

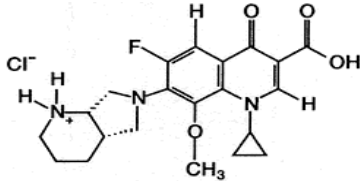
威爾眸點眼液 0.5%

Vigamox Ophthalmic Solution 0.5%

衛署藥輸字第 024011 號

性狀：

Vigamox (moxifloxacin ophthalmic solution) 0.5% 為無菌點眼液，為 8-methoxy fluoroquinolone 類抗生素，專供眼睛局部使用。



分子式： $C_{21}H_{24}FN_3O_4 \cdot HCl$

分子量：437.9

化學名：1-Cyclopropyl-6-fluoro-1,4-dihydro-8-methoxy-7-[(4a*S*, 7a*S*)-octahydro-6*H*-pyrrolol[3,4-*b*]pyridin-6-yl]-4-oxo-3-quinolinecarboxylic acid, monohydrochloride。

Moxifloxacin hydrochloride 為淡黃至黃色的結晶粉末。每毫升 Vigamox 中含有 5.45 毫克 moxifloxacin hydrochloride，相當於 5 毫克 moxifloxacin。

成分：

活性成分：Moxifloxacin 0.5% (5 mg/mL)。

非活性成分：Boric acid、sodium chloride、purified water。另外可能也含有 hydrochloric acid / sodium hydroxide 以調節 pH 值至約 6.8。

Vigamox 為等張溶液，滲透莫耳濃度約為 290 mOsm/kg。

臨床藥理學：

藥物動力學：健康成年男性與女性受試者雙眼分別投予 Vigamox 點眼液，每天點藥 3 次，測定 moxifloxacin 於血漿中的濃度。平均穩定狀態最高濃度 C_{max} (2.7 ng/mL) 及估計每日暴露 AUC (45 ng·hr/mL) 較口服 moxifloxacin 治療劑量 400 mg 後所測得的 C_{max} 及 AUC 分別約低 1600 倍及 1000 倍。Moxifloxacin 在血漿中的半衰期約為 13 小時。

微生物學：

Moxifloxacin 為 8-methoxy fluoroquinolone，在 C7 的位置有一個 diazabicyclononyl 環。Moxifloxacin 的抗菌作用源自於抑制 topoisomerase II (DNA gyrase) 及 topoisomerase IV。DNA gyrase 是細菌 DNA 進行複製、轉錄及修復時所需的酵素。細菌進行細胞分裂時，topoisomerase IV 在染色體的 DNA 分配扮演關鍵角色。

Quinolone 類化合物 (包括 moxifloxacin) 的作用機轉不同於巨環類 (macrolides)、胺基配醣體 (aminoglycosides) 或四環素 (tetracyclines)，因此，對這些藥物已經產生抗藥性的病原菌，使用 moxifloxacin 可能仍然有效；而對 moxifloxacin 已經產生抗藥性的病原菌，使用這些藥物也可能有效。Moxifloxacin 與上述幾類抗生素並無交叉抗藥性。曾發現全身性投予 moxifloxacin 與部份 quinolone 類化合物具有交叉抗藥性。

在活體外試驗中，細菌經由多步驟突變發展出對 moxifloxacin 的抗藥性。以革蘭氏陽性菌來

說，活體外發生對 moxifloxacin 的抗藥性之頻率通常為 1.8×10^{-9} 至 $< 1 \times 10^{-11}$ 。

Moxifloxacin 對下列微生物的多數菌株，在活體外及臨床感染均具有活性（參見“適應症及用途”）

好氧的革蘭氏陽性菌：

*Corynebacterium species*¹、*Micrococcus luteus*¹、*Staphylococcus aureus*、*Staphylococcus epidermidis*、*Staphylococcus haemolyticus*、*Staphylococcus hominis*、*Staphylococcus warneri*¹、*Streptococcus pneumoniae*、*Streptococcus viridans group*

好氧的革蘭氏陰性菌：

*Acinetobacter lwoffii*¹、*Haemophilus influenzae*、*Haemophilus parainfluenzae*¹

其他微生物：

Chlamydia trachomatis

¹對於這些微生物的效果只有少於 10 例感染的研究。

下列菌種也有活體外試驗資料，但是用於眼部感染的臨床意義則尚不清楚。Vigamox 用於治療這些微生物引起的眼部感染之安全性及效果尚未經適當的對照試驗確立。

當以全身性的擊破點來評估時，下列微生物是具敏感性的；然而，活體外試驗的全身性擊破點與用於眼部的療效之間的相關性尚未經確立。表列的微生物僅供做評估眼結膜感染之治療指南。在活體外試驗中，Moxifloxacin 在最小抑菌濃度（MICs）為 2 µg/mL 以下（全身性敏感性擊破點）對下列眼部病原菌的多數

