

**2018年3月改訂(第11版)
*2015年2月改訂

| | |
|------------|---------------|
| 日本標準商品分類番号 | 871319 |
| 承認番号 | 21900AMX01434 |
| 薬価収載 | 2007年12月 |
| 販売開始 | 2000年9月 |
| 再審査結果 | 2004年3月 |
| 再評価結果 | 2004年9月 |

貯 法：室温保存
使用期限：製造後3年(使用期限内であっても、開栓後は速やかに使用すること。)

ニューキノロン系抗菌剤
*処方箋医薬品^注 **ロメフロ[®]ン点眼液0.3%**
LOMEFLON[®] OPHTHALMIC SOLUTION 0.3%
塩酸ロメフロキサシン点眼液

*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)】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

| | |
|-----------------|--------------------------------------|
| 成分・含量 (1mL中) | 塩酸ロメフロキサシン3.31mg (ロメフロキサシンとして3mg) |
| 添加物 | 濃グリセリン、エデト酸ナトリウム水和物、水酸化ナトリウム |
| 剤形 | 水性点眼剤 |
| 色 | 無色澄明 |
| pH | 4.5~5.7 |
| その他 | 無菌製剤 |

【効能・効果】

〈適応菌種〉ロメフロキサシン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、バシラス属、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、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)、シュードモナス属、緑膿菌、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、フラボバクテリウム属、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

【用法・用量】

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。

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。

【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)
類似化合物(キノロン系抗菌剤)に対し過敏症の既往歴のある患者

2. 重要な基本的注意
長期間使用しないこと。

****3. 副作用**

承認時及び使用成績調査*での総症例4,476例中44例(0.98%)に副作用が認められた。

主な副作用は、眼刺激症状(しみる、疼痛、刺激感)24件(0.54%)、痒感11件(0.25%)、眼瞼炎4件(0.09%)、結膜炎3件(0.07%)、結膜充血2件(0.04%)、角膜炎1件(0.02%)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。

*ロメフロ[®]ン眼科用液(ロメフロ[®]ン点眼液0.3%にベンザルコニウム塩化物を含有する製剤)とロメフロ[®]ンミニムス眼科用液0.3%を合わせて行った調査で、ロメフロ[®]ンミニムス眼科用液0.3%の投与症例32例を含む。

(1)重大な副作用

**経口剤で、ショック、アナフィラキシー(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

| | 頻度不明 | 0.1~5%未満 | 0.1%未満 |
|------------------|-----------------|--------------------------|--------------------------|
| 過敏症 ^注 | 過敏症状、 発疹、蕁麻疹 | | |
| 眼 | 菌交代症 | 眼刺激症状(しみる、疼痛、刺激感)、 痒感 | 眼瞼炎、結膜炎、 結膜充血、 角膜炎 |

注)発現した場合には、投与を中止すること。

4. 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。]

5. 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(使用経験がない)。

6. 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。

7. その他の注意

経口投与により、動物実験(幼若イヌ、幼若ラット)で関節異常がみられたとの報告がある。

【薬物動態】

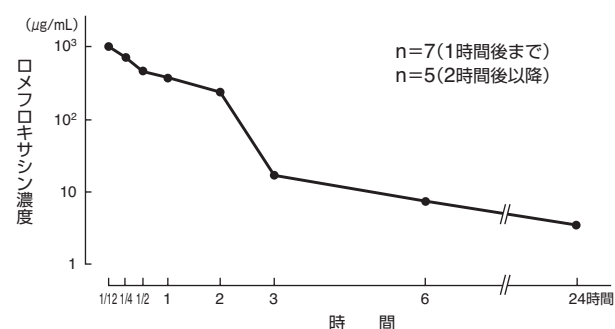
0.3%ロメフロキサシン点眼液を1回1滴、1日5回(承認の用法・用量は1回1滴、1日3回点眼)、2日間点眼し、さらに、翌日に1回1滴、5分間隔で5回点眼して、前房水中のロメフロキサシン濃度を測定したところ、点眼90分後に最高値を示し、その平均は2.69 µg/mL(n=6)である(成人、白内障手術患者)¹⁾。

(参考)

(1)眼内移行(ウサギ)²⁾

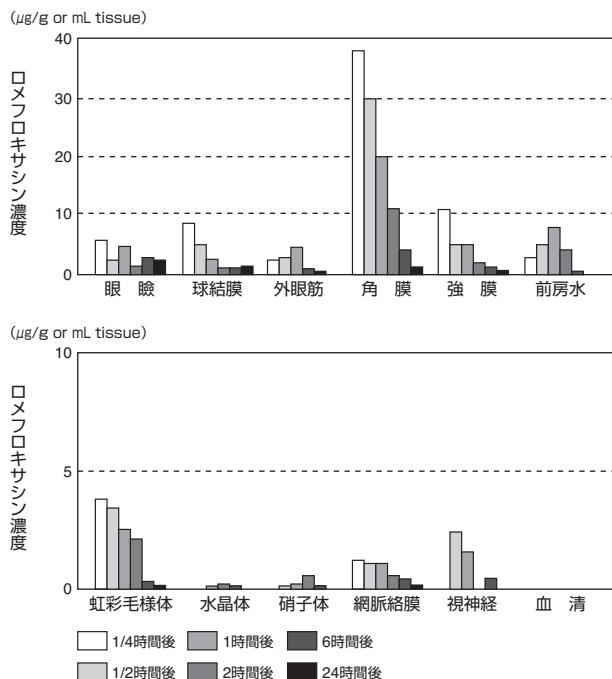
ウサギの正常眼に0.3%ロメフロキサシン点眼液を1回0.05mL、2回点眼した試験では、結膜嚢内滞留濃度の時間的推移は図1のとおりである。

