

内科領域におけるbalofloxacinの基礎的、臨床的検討

澤江義郎**・岡田 薫・高木宏治・三角博康・下野信行・

久保井 礼・江口克彦・仁保喜之

九州大学医学部第一内科*, 医療技術短期大学部**

新しい経口用キノロン系薬のbalofloxacin (BLFX) について基礎的、臨床的検討を行った。①九州大学第一内科入院患者由来の11種247株に対するBLFXの最小発育阻止濃度(MIC)は、グラム陽性菌の*Staphylococcus aureus*, *Enterococcus faecalis*に対しては対照薬のtosufloxacinとほぼ同等で、ofloxacin, ciprofloxacinよりも2管ないしそれ以上すぐれていた。一方、*Escherichia coli*, *Citrobacter freundii*, *Klebsiella pneumoniae*, *Enterobacter* spp. *Proteus* spp. 等のグラム陰性桿菌に対しては対照薬にやや劣るものの、MIC₉₀はすべて3.13 μ g/ml以下であった。しかし、*Pseudomonas aeruginosa*に対してはMIC₅₀, MIC₉₀がそれぞれ6.25, 50 μ g/mlとやや劣った。②臨床的検討では1回100~200mg1日2回を4~21日、10例(うち2例は同一症例)の患者に経口投与し、呼吸器感染症7例では著効1例、有効5例、やや有効1例であった。また、大腸炎1例は有効、膀胱炎2例は著効、有効各1例であった。本剤投与に起因すると思われる副作用、臨床検査値の異常変動は1例も認められなかった。

Key words : balofloxacin, 抗菌活性, 内科感染症, 臨床評価

新しく開発された経口用キノロン系薬であるbalofloxacin (BLFX, 開発コードQ-35) は、グラム陽性菌からグラム陰性菌、嫌気性菌にまで及ぶ幅広い抗菌スペクトルを有しているが¹⁾、とくに従来のキノロン系抗菌薬の弱点であったブドウ球菌、肺炎球菌、嫌気性菌、マイコプラズマ、クラミジアに対しても強い抗菌力を示すと報告されている²⁻⁴⁾。また、これらの作用は殺菌的である。本剤は経口投与により高い血中濃度が得られ、その血中濃度半減期は7~8時間であり、病巣組織への移行も良好であるといわれている^{1,5)}。また、8位にメトキシ基を導入したため光線に安定となり⁶⁾、光線過敏症の発現が低下したといわれ⁷⁾、本剤投与による痙攣誘発作用も低いと報告されている^{8,9)}。

今回、著者らはBLFXの臨床分離株に対する抗菌活性を測定するとともに、内科領域の感染症に対する本剤の有用性を検討したので報告する。

I. 材料および方法

1. 臨床分離株に対する抗菌力測定

九州大学第一内科入院患者由来の各種臨床分離株から主として平成2年1月から平成3年11月までの間に分離されたmethicillin-sensitive *Staphylococcus aureus* (MSSA) 27株, methicillin-resistant *S. aureus* (MRSA) 27株, *Enterococcus faecalis* 27株, *Escherichia coli* 26株, *Citrobacter freundii* 27株, *Klebsiella pneumoniae* 27株, *Enterobacter cloacae* 16株, *Enterobacter aerogenes* 16株, *Proteus mirabilis* 9株, *Proteus vulgaris* 18株, *Pseudomonas aeru-*

ginosa 27株について日本化学療法学会標準法¹⁰⁾に準じてBLFXの最小発育阻止濃度(MIC)を測定し、同時に測定したofloxacin (OFLX), ciprofloxacin (CPFX), tosufloxacin (TFLX)のMICと比較検討した。なお、測定用培地としてMuellar-Hinton寒天培地(BBL)を用い、接種菌液は感受性ブイヨン培地(栄研)で一夜増菌培養したものを滅菌生理食塩液で100倍に希釈して用いた。

2. 臨床的有用性の検討

平成4年2月から平成5年3月までの間に九州大学第一内科を受診した外来患者のうちで、本試験参加の同意が得られた10例(うち2例は同一症例)で、その内訳は肺炎3例、扁桃炎1例、急性気管支炎2例、慢性気管支炎1例、大腸炎1例、膀胱炎2例であった。本剤の投与方法は1回100~200mgを1日2回経口投与し、投与期間は3~14日間を原則としたが、21日まで延長した症例もあった。また、他の抗菌薬は併用しないこととした。

