



\*2012年1月改訂(第2版)  
2009年8月作成

日本標準商品分類番号  
871319

承認番号	21900AMX00105000
薬価収載	2007年6月
販売開始	2007年6月
効能追加	1992年11月
再審査結果	1998年3月
再評価結果	2004年9月

広範囲抗菌点眼剤

# ノフロ点眼液 0.3%

処方せん医薬品：注意－医師等の処方せんにより  
使用すること

貯法：気密容器、しゃ光、室温保存  
(長期間低温に保存しないこと。)

使用期間：3年  
使用期限：外箱に表示

NOFLO Ophthalmic Solution 0.3%  
ノルフロキサシン点眼液

**【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

**【組成・性状】**

販売名	ノフロ点眼液 0.3%
剤形	点眼剤
有効成分の名称	日本薬局方 ノルフロキサシン
含量：1mL中にノル フロキサシンとして	3.0mg
容量	5mL
添加物	酢酸 Na、エデト酸 Na、塩化 Na、塩酸
pH	5.0～5.6
浸透圧比	約1 (生理食塩液に対する比)
性状	無色澄明、無菌水性点眼剤

**【効能・効果】**

<適応菌種>

本剤に感性的ブドウ球菌属、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

**【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>

- (1) 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。
- (2) 点眼用のみ使用すること。

**【使用上の注意】**

1. 重要な基本的注意

長期間使用しないこと。

2. 副作用

臨床試験 (治験)

総症例 1,060 例中、副作用が報告されたのは 27 例 (2.55%) であ  
った。主な副作用症状として、しみるなどの眼刺激症状 27 例  
(2.55%)、痒感 1 例 (0.09%) 等がみられた。

使用成績調査 (再審査終了時)

総症例 11,288 例中、副作用が報告されたのは 156 例 (1.38%) で  
あった。主な副作用症状として、しみるなどの眼刺激症状 122 例  
(1.08%)、結膜充血 10 例 (0.09%)、痒感 9 例 (0.08%)、眼瞼  
発赤 4 例 (0.04%)、眼瞼腫脹 4 例 (0.04%) 等がみられた。

(1) その他の副作用

次のような症状又は異常があらわれた場合には、投与を中止す  
るなど適切な処置を行うこと。

種類/頻度	頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
眼	角膜沈着物	しみるなどの 眼刺激症状	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

**【薬物動態】**

1. 血中濃度

健康成人眼に本剤を1回2滴、1日4回点眼で14日間点眼したとき、最終投与日  
の3回目点眼1時間後の血中濃度は、測定限界値(0.005 μg/mL)以下で  
あった。<sup>1)</sup>

2. 眼内移行

眼手術患者に本剤を術前0.5～3.0時間に数回点眼したときの前房水中濃度  
は点眼後90分に最高値(0.36 μg/mL)を示した。<sup>2)</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。

(参考)

(1) 結膜嚢内濃度

本剤をウサギ正常眼に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 μg/g(30分後)、1時間で77.0 μg/g(15分後)であり、6時間後でも  
8.9 μg/gであった。<sup>3)</sup>

(2) 眼組織内濃度

1) 本剤を白色ウサギ正常眼に1回2滴5分ごとに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 μg/  
g(15分後)、眼瞼で6.55 μg/g(30分後)、球結膜で5.76 μg/g(15分  
後)であり、前房水中には0.68 μg/mL(2時間後)、虹彩・毛様体で0.65  
μg/g(30分後)、脈絡膜で0.26 μg/g(15分後)と少なく、血清中では  
0.020 μg/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 μg・eq/g、脈絡膜・網膜色素上皮で3.65 μg・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>

**【臨床成績】**

1. 疾患別臨床効果

比較試験を含む臨床試験 636 例における各疾患別臨床効果は表 1 のとおりで、  
いずれの疾患においても高い有効率を示す成績が得られた。また、外眼部感  
染症を対象とした比較試験において本剤の有用性が認められている。

表 1 疾患別臨床効果<sup>3)</sup>

結膜炎	93.8%	(406/433)
眼瞼炎	96.7%	(29/30)
麦粒腫	96.0%	(48/50)
瞼板腺炎	95.5%	(21/22)
涙囊炎	81.0%	(64/79)
角膜炎	96.7%	(29/30)
角膜潰瘍	83.3%	(15/18)