図1 結膜嚢内滞留濃度



ウサギの正常眼に0.3%ロメフロキサシン点眼液を1回0.05mL、5分間隔で5回点眼した試験では、点眼15、30分、1、2、6、24時間後の各組織内のロメフロキサシン濃度の時間的推移は図2のとおりである。なお、水晶体、硝子体、網脈絡膜、視神経への移行はわずかで、血清中にはほとんど検出されていない。

図2 ウサギ眼組織内及び血清中濃度の時間的推移



(2)メラニン親和性〈ウサギ〉³⁾

有色ウサギの正常眼に0.3%ロメフロキサシン点眼液を1回0.05mL、4時間間隔で1日3回、14日間点眼した試験では、最終点眼24時間後の眼組織内濃度は虹彩・毛様体で23.3 µg/g、脈絡膜で47.6 µg/g、前房水で0.016 µg/mLであり、メラニン色素を含む組織には高濃度に分布することが認められている。

【臨床成績】

参考：ロメフロキサシン眼科用液（ロメフロキサシン点眼液0.3%にベンザルコニウム塩化物を含有する製剤）における臨床成績〔眼科領域〕

二重盲検比較対照試験を含む外眼感染症513例についての成績概要は次のとおりである。なお、1日投与量、投与期間は大部分が1回1滴、1日3回、3週間以内である。

表. 外眼感染症に対する臨床効果

| 疾患名 | 有効率(%) 有効以上 |
|--------------|----------------|
| 眼瞼炎 | 100 (15/ 15) |
| 涙嚢炎 | 82.0 (41/ 50) |
| 麦粒腫 | 98.0 (48/ 49) |
| 結膜炎 | 92.6 (313/338) |
| 瞼板腺炎 | 100 (18/ 18) |
| 角膜炎(角膜潰瘍を含む) | 93.1 (27/ 29) |
| その他* | 92.9 (13/ 14) |
| 合計 | 92.6 (475/513) |

*眼瞼炎・結膜炎4例、涙嚢炎・結膜炎4例、結膜炎・角膜炎5例、結膜炎・瞼板腺炎・角膜炎1例

眼手術患者316例を対象に実施した手術前無菌法及び術後感染防止効果の検討においては、全例とも術後感染症は認められなかった。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用

(1)抗菌作用¹⁻⁸⁾

グラム陽性菌及びグラム陰性菌に抗菌作用を示し、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、腸球菌属、マイクロコッカス属、コリネバクテリウム属、アクネ菌、バシラス属、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、シェウドモナス属、フラボバクテリウム属、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)、モラクセラ属、アシネトバクター属に抗菌力を示す (*in vitro*)。

(2)実験的角膜感染症に対する治療効果⁹⁾

ウサギの角膜実質に緑膿菌あるいは表皮ブドウ球菌の臨床分離株を接種して作成した角膜感染症に対し、0.3%ロメフロキサシン点眼液又は対照として基剤を点眼した試験では、ロメフロキサシン点眼液点眼群では角膜感染症状の抑制を示した。

2. 作用機序⁹⁾

細菌のDNAジャイレースに作用し、DNA合成を阻害する。抗菌作用は殺菌的であり、最小殺菌濃度は最小発育阻止濃度とほぼ一致している。

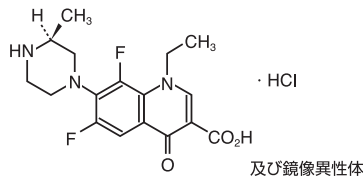
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：塩酸ロメフロキサシン

(Lomefloxacin Hydrochloride) [JAN] 略号：LFLX

化学名：(RS)-1-Ethyl-6, 8-difluoro-1, 4-dihydro-7-(3-methylpiperazin-1-yl)-4-oxoquinoline-3-carboxylic acid monohydrochloride

構造式：



分子式：C₁₇H₁₉F₂N₃O₃ · HCl

分子量：387.81

性状：塩酸ロメフロキサシンは、白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

水又はエチレングリコールに溶けにくく、メタノールに極めて溶けにくく、エタノール(95)にほとんど溶けない。

水酸化ナトリウム試液に溶ける。

水酸化ナトリウム試液溶液(1→40)は旋光性を示さない。

融点：約310℃(分解、乾燥後)

【包装】

5mL×10、5mL×50

【主要文献】

- 1) 児玉俊夫：眼科臨床医報, 85, 493, 1991.
- 2) 大石正夫他：日本眼科学会雑誌, 92, 1825, 1988.
- 3) 寺井 正他：あたらしい眼科, 10, 2067, 1993.
- 4) 廣瀬 徹他：Chemotherapy, 36(S-2), 1, 1988.
- 5) 横田 健他：Chemotherapy, 36(S-2), 25, 1988.
- 6) 五島瑛智子他：Chemotherapy, 36(S-2), 36, 1988.
- 7) 西野武志他：Chemotherapy, 36(S-2), 57, 1988.
- 8) 楠崎英一他：Chemotherapy, 36(S-2), 99, 1988.
- 9) 栗山 裕他：日本眼科紀要, 44, 434, 1993.

【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

** 〒541-0048 大阪市中央区瓦町三丁目1番9号

TEL 0120-069-618 FAX 06-6201-0577

受付時間 9:00~17:30 (土、日、祝日を除く)

製造販売元 千寿製薬株式会社
** 大阪市中央区瓦町三丁目1番9号

販売 武田薬品工業株式会社
大阪市中央区道修町四丁目1番1号