（≥90%）菌株具有活性：

好氧的革蘭氏陽性菌：

Listeria monocytogenes、*Staphylococcus saprophyticus*、*Streptococcus agalactiae*、*Streptococcus mitis*、*Streptococcus pyogenes*、*Streptococcus Group C,G and F*

好氧的革蘭氏陰性菌：

Acinetobacter baumannii、*Acinetobacter calcoaceticus*、*Citrobacter freundii*、*Citrobacter koseri*、*Enterobacter aerogenes*、*Enterobacter cloacae*、*Escherichia coli*、*Klebsiella oxytoca*、*Klebsiella pneumoniae*、*Moraxella catarrhalis*、*Morganella morganii*、*Neisseria gonorrhoeae*、*Proteus mirabilis*、*Proteus vulgaris*、*Pseudomonas stutzeri*

厭氧菌：

Clostridium perfringens、*Fusobacterium species*、*Prevotella species*、*Propionibacterium acnes*

其他病原體：

Chlamydia pneumoniae、*Legionella pneumophila*、*Mycobacterium avium*、*Mycobacterium marinum*、*Mycoplasma pneumoniae*

臨床研究：

在兩個採隨機、雙盲、對照設計的多中心臨床試驗中，以 Vigamox 點眼液治療細菌性結膜炎，每日使用 3 次，持續治療 4 天，在第 5 至 6 天時，有 66% 至 69% 病人達到臨床上痊癒的效果；微生物學上以消除治療前的病原菌來看，則達到 84% 至 94% 的成功率。請注意：在抗感染試驗中，微生物學上病原菌的消除與臨床結果並不總是相關。

適應症及用途：

治療下列微生物具感受性的菌株所引起的細菌性結膜炎。

好氧性革蘭氏陽性菌：

*Corynebacterium species*¹、*Micrococcus luteus*¹、*Staphylococcus aureus*、*Staphylococcus epidermidis*、*Staphylococcus haemolyticus*、*Staphylococcus hominis*、*Staphylococcus warneri*¹、*Streptococcus pneumoniae*、*Streptococcus viridans group*

好氧性革蘭氏陰性菌：

*Acinetobacter Iwoffii*¹、*Haemophilus influenzae*、*Haemophilus parainfluenzae*¹

其他：

Chlamydia trachomatis

¹對此細菌有效性的研究少於 10 個感染數。

禁忌： 對 moxifloxacin 或其他 quinolone 類藥品或本品任何其他成分過敏者禁止使用。

警告： 不可作為注射劑使用。

不可於結膜下注射 Vigamox，也不可直接注入眼睛前房。

曾有報告指出，接受全身性 quinolone 類藥品（包括 moxifloxacin）治療的病人，發生嚴重的、有時甚至是致死性的過敏（無防禦性）反應，其中有些是在第一次給藥後發生。有些反應伴隨著心血管衰弱、喪失意識、血管水腫（包括喉部、咽部及臉部水腫）、氣道阻塞、呼吸困難、蕁麻疹及癢。假如對 moxifloxacin 發生過敏反應，請停用本藥品。嚴重的急性過敏反應可能需要立即進行急救治療，並應視臨床狀況使用氧氣及施行氣道處理。

注意事項：

一般：

和其他抗菌製劑一樣，長期使用可能導致非敏感性微生物（包括黴菌）過度生長。若發生重複感染時，應停藥並採取適當的替代治療方式。當臨床判定有需要時，病人需接受利用放大倍率的輔助工具所進行的檢查，如裂隙燈活體組織顯微鏡或螢光染色檢查。

應告知病人：若發生感染細菌性結膜炎的症狀時，不要配戴隱形眼鏡。

病人須知：避免瓶口與眼睛、手指及其他地方接觸，以免遭到污染。

全身投予 quinolone 類藥品（包括 moxifloxacin）可能造成過敏反應，甚至是在第一次給藥後就發生。一出現皮疹或過敏反應的徵狀時，請立即停用並求醫。

