＊2026年10月改訂（第2版）
2023年11月改訂（第1版）

日本標準商品分類番号
871319

貯　　法：室温保存
有効期間：3年

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

アシクロビル眼軟膏3%「ニットー」

Aciclovir Ophthalmic Ointment 3%「NITTO」

承認番号	22700AMX00563000
販売開始	2015年6月

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

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	アシクロビル眼軟膏3%「ニットー」
有効成分	1g中　日局 アシクロビル　30mg
添加剤	白色ワセリン、流動パラフィン

3.2 製剤の性状

販売名	アシクロビル眼軟膏3%「ニットー」
性状	白色の無菌眼軟膏剤

4. 効能又は効果

単純ヘルペスウイルスに起因する角膜炎

6. 用法及び用量

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。

7. 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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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[1]。

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。

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。

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

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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人10例の片眼に3%アシクロビル眼軟膏を1日5回、14日間連続投与したとき、最終投与後の血漿中アシクロビル濃度は定量下限未満（＜0.23μg/mL）であった[2]。

16.3 分布

16.3.1 眼房水中移行

白内障患者25眼に、アシクロビル眼軟膏を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1.7μg/mLであった[3]（外国人データ）。

注）本剤の効能・効果は単純ヘルペスウイルスに起因する角膜炎である。

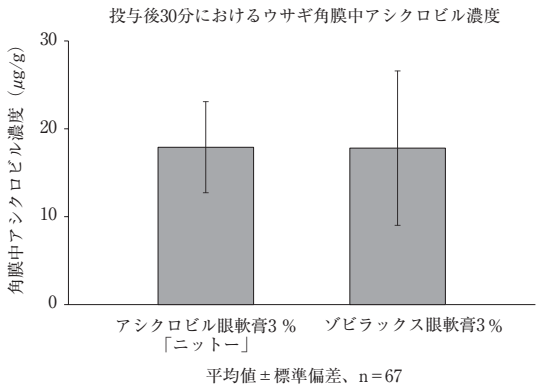
16.3.2 生物学的同等性試験

ウサギを用いた眼組織内濃度測定

アシクロビル眼軟膏3%「ニットー」とゾビラックス眼軟膏3%をそれぞれウサギに片眼ずつ投与し、30分後の角膜中アシクロビル未変化体濃度について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された[4]。

	角膜中アシクロビル濃度（μg/g）
アシクロビル眼軟膏3%「ニットー」	17.9±5.2
ゾビラックス眼軟膏3%	17.8±8.8

（平均値±標準偏差、n=67）



平均値±標準偏差、n＝67

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 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を対象に、アシクロビル眼軟膏及びイドクスウリジン眼軟膏を1日5回、原則2週間投与した結果、有効率はアシクロビル眼軟膏群98.1%（53/54）、イドクスウリジン眼軟膏群81.8%（45/55）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。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。

アシクロビル眼軟膏群の副作用発現頻度は24.1%（13/54）であり、主な副作用は、びまん性表層角膜炎22.2%（12/54）であった[5]。

17.1.2 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、アシクロビル眼軟膏を1日5回、原則2週間投与した結果、有効率は96.7%（89/92）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25.0%（23/92）であり、主な副作用は、びまん性表層角膜炎23.9%（22/92）であった[2)]。

17.1.3 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、アシクロビル眼軟膏を1日5回、原則2週間投与した結果、有効率は80%（20/25）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）であり、副作用は、全てびまん性表層角膜炎であった[6)]。

18. 薬効薬理

18.1 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[7)～10)]。

18.2 抗ウイルス作用

18.2.1 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0.01～1.25μg/mL及び0.01～3.20μg/mLであった[11),12)]。

18.2.2 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[13)]。

18.3 生物学的同等性試験

ウサギ単純ヘルペスウイルス1型（HSV-1）角膜感染モデルに対する効果

アシクロビル眼軟膏3%「ニットー」とゾビラックス眼軟膏3%について、ウサギ単純ヘルペスウイルス1型（HSV-1）角膜感染モデルに対する治療効果の比較を行った。その結果、両剤ともに対照（白色ワセリン）に対して有意に治療効果を示し、両剤の治療効果に有意な差は認められなかった[4)]。

19. 有効成分に関する理化学的知見

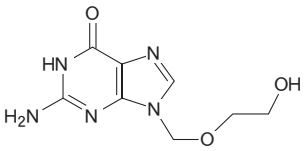
一般名：アシクロビル（Aciclovir）

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

分子式：$C_8H_{11}N_5O_3$

分子量：225.20

構造式：



性状：アシクロビルは白色～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。

22. 包装

5g［1チューブ］

23. 主要文献

1）Stahlmann R, et al.：Infection. 1987；15：261-262
2）塩田洋ほか：臨床眼科. 1982；36（11）：1405-1414
3）Poirier RH, et al.：Arch Ophthalmol. 1982；100：1964-1967
4）社内資料：アシクロビル眼軟膏3%「ニットー」の生物学的同等性試験
5）北野周作ほか：眼科臨床医報. 1983；77（8）：1273-1280
6）西田輝夫ほか：日本眼科紀要. 1983；34（5）：1173-1178
7）St Clair MH, et al.：Antimicrob Agents Chemother. 1980；18（5）：741-745
8）Furman PA, et al.：J Virol. 1979；32（1）：72-77
9）Furman PA, et al.：Antimicrob Agents Chemother. 1981；20（4）：518-524
10）Miller WH, et al.：J Biol Chem. 1980；255（15）：7204-7207
11）Al-Hasani AM, et al.：J Antimicrob Chemother. 1986；18（Suppl. B）：113-119
12）McLaren C, et al.：Am J Med. 1982；73（1A）：376-379
13）Bauer DJ, et al.：Br J Ophthalmol. 1979；63：429-435

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日東メディック株式会社　おくすり相談窓口
〒104-0031　東京都中央区京橋1-10-7
電話：03-3523-0345
FAX：03-6264-4086

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

東亜薬品株式会社
富山県富山市水橋開発277番10

26.2 発売元

日東メディック株式会社
富山県富山市八尾町保内1－14－1