

貯法：室温保存

有効期間：3年 処方箋医薬品<sup>注</sup>

## ノルフロキサシン点眼液0.3%「ツルハラ」

Norfloxacin Ophthalmic solution

承認番号 30100AMX00405000

販売開始 2000年6月

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

ノルフロキサシン又はキノロン系合成抗菌剤に対し過敏症の既往歴のある患者

## 3. 組成・性状

## 3.1 組成

有効成分	1mL中 ノルフロキサシン 3.0mg
添加剤	エデト酸ナトリウム水和物、酢酸ナトリウム水和物、塩酸、水酸化ナトリウム、塩化ナトリウム

## 3.2 製剤の性状

剤形	水性点眼剤
pH	5.0~5.6
浸透圧比	0.9~1.1 (0.9%生理食塩液に対する比)
色調・性状	無色透明の液、無菌製剤

## 4. 効能又は効果

## 〈適応菌種〉

本剤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、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、パークホルデリア・セパシア、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、アルカリゲネス属

## 〈適応症〉

眼瞼炎、涙囊炎、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

## 6. 用法及び用量

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。

## 8. 重要な基本的注意

8.1 本剤の投与にあたっては、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小限の期間の投与にとどめること。

8.2 長期間投与しないこと。

## 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

	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
眼	しみるなどの眼刺激症状	そう痒感、結膜充血、眼瞼の腫脹・発赤、表在性角膜炎、角膜上皮剥離	角膜沈着物

## 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。  
・薬液汚染防止のため、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。  
・点眼に際しては、原則として仰臥位をとり、患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1~5分間開瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。  
・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔を空けてから点眼すること。

## 16. 薬物動態

## 16.1 血中濃度

健康成人に0.3%ノルフロキサシン点眼液を1回2滴、1日4回点眼で14日間投与したとき<sup>注1</sup>、最終投与日の3回目の点眼1時間後の血中濃度は、測定限界値（0.005 $\mu$ g/mL）以下であった<sup>1</sup>）。

## 16.3 分布

## 16.3.1 眼内移行

眼手術患者に0.3%ノルフロキサシン点眼液を術前0.5~3.0時間の間に数回点眼したとき<sup>注2</sup>の前房水中濃度は、点眼後90分に最高値（0.36 $\mu$ g/mL）を示した<sup>2</sup>）。

## 16.3.2 結膜嚢内濃度

0.3%ノルフロキサシン点眼液をウサギ正常眼に1回2滴点眼したときの結膜嚢内滞留濃度は、点眼後30分で305 $\mu$ g/mL、1時間で77.0 $\mu$ g/mLであり、6時間後で8.9 $\mu$ g/mLであった<sup>3</sup>）。

## 16.3.3 眼組織内濃度

(1) 0.3%ノルフロキサシン点眼液を白色ウサギ正常眼に1回2滴5分毎に5回点眼したとき、眼球内部組織に比べて外眼部で濃度が高く、最高濃度は角膜で7.84 $\mu$ g/g（15分後）、眼瞼で6.55 $\mu$ g/g（30分後）、球結膜で5.76 $\mu$ g/g（15分後）であり、前房水中には0.68 $\mu$ g/mL（2時間後）、虹彩・毛様体で0.65 $\mu$ g/g（30分後）、脈絡膜で0.26 $\mu$ g/g（15分後）と少なく、血清中では0.020 $\mu$ g/mL（15分後）と極めて少なかった。  
また、角膜炎症眼では正常眼に比べてより高い移行濃度を示した<sup>4</sup>）。

(2) 0.3% [<sup>14</sup>C]-ノルフロキサシン溶液を有色ウサギ正常眼に1回1滴1日5回14日間点眼したとき、最終点眼24時間後の眼組織内濃度は虹彩・毛様体で3.00 $\mu$ g・eq/g、脈絡膜・網膜色素上皮で3.65 $\mu$ g・eq/g、色素上皮を除く網膜で測定限界以下であり、メラニン色素を含む組織には高度に分布することが認められた<sup>5</sup>）。

注) 本剤の承認された用法・用量は通常、1回1滴、1日3回である。

## 17. 臨床成績

## 17.1 有効性及び安全性に関する試験

## 〈眼科周術期の無菌化療法〉

## 17.1.1 国内臨床試験（術後感染症に対する効果）

眼手術患者327例を対象とした0.3%ノルフロキサシン点眼液の臨床試験において、全例とも術後感染は認められなかった<sup>2</sup>）。

## 18. 薬効薬理

## 18.1 作用機序

細菌のDNAの高次構造を変換するDNA gyraseに作用し、DNA複製を阻害することにより、殺菌的に作用する<sup>6</sup>）。

## 18.2 生物学的同源性試験

緑膿菌接種によって起こるウサギ角膜混濁に対し、ノルフロキサシン点眼液0.3%「ツルハラ」あるいはノフロ点眼液は菌接種1時間前の1回投与あるいは接種後2時間目からの1日6回8日目までの投与により有意な抑制作用を示し、両製剤間には有意な差はみられなかった。この結果よりノルフロキサシン点眼液0.3%「ツルハラ」とノフロ点眼液は生物学的に同等であることが確認された<sup>7</sup>）。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ノルフロキサシン（Norfloxacin）[JAN]

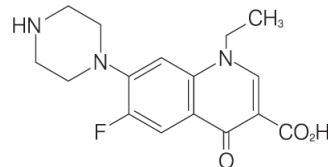
化学名：1-Ethyl-6-fluoro-4-oxo-7-(piperazin-1-yl)-1,4-dihydroquinoline-3-carboxylic acid

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>18</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>

分子量：319.33

性状：本品は白色～微黄色の結晶性の粉末である。  
本品は酢酸（100）に溶けやすく、エタノール（99.5）又はアセトンに溶けにくく、メタノールに極めて溶けにくく、水にはほとんど溶けない。  
本品は希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。  
本品は吸湿性である。  
本品は光によって徐々に着色する。

## 化学構造式：



略号：NFLX

## 20. 取扱い上の注意

20.1 長期間低温に保存しないこと。  
20.2 外箱開封後は遮光して保管すること。

## 22. 包装

5mL【ポリエチレン製容器】×10

## 23. 主要文献

- 1) 田村修, 他.: Clin. Eval. 1987;15:577-599
- 2) 田村修, 他.: あたらしい眼科. 1988;5:453-462
- 3) 北野周作, 他.: あたらしい眼科. 1987;4:1150-1153
- 4) 大石正夫, 他.: 日眼会誌. 1987;91:161-167

- 5) 石田了三, 他. :あたらしい眼科. 1993 ;10 (12) :2061-2066
- 6) 平井敬二, 他. :Chemotherapy. 1990 ;38 (S-2) :1-10
- 7) 社内資料 ; 生物学的同等性試験

#### 24. 文献請求先及び問い合わせ先

鶴原製薬株式会社 医薬情報部  
〒563-0036 大阪府池田市豊島北1丁目16番1号  
TEL : 072-761-1456 (代表) FAX : 072-760-5252

#### 26. 製造販売業者等

##### 26.1 製造販売元

## 鶴原製薬株式会社

大阪府池田市豊島北1丁目16番1号