藥品交互作用：

未曾對 Vigamox 點眼液進行藥物交互作用的研究。在活體外試驗中，moxifloxacin 不會抑制 CYP3A4、CYP2D6、CYP2C9、CYP2C19 及 CPY1A2，因此 moxifloxacin 應該不會改變經由這些細胞色素 P450 異構酶代謝的藥物之藥動學性質。

致癌性、致突變性、生殖力傷害性：

尚未針對 moxifloxacin 進行長期的動物研究以測定其潛在的致癌性；然而，在加入誘發劑及促進劑的加速研究中，大鼠口服 moxifloxacin 劑量達 500 mg/kg/day（以 mg/kg 為基準，約為 50 公斤的成人眼部每日最高建議總量之 21700 倍），持續 38 週之後，並未發

現具有致癌性。

Moxifloxacin 對 Ames 沙門氏菌反轉突變分析中所使用的四種細菌菌株不具致突變性。和其他 quinolone 類藥品一樣，在同一分析中，moxifloxacin 對 TA102 菌株呈陽性反應，這可能是因為 DNA gyrase 受到抑制。在 CHO/HGPRT 哺乳動物細胞基因突變分析中，moxifloxacin 不具致突變性。使用 v79 細胞進行同一試驗時，得到的結果則是模稜兩可。在 v79 染色體畸變分析中，moxifloxacin 具有染色體傷害(Clastogenic)，但在培養的大鼠肝細胞中不會誘發非預定的 DNA 合成。在小鼠微核體試驗及顯性致命試驗中，沒有在活體內造成基因毒性的證據。

口服 moxifloxacin 高達 500 mg/kg/day 的劑量對不會損害雌雄大鼠的生育力，此劑量約為人類眼部每日最高建議劑量之 21700 倍。口服 500 mg/kg/day 對雄大鼠的精蟲型態有輕微影響（頭尾分離），對雌大鼠的發情期也有輕微影響。

懷孕：致畸胎的影響。

懷孕分類 C：懷孕的大鼠在器官形成期，口服 moxifloxacin 最高達 500 mg/kg/day 的劑量（約為人類眼部每日最高建議總量之 21700 倍）並不具致畸胎性；然而卻發現會造成胎兒體重減輕及胎兒骨骼發展略為延遲。懷孕的 Cynomolgus 猴口服 moxifloxacin 高達 100 mg/kg/day 的劑量（約為人類眼部每日最高建議總量之 4300 倍）並未發現致畸胎的證據；在 100 mg/kg/day 的劑量下，胎兒較小的發生率增高。

由於用於懷孕婦女並無適當的對照研究，只有在潛在效益高於對胎兒的潛在傷害時，方可將 Vigamox 點眼液用於懷孕婦女。

哺乳婦女：

雖然可以假設 moxifloxacin 會分泌至人類乳汁中，但是並無法在人類乳汁中偵測出 moxifloxacin。Vigamox 點眼液用於哺乳婦女應謹慎使用。

用於幼兒：

Vigamox 點眼液(moxifloxacin ophthalmic solution) 0.5%在所有年齡層的安全性及效果已確立。Vigamox 點眼液的使用，在成人、兒童以及嬰兒的適當且控制良好之試驗中已得到支持。儘管口服部份 quinolone 類藥品之後可能造成未成熟動物的關節病變，但無任何證據顯示眼用投予 Vigamox 點眼液對承重關節有任何影響。

用於老年人：

在安全性及效果上，老年人和一般成年病人之間，整體上並未發現有所差別。

副作用：

最常見的眼部副作用為結膜炎、視覺敏銳度降低、眼睛乾澀、角膜炎、眼部不適、眼部充

血、眼部疼痛、眼部搔癢、結膜下出血及流淚。這些問題的發生率約為 1-6%。

非眼部副作用發生率介於 1-4%，有：發燒、咳嗽增加、感染、中耳炎、咽炎、皮疹及鼻炎。

用法用量：

本藥須由醫師處方使用。

每次點一滴於患眼，每天三次，連續點藥七天。

包裝：100 公撮以下塑膠瓶裝。

貯存：貯存於 30°C 以下。



製造廠：S.A. ALCON-COUVREUR N.V.

廠址：Rijksweg 14, 2870 Puurs, Belgium

國外許可證持有者：Novartis Pharma AG

地址：Lichtstrasse 35 CH-4056 Basel Switzerland

藥商：台灣諾華股份有限公司

地址：台北市中山區民生東路 3 段 2 號 8 樓

英文版次: CCSI TDOC-0012135 v.2.0/CCDS TDOC-0016945 v.1.0/ US EET Insert (component number: 9014800)

TWI-300921