(注) 複数の疾患が合併している場合は各々の疾患に1例として算入

2. 適応菌種別臨床効果

上記の636例における適応菌種別臨床効果は表2のとおりで、いずれの菌種に対しても高い有効率を示す成績が得られた。

表2 適応菌種別臨床効果<sup>注)</sup>

ブドウ球菌属	90.3%	(269/298)
レンサ球菌属 (肺炎球菌を除く)	94.1%	(48/51)
肺炎球菌	92.0%	(69/75)
腸球菌属	90.9%	(10/11)
コリネバクテリウム属	90.4%	(66/73)
マイクロコッカス属	90.9%	(10/11)
バシラス属	94.4%	(17/18)
ブランハメラ・カタラーリス	100.0%	(15/15)
クレブシエラ属	100.0%	(8/8)
エンテロバクター属	93.3%	(14/15)
セラチア属	100.0%	(19/19)
プロテウス属	100.0%	(2/2)
シュードモナス属 (緑膿菌を除く)	88.2%	(67/76)
緑膿菌	100.0%	(7/7)
フラボバクテリウム属	100.0%	(11/11)
インフルエンザ菌	100.0%	(72/72)
ヘモフィルス・エジプチウス (コッホ・ウィークス菌)	100.0%	(24/24)
モラクセラ属	97.0%	(32/33)
アシネトバクター属	90.6%	(29/32)
アルカリゲネス属	92.3%	(12/13)

注) 複数の菌種が検出された場合は各々の菌種に1例として算入

3. 術後感染症に対する効果

眼手術患者327例を対象とした本剤の臨床試験において、全例とも術後感染はみられなかった。<sup>2)</sup>

※疾患名・菌種名は承認申請資料に基づき記載している。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用

抗菌スペクトルは広範囲に及び、ブドウ球菌属、肺炎球菌を含むレンサ球菌属、腸球菌属、コリネバクテリウム属、マイクロコッカス属、バシラス属等のグラム陽性菌及びブランハメラ・カタラーリス、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、緑膿菌を含むシュードモナス属、フラボバクテリウム属、ヘモフィルス属、モラクセラ属、アシネトバクター属、アルカリゲネス属等のグラム陰性菌の眼感染症の起炎菌に対し、強い抗菌力を示す (*in vitro*)。<sup>6)~8)</sup>

2. 実験的緑膿菌性角膜感染症に対する作用

ウサギに本剤を1回1滴点眼し、1時間後緑膿菌を接種したところ、発症の予防又は病変の進行の遅延が認められた。また、菌接種後から2時間ごとに1回1滴で1日6回、3日間点眼したところ病変は認められなかった。<sup>9)</sup>

3. 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>10)</sup>

4. 耐性獲得

- (1) Rプラスミド上からは本剤の耐性遺伝子はみつかっていない。
- (2) 継代培養による耐性獲得実験においてナリジクス酸及びピベミド酸に比べ耐性が獲得されにくい。<sup>11)</sup>

※菌種名は承認申請資料に基づき記載している。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ノルフロキサシン (Norfloxacin)

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

略号：NFLX

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

分子量：319.33

融点：220~224℃

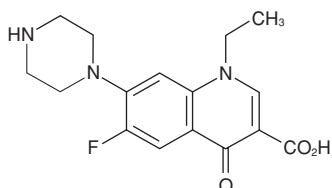
性状：白色〜微黄色の結晶性の粉末である。酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(99.5)又はアセトンに溶けにくく、メタノールに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。

希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。

吸湿性である。

光によって徐々に着色する。

構造式：



【包装】

1瓶(5mL)：10瓶、50瓶

【主要文献】

- 1) 田村 修 他：Clin. Eval., 15(3)：577, 1987
- 2) 田村 修 他：あたらしい眼科, 5(3)：453, 1988
- 3) 北野周作 他：あたらしい眼科, 4(8)：1150, 1987
- 4) 大石正夫 他：日眼会誌, 91(1)：161, 1987
- 5) 石田了三 他：あたらしい眼科, 10(12)：2261, 1993
- 6) 市川一夫 他：あたらしい眼科, 5(3)：431, 1988
- 7) 調枝寛治 他：あたらしい眼科, 5(3)：443, 1988
- 8) 井上慎三 他：あたらしい眼科, 5(4)：593, 1988
- 9) 中村 聡 他：眼科臨床医報, 81(10)：2252, 1987
- 10) 平井敬二 他：Chemotherapy, 38(S-2)：1, 1990
- 11) 伊藤 明 他：Chemotherapy, 29(S-4)：66, 1981

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎(0120)517-215

Fax(076)442-8948

\*