臨床効果は自覚症状の推移、起炎菌の動向および検査値の改善等により判定した。その基準は原則として、自覚症状の改善とともに起炎菌の消失、検査成績の正常化がみられたものを「有効」とし、とくに1週間以内に有効であったものを「著効」とした。自覚症状の改善がみられても検査成績の改善が不十分なものを、および自覚症状の改善が十分でないものを「やや有効」、さらに自覚症状の改善や検査成績の正常化がみられなかったものを「無効」とした。

細菌学的効果は起炎菌の消長を「菌消失」、「菌減少」、

「菌不変」, 「菌交代」の4段階で判定し, 起炎菌を明らかにできなかった場合は「不明」とした。

副作用に関しては, 患者の訴えをよく聞き, 臨床症状の詳細な観察を行うとともに, 血液学的検査, 血液生化学的検査, 尿検査等を可能な限り定期的に行い, その成績を日本化学療法学会「抗菌薬による治験症例における副作用, 臨床検査値異常の判定基準」¹¹⁾を参考にして判定した。

II. 成績

1. 臨床分離株に対する抗菌活性

Table 1に臨床分離株に対するBLFX, OFLX, CFPXおよびTFLXのMIC分布範囲, MIC₅₀, MIC₉₀値を示した。

まず, グラム陽性球菌についてみるとMSSAに対するBLFXのMICはすべて0.39 μ g/ml以下で, MIC₅₀, MIC₉₀はそれぞれ0.10, 0.20 μ g/mlで, TFLXとほぼ同等, OFLX, CFPXよりも2管ないしそれ以上すぐれていた。MRSAに

Table 1. Antimicrobial activity of balofloxacin, ofloxacin, ciprofloxacin and tosufloxacin

Organism (No. of strains)	Drugs	MIC (μ g/ml)		
		range	MIC ₅₀	MIC ₉₀
Methicillin-sensitive <i>Staphylococcus aureus</i> (27)	balofloxacin	$\leq 0.05-0.39$	0.10	0.20
	ofloxacin	0.20-1.56	0.39	1.56
	ciprofloxacin	0.10-3.13	0.39	3.13
	tosufloxacin	$\leq 0.05-0.39$	≤ 0.05	0.39
Methicillin-resistant <i>Staphylococcus aureus</i> (27)	balofloxacin	0.39-12.5	6.25	12.5
	ofloxacin	1.56-100	50	100
	ciprofloxacin	3.13-100<	50	100
	tosufloxacin	0.39-100<	100<	100<
<i>Enterococcus faecalis</i> (27)	balofloxacin	0.39-100	0.78	12.5
	ofloxacin	1.56-100<	3.13	100
	ciprofloxacin	0.39-100<	1.56	50
	tosufloxacin	0.20-100<	0.39	100<
<i>Escherichia coli</i> (26)	balofloxacin	$\leq 0.05-1.56$	0.20	1.56
	ofloxacin	$\leq 0.05-0.78$	0.10	0.78
	ciprofloxacin	$\leq 0.05-0.20$	≤ 0.05	0.20
	tosufloxacin	$\leq 0.05-0.39$	≤ 0.05	0.20
<i>Citrobacter freundii</i> (27)	balofloxacin	0.20-100<	0.39	3.13
	ofloxacin	$\leq 0.05-100<$	0.10	0.39
	ciprofloxacin	$\leq 0.05-100<$	≤ 0.05	0.10
	tosufloxacin	$\leq 0.05-100<$	≤ 0.05	0.39
<i>Klebsiella pneumoniae</i> (27)	balofloxacin	0.20-50	0.39	1.56
	ofloxacin	0.10-25	0.20	0.20
	ciprofloxacin	$\leq 0.05-12.5$	≤ 0.05	0.10
	tosufloxacin	$\leq 0.05-100<$	≤ 0.05	0.10
<i>Enterobacter cloacae</i> (16)	balofloxacin	0.20-3.13	0.39	3.13
	ofloxacin	0.10-0.78	0.20	0.78
	ciprofloxacin	$\leq 0.05-0.20$	≤ 0.05	0.20
	tosufloxacin	$\leq 0.05-0.39$	≤ 0.05	0.39
<i>Enterobacter aerogenes</i> (16)	balofloxacin	0.20-3.13	0.39	3.13
	ofloxacin	0.10-0.78	0.20	0.18
	ciprofloxacin	$\leq 0.05-0.20$	≤ 0.05	0.20
	tosufloxacin	$\leq 0.05-0.39$	≤ 0.05	0.39
<i>Proteus mirabilis</i> (9)	balofloxacin	0.39-3.13	0.78	3.13
	ofloxacin	0.10-1.56	0.10	1.56
	ciprofloxacin	$\leq 0.05-0.39$	≤ 0.05	0.39
	tosufloxacin	0.10-0.78	0.20	0.78
<i>Proteus vulgaris</i> (18)	balofloxacin	0.39-1.56	0.78	1.56
	ofloxacin	$\leq 0.05-0.20$	0.10	0.20
	ciprofloxacin	≤ 0.05	≤ 0.05	≤ 0.05
	tosufloxacin	$\leq 0.05-0.20$	0.10	0.20
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> (27)	balofloxacin	1.56-100<	6.25	50
	ofloxacin	0.39-100	3.13	12.5
	ciprofloxacin	0.10-25	0.39	3.13
	tosufloxacin	0.10-100<	0.78	3.13

対しては0.39~12.5 μ g/mlに分布し、MIC₅₀、MIC₉₀はそれぞれ6.25、12.5 μ g/mlであり、すべての対照薬に比し3管ないしそれ以上すぐれていた。*E. faecalis*ではBLFXは0.39~100 μ g/mlに分布し、MIC₅₀、MIC₉₀はそれぞれ0.78、12.5 μ g/mlで、TFLXのMIC₅₀ 0.39 μ g/mlには劣ったが、他の対照薬より1~4管すぐれていた。

*E. coli*は \leq 0.05~1.56 μ g/mlに分布し、MIC₅₀ 0.20、MIC₉₀ 1.56 μ g/mlと最もすぐれ、*K. pneumoniae*は分布範囲が50 μ g/mlまでに拡大したが、MIC₅₀ 0.39、MIC₉₀ 1.56 μ g/mlとすぐれていた。また、*C. freundii*、*Enterobacter* spp.、*Proteus* spp. のMIC₅₀、MIC₉₀は0.39、3.13 μ g/mlであったが、*C. freundii*では>100 μ g/mlの耐性株が認められた。さらに*P. aeruginosa*では1.56~>100 μ g/mlに分布し、MIC₅₀およびMIC₉₀は6.25、50 μ g/mlとやや劣っていた。これらの抗菌力は対照薬と比較するといずれも2~4管劣るものであった。

2. 臨床的有用性の検討

Table 2にBLFX使用症例の一覧表を、Table 3にBLFX使用前後の臨床検査値の一覧表を示した。症例は21~71歳の男性5例、女性5例で、何らかの基礎疾患を有するものが多かった。本剤の投与量は1日400mg(200mg \times 2回)が7例、1日200mg(100mg \times 2回)が3例であり、投

与期間は4~21日間であったが多くは4~15日間であった。

臨床効果は呼吸器感染症では肺炎3例および扁桃炎1例はいずれも有効で、急性気管支炎2例は著効1例、有効1例であったが、起炎菌が*P. aeruginosa*であった慢性気管支炎の1例はやや有効であった。呼吸器感染症全体としては著効1例、有効5例、やや有効1例であった。また、大腸炎の1例は著効、膀胱炎の2例は著効1例、有効1例であった。

起炎菌は呼吸器感染症から*E. coli* 1株、*P. aeruginosa* 1株、膀胱炎2例から*E. coli* 2株が分離されたが呼吸器感染症の*E. coli*、*P. aeruginosa*はいずれも消失せず、膀胱炎の*E. coli* 2株はいずれも消失した。

本剤投与に起因すると思われる副作用、臨床検査値の異常変動は一例も認められなかった。

Ⅲ. 考 察

近年、いわゆるニューキノロン系薬の発達は著しいものがあるが、グラム陰性桿菌に対しては強い抗菌力を示すものの、グラム陽性球菌に対しては比較的抗菌力の弱いものが多い。しかも、われわれの内科領域感染症、とくに呼吸器感染症ではグラム陽性球菌が起炎菌となることが多く、軽度~中等度の感染症は経口抗菌薬の対象と

Table 2. Clinical results of cases treated with balofloxacin

No.	Age (y)	Sex	Diagnosis	Underlying disease	Causative organism	Dose (mg \times times \times days) Total dose	Clinical effect	Bacteriological effect	Side effects and remarks
1	70	M	pneumonia	bronchoectasis ischemic heart disease	<i>E. coli</i> (12.5)*	100 \times 2 \times 21 4,200	good	unchanged	(-) no response to CPDX-PR
2	61	F	pneumonia	bronchiectasis	NF	200 \times 2 \times 15 6,000	good	unknown	(-)
3	61	F	pneumonia	bronchiectasis	NF	200 \times 2 \times 4 1,600	good	unknown	(-)
4	22	M	tonsillitis	erythema nodosum	NF	200 \times 2 \times 11 4,400	good	unknown	(-)
5	60	M	acute bronchitis	(-)	NF	200 \times 2 \times 4 1,600	good	unknown	(-)
6	62	M	acute bronchitis	HTLV-I carrier	NF	200 \times 2 \times 7 2,800	excellent	unknown	(-)
7	65	M	chronic bronchitis	neurosis	<i>P. aeruginosa</i>	200 \times 2 \times 18 7,200	fair	unchanged	(-)
8	21	F	colitis	(-)	NF	200 \times 2 \times 5 2,000	excellent	unknown	(-)
9	71	F	cystitis	bronchiectasis arteriosclerosis depression	<i>E. coli</i>	100 \times 2 \times 7 1,400	excellent	eradicated	(-)
10	71	F	cystitis	arteriosclerosis depression	<i>E. coli</i>	100 \times 2 \times 7 1,400	good	eradicated	(-)

*(-): MIC of balofloxacin (Inoculum size: 10⁵ cell/ml)

HTLV-I: human T-cell leukemia virus-I, NF: normal flora, CPDX-PR: cefpodoxime proxetil

なるものである。また、ニューキノロン系抗菌薬は抗痙攣誘発作用や光線過敏症など安全面においても改良の余地が残されている。

今回、著者らはこれらのニューキノロン系薬の欠点を少しでも補うものとして登場したBLFXの基礎的知見を参考にして、同薬の抗菌活性と臨床的有用性を検討した。

BLFXの抗菌活性についてみると、著者らの成績でもグラム陽性球菌のMSSA, MRSA, *E. faecalis*に対しては対照薬のOFLX, CPMXのMICよりも2管ないしそれ以上すぐれており、TFLXとほぼ同等もしくはややすぐれた成績であった。一方、*E. coli*, *C. freundii*, *K. pneumoniae*, *E. cloacae*, *E. aerogenes*, *P. mirabilis*, *P. vulgaris*に対しては、対照薬よりやや劣るもののMIC₉₀はいずれも3.13 μ g/ml以下であり、臨床的有効性が十分に期待できる成績であった。しかし、*P. aeruginosa*に対してはMIC₅₀, MIC₉₀がそれぞれ6.25 μ g/ml, 50 μ g/mlであり、やや劣っていた。

これらの成績は他施設のものとともに変わるものではなかったが、われわれの臨床分離株のMICがやや高値になっているようであった¹⁾。日常診療にてニューキノロン系薬が多用されているためと思われる。われわれの測定できなかった呼吸器感染症の主要な起炎菌である *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Haemophilus influenzae*のMIC₉₀をみると、それぞれ0.78, 0.39, \leq 0.05 μ g/mlと報告されており、優れた抗菌力であると

いえる¹⁾。

臨床成績は、呼吸器感染症7例中*P. aeruginosa*を分離した慢性気管支炎がやや有効であった以外は全例有効以上であり、その他の3例も全例有効以上であったことは1日投与量が200mg~400mgの比較的少量であることを考えると満足すべき結果であると考えられる。さらに、全国集計でも、内科領域全体での有効率は88.5%で、扁桃炎・咽喉頭炎100%、肺炎92%、気管支炎85%で、気管支拡張症が70%とやや劣るものの優れた成績である。しかも、その大部分は1日2回投与法となっていた¹⁾。経口薬の1日2回投与は薬剤のcompliance, 患者の負担軽減を考える時、少なからぬメリットと思われる。一方、細菌学的効果を菌消失でみると、*S. aureus*, *S. pneumoniae*, *H. influenzae*はいずれも90%以上で、検出菌全体でも83%と良好な成績であった。しかし、*P. aeruginosa*の消失率は17%であり、BLFXの抗菌力をよく反映した成績であった¹⁾。

本剤投与に起因すると思われる副作用、臨床検査値の異常変動は認められなかった。しかし、BLFXが使用された全国の1467例でみると、副作用発現率は4.6%で、その主なものは下痢などの消化器症状で、発疹は0.8%、神経症状も0.9%と比較的頻度の低いものであった。また、出現頻度は投与量とよく関係していないようであった。また、臨床検査値異常の出現率は5.2%で、GOT、

Table 3. Laboratory findings of cases treated with balofloxacin

No.	Hemanalysis							CRP (mg/dl)	ESR (mm/h)	Liver function					Renal function					CA-T (U/ml)	MpHA (U/ml)	Urinalysis		
	RBC ($\times 10^4/\mu$ l)	Hb (g/dl)	Ht (%)	WBC (μ l)	Neu (%)	Eos. (%)	Plats ($\times 10^4/\mu$ l)			GOT (U/L)	GPT (U/L)	ALP (U/L)	LDH (U/L)	γ -GTP (U/L)	BUN (mg/dl)	Cr (mg/dl)	Na (mEq/L)	K (mEq/L)	Cl (mEq/L)			protein	sugar	
1	B	495	15.5	43.3	7200	65	3	20.1	0.8	29	26	26	168	515	63	22	0.8	142	4.2	98	64	20>	++	##
	A	488	15.3	43.4	7000	71	4	10.7	0.6	11	26	36	161	517	62	15	0.8	142	4.1	100	NT	NT	++	##
2	B	407	12.7	36.9	6200	57	4	30.7	0.3	42	21	7	221	478	14	10	0.7	145	4.8	106	>512	20>	--	--
	A	437	13.3	40.0	5800	59	4	29.3	0.27	8	25	12	212	437	12	13	0.7	143	4.2	107	>512	40>	--	--
3	B	375	12.2	35.0	8100	69	2	24.6	0.2>	40	20	9	207	474	11	16	0.8	143	4.5	104	NT	NT	--	--
	A	372	12.1	34.9	6600	60	4	22.7	0.2>	30	22	11	191	399	10	20	0.8	143	4.5	103	32	20>	--	--
4	B	514	15.0	44.0	4300	37	8	30.8	0.6	5	12	10	167	310	15	13	0.7	143	4.2	102	NT	NT	--	--
	A	468	13.5	39.8	7000	80	5	36.9	0.2>	3	27	47	152	403	18	10	0.7	147	3.9	106	64	40>	--	--
5	B	525	16.4	46.6	5700	54	8	17.4	3.5	3	16	19	154	298	11	11	0.9	NT	NT	NT	32	40>	--	--
	A	529	16.8	46.4	5000	60	5	22.5	0.2>	2	18	17	167	338	12	14	0.9	NT	NT	NT	4>	40>	--	--
6	B	437	14.6	40.1	6000	57	6	18.3	1.8	13	13	22	155	406	29	16	1.3	NT	NT	NT	32	80	--	--
	A	445	14.9	41.2	5700	45	3	21.5	0.2>	4	21	29	148	413	30	20	1.5	144	3.9	104	16	40	--	--
7	B	517	16.2	46.2	4600	58	1	19.9	0.2>	4	57	62	330	525	180	15	0.8	NT	NT	NT	16	NT	--	--
	A	465	14.6	41.6	4500	59	5	15.4	0.2>	3	68	69	214	475	106	18	0.8	145	4.4	102	NT	NT	--	--
8	B	473	14.3	42.4	10300	86	1	19.0	0.6	8	19	13	142	406	9	8	0.9	144	3.5	102	64	NT	+	-
	A	451	13.7	40.0	7200	NT	NT	32.2	0.2	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT
9	B	459	12.8	38.0	6400	60	3	28.5	0.6	48	32	17	261	459	18	15	0.6	144	3.6	105	16	20>	--	--
	A	452	12.9	37.7	9100	NT	NT	35.0	0.4	60	29	14	338	397	16	13	0.6	146	3.8	106	NT	NT	--	--
10	B	452	12.7	37.9	8400	64	1	26.5	0.6	40	38	22	293	470	20	16	0.6	145	3.7	104	64	40>	--	--
	A	455	12.7	38.1	7400	65	3	31.1	0.4	12	33	19	296	454	17	10	0.6	142	4.0	105	NT	NT	--	--

CA-T: cold hemagglutination test MpHA: mycoplasma indirect hemagglutination test NT: not tested
B: before A: after

GPTの上昇, 好酸球増加が主なものとなっていた¹⁾。

これらのことからBLFXは内科領域感染症に有用な薬剤であると考えられた。

文 献

- 1) 熊澤浄一, 松本文夫: 第42回日本化学療法学会総会, 新薬シンポジウム。Balofloxacin (Q-35), 福岡, 1994
- 2) Ito T, Otsuki M, Nishino T: *In vitro* antibacterial activity of Q-35, a new fluoroquinolone. *Antimicrob Agents Chemother* 36: 1708~1714, 1992
- 3) Iwasaki H, Miyazaki S, Tsuji A, Yamaguchi K, Goto S: *In vitro* and *in vivo* antibacterial activities of Q-35, a novel fluoroquinolone. *Chemotherapy* 41: 100~112, 1995
- 4) Gohara Y, Arai S, Akashi A, Kuwano K, Tseng Cheng-Chuang, Matsubara S, Matsumoto M, Furudera T: *In vitro* and *in vivo* activities of Q-35, a new fluoroquinolone, against *Mycoplasma pneumoniae*. *Antimicrob Agents Chemother* 37: 1826~1830, 1993
- 5) 中島光好, 植松俊彦, 福地美保, 中野真子, 小菅和仁: Balofloxacinの臨床第I相試験 I. 単回経口投与。日化療会誌 43(S-5): 115~140, 1995
- 6) Matsumoto M, Kojima K, Nagano H, Matsubara S, Yokota T: Photostability and biological activity of fluoroquinolones substituted at the 8 position after UV irradiation. *Antimicrob Agents Chemother* 36: 1715~1719, 1992
- 7) Marutani K, et al: Reduced phototoxicity of a fluoroquinolone antibacterial agent with a methoxy group at the 8th position in mice irradiated with long-wavelength UV light. *Antimicrob Agents Chemother* 37: 2217~2223, 1993
- 8) 橋口浩二, 中林美枝子, 吉田耕一郎, 宮下修行, 中島正光, 二木芳人, 副島林造: Balofloxacinの経口Theophylline血中濃度に及ぼす影響。日化療会誌 43(S-5): 168~173, 1995
- 9) 堀 誠治, 嶋田甚五郎: 新キノロン薬, balofloxacinのGABA受容体結合に及ぼす影響とマウスにおける痙攣誘発作用に関する検討。日化療会誌 43(S-5): 111~114, 1995
- 10) 日本化学療法学会: 最小発育阻止濃度(MIC)測定法再改訂について。 *Chemotherapy* 29: 76~79, 1981
- 11) 国井乙彦, 副作用判定基準検討委員会: 抗菌薬による治験症例における副作用, 臨床検査値異常の判定基準。 *Chemotherapy* 39: 687~689, 1991

Basic and clinical studies of balofloxacin in the field of internal medicine

Yoshiro Sawae[#], Kaoru Okada, Koji Takaki, Hiroyasu Misumi, Nobuyuki Shimono,
Satoshi Kuboi, Katsuhiko Eguchi and Yoshiyuki Niho

First Department of Internal Medicine, Faculty of Medicine, and[#] School of Health Sciences, Kyushu University
3-1-1, Maidashi, Higashi-ku, Fukuoka 812-82, Japan

A new quinolone drug for oral use, balofloxacin (BLFX), was investigated basically and clinically. The following results were obtained: (1) Minimum inhibitory concentration (MIC) of BLFX for the gram-positive bacteria; *Staphylococcus aureus* and *Enterococcus faecalis*, among 247 strains of 11 species isolated from inpatients of the First Department of Internal Medicine, Faculty of Medicine, Kyushu University, was approximately equivalent to that of a control drug, tosufloxacin, and superior to those of ofloxacin and ciprofloxacin by at least two test tubes. The concentration of BLFX needed for gram-negative rods such as *Escherichia coli*, *Citrobacter freundii*, *Klebsiella pneumoniae*, *Enterobacter* spp. and *Proteus* spp. was slightly inferior to that of the control drugs, the minimum 90% inhibitory concentration (MIC₉₀) being lower than 3.13 µg/ml for all of these rods. The MIC₅₀ and MIC₉₀ for *Pseudomonas aeruginosa* were 6.25 and 50 µg/ml, respectively, showing BLFX to be slightly inferior to the controls. (2) BLFX was orally administered at a dose of 100~200 mg, twice a day, for 4~21 days to 10 patients (2 of whom were the same person). The clinical efficacy was rated as excellent in one, good in five and fair in one of 7 patients with respiratory infectious diseases. The clinical efficacy was effective for one with colitis, and excellent and good in each one of the patients with cystitis. Neither side effects nor abnormal changes in clinical laboratory test values, likely to be attributable to the drug, were observed in any of the patients.