001;63:57-63
10） 武藤茂生ほか:小児科臨床. 1983;36(12):2785-2790
11） Al-Hasani AM, et al. :Journal of Antimicrobial Chemotherapy. 1986;18(Suppl. B):113-119
12） Crumpacker CS, et al. :Antimicrobial Agents and Chemotherapy. 1979;15(5):642-645
13） McLaren C, et al. :The American Journal of Medicine. 1982;73(1A):376-379
14） Leahy BJ, et al. :Journal of Virological Methods. 1994;48:93-108
15） Bauer DJ, et al. :British Journal of Ophthalmology. 1979;63:429-435
16） Poirier RH, et al. :Archives of Ophthalmology. 1982;100:1964-1967
17） de Miranda P, et al. :Clinical Pharmacology and Therapeutics. 1981;30(5):662-672
18） de Miranda P, et al. :Journal of Antimicrobial Chemotherapy. 1983;12(Suppl. B):29-37
19） Stahlmann R, et al. :Infection. 1987;15:261-262
20） Steele RW, et al. :Infection and Immunity. 1980;28(3):957-962
21） Parker LM, et al. :Antimicrobial Agents and Chemotherapy. 1982;21(1):146-150
22） Tucker Jr. WE, et al. :Fundamental and Applied Toxicology. 1983;3:573-578
23） Tucker Jr. WE, et al. :Fundamental and Applied Toxicology. 1983;3:569-572
24） 塩田洋ほか:臨床眼科. 1980;84(9):1190-1197
25） Lass JH, et al. :American Journal Ophthalmology. 1979;88(1):102-108
26） Clive D, et al. :Fundamental and Applied Toxicology. 1983;3:587-602
27） Tucker Jr. WE, et al. :Fundamental and Applied Toxicology. 1983;3:579-586

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII.参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

(1)妊婦に関する海外情報

該当資料なし

(2)小児等に関する記載

Medicines for Children(英国)には下表のように掲載されている。
ただし、本邦の電子添文において小児に関する用法及び用量、臨床支援情報の記載はなく、「9. 特定の背景を有する患者に関する注意　9.7 小児等」には「小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。」と記載されている。

出典	記載内容
Medicines for Children（英国）	When should I give Aciclovir eye ointment Aciclovir ointment is usually applied five times a day. This is usually first thing in the morning, at about midday, late in the afternoon, early in the evening and at bedtime. Ideally, these times should be approximately 4 hours apart. Apply the ointment at about the same time(s) each day so that this becomes part of your child's daily routine, which will help you to remember. You must continue using the eye ointment for 3 days after the eye has got better. How should I give Aciclovir eye ointment? Ointment ・Use the Aciclovir eye ointment only into the infected eye, unless your doctor has told you to treat both. ・Wash your hands thoroughly with soap and hot water before and after giving the ointment. ・The ointment is easiest to give when your child is lying down. ・For older children, gently pull the lower lid out and squeeze the bottle gently so that a small amount (about 1 cm) goes into the pocket that is formed. ・In small children and babies, place the ointment into the inner corner of the eye, preferably with the eye open. ・After giving ointment, your child should blink several times to help dissolve the ointment. ・If you think the ointment didn't go into the eye, you can repeat the process but do not try more than twice. ・Wash your hands thoroughly with soap and water after giving the ointment. This will help to stop the virus spreading.

*https://www.medicinesforchildren.org.uk/medicines/aciclovir-eye-ointment-for-herpes-simplex-infection/

（2026/9/3 アクセス）

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉砕

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし