

内科領域におけるbalofloxacinの臨床的検討

向野賢治・多々良一郎・武田誠司

福岡大学医学部第二内科*

南川博道

南川整形外科病院

Balofloxacinを呼吸器感染症9例(咽喉頭炎1例, 扁桃炎2例, 急性気管支炎4例, 肺炎2例)および感染性腸炎1例に投与した結果, その臨床効果は著効5例, 有効5例であった。起炎菌として*Streptococcus pyogenes*および*Streptococcus pneumoniae*が分離されたが, 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および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, Q-35, 内科感染症, ニューキノロン

Balofloxacin (BLFX, 開発コードQ-35)は中外製薬株式会社で合成され, 同社および日本チバガイギー株式会社で共同開発された新しい経口用キノロン薬である。本剤はグラム陽性菌からグラム陰性菌にいたるまで広い抗菌スペクトルを有すると言われており¹⁾, とくにグラム陽性菌^{2,3)}, 嫌気性菌⁴⁾, マイコプラズマ⁵⁾およびクラミジア⁶⁾に対して強い抗菌力を示すことが報告されている。また, 痙攣誘発作用は弱く^{7,8)}, 光線に対しても安定であり⁹⁾光線過敏症の発現も少ない¹⁰⁾との報告もある。

今回, 著者らは内科領域感染症に対する本剤の臨床的検討を行ったので報告する。

対象は平成4年8月から平成5年3月までの間に福岡大学第二内科および南川整形外科病院内科で受診した患者のうち同意を得られた10例で, その内訳は呼吸器感染症9例(咽喉頭炎1例, 扁桃炎2例, 急性気管支炎4例, 肺

炎2例)および感染性腸炎1例で, 感染症の重症度は全例軽症～中等症であった。年齢は19～86歳, 平均48.6歳であり男性2例, 女性8例であった。投与方法は1回100～200mgを1日2回経口投与し, 投与期間は7～14日間で, 総投与量は1400～5600mgであった。

効果判定は臨床症状, 検査所見の推移から著効, 有効, やや有効, 無効の4段階で行った。また副作用および臨床検査値の異常変動については, 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⁾を参考にして行った。

症例一覧表をTable 1に示した。呼吸器感染症9例のうち, 咽喉頭炎の1例は著効, 扁桃炎の2例は著効1例, 有効1例, 急性気管支炎の4例は著効2例, 有効2例, 肺炎の2例は有効であった。全体として, 著効4例, 有効5例で, 全例有効以上であった。また, 感染性腸炎の1例は著効

Table 1-1. Clinical response to balofloxacin RTI

Case no.	Age (y) Sex	Diagnosis	Underlying disease	Causative organisms	Daily dose duration total dose (mg)	WBC (/mm ³)	CRP	Clinical efficacy	Bacterial effect	Side-effects
1	31 M	acute pharyngitis	chronic hepatitis	<i>S. pyogenes</i> ↓ NF	100 × 2 7 1,400	11,100 ↓ 8,000	4+ ↓ ±	excellent	eradicated	(—)
2	19 F	acute tonsillitis	(—)	NT ↓ NT	100 × 2 7 1,400	8,900 ↓ 7,500	9.2 ↓ 0.4	good	unknown	(—)
3	58 F	acute tonsillitis	hypertension	NF ↓ NT	100 × 2 10 2,000	6,300 ↓ 6,500	5.6 ↓ 1.0	excellent	unknown	(—)
4	64 F	acute bronchitis	(—)	NT ↓ NT	100 × 2 7 1,400	10,800 ↓ 6,200	2.5 ↓ 0.0	excellent	unknown	(—)

NF: normal flora NT: not tested

Table 1-2. Clinical response to balofloxacin RTI

Case no.	Age (y) Sex	Diagnosis	Underlying disease	Causative organisms	Daily dose duration total dose (mg)	WBC (/mm ³)	CRP	Clinical efficacy	Bacterial effect	Side-effects
5	40 M	acute bronchitis	(—)	NT ↓ NT	100 × 2 7 1,400	11,100 ↓ 9,100	5.8 ↓ 0.2	excellent	unknown	(—)
6	39 F	acute bronchitis	(—)	NF ↓ NT	100 × 2 14 2,800	17,900 ↓ 4,200	>16 ↓ 0.1	good	unknown	(—)
7	59 F	acute bronchitis	(—)	NF ↓ NT	100 × 2 7 1,400	9,500 ↓ 4,400	3.9 ↓ 0.4	good	unknown	(—)
8	69 F	pneumonia	IHD	<i>S. pneumoniae</i> ↓ NF	200 × 2 14 5,600	9,300 ↓ 7,500	30.9 ↓ 3.0	good	eradicated	(—)
9	86 F	pneumonia	osteoporosis	NF ↓ NT	200 × 2 14 5,600	5,500 ↓ 5,200	3.9 ↓ 0.6	good	unknown	(—)
10	21 F	acute enteritis	(—)	<i>C. jejuni</i> ↓ NT	100 × 2 7 1,400	9,800 ↓ 3,500	14.5 ↓ 0.4	excellent	unknown	(—)

IHD: ischemic heart disease NF: normal flora NT: not tested

であった。起炎菌の消長が判明したものは呼吸器感染症の *Streptococcus pyogenes* と *Streptococcus pneumoniae* の2株であったがいずれも消失した。本剤投与に起因すると思われる副作用および臨床検査値の異常変動は認められなかった。

呼吸器感染症9例および感染性腸炎1例の内科領域感染症10例について臨床効果および安全性について検討を行った。その結果、臨床効果はいずれも有効以上のすぐれた有効率が得られた。また、消長が判明した起炎菌はグラム陽性菌2株であったが、いずれも消失し、本剤はグラム陽性菌に強いと言われる報告^{2,3)}と一致した。また、本剤によると思われる副作用および臨床検査値の異常変動は1例も認められず、本剤の有効性と考え合わせると本剤は内科領域の感染症に対して、有用性の高い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) 田中香お里, 加藤直樹, 加藤はる, 渡邊邦友,

上野一恵: ニューキノロン系抗菌薬 balofloxacin の嫌気性菌に対する抗菌力。日化療会誌 43 (S-5): 27~33, 1995

- 5) Gohara Y, Arai S, Akashi A, Kuwano K, Tsheg 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
- 6) 永山在明: Balofloxacin の *Chlamydia trachomatis* に対する *in vitro* 抗菌力。日化療会誌 43 (S-5): 495~497, 1995
- 7) 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
- 8) 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
- 9) 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
- 10) 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

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

11) 国井乙彦，副作用判定基準検討委員会：抗菌薬

Clinical effect on balofloxacin in the field of internal medicine

Kenji Kono, Ichiro Tatara and Seiji Takeda

Second Department of Internal Medicine, School of Medicine, Fukuoka University

7-45-1 Nanakuma, Jonan-ku, Fukuoka 814-01, Japan

Hiromichi Minamikawa

Minamikawa Orthopedic Surgery Hospital

When balofloxacin was administered to 9 patients with respiratory tract infections (1 with laryngopharyngitis, 2 with tonsillitis, 4 with acute bronchitis, and 2 with pneumonia) and 1 with infectious enteritis, the clinical efficacy was rated excellent in 5 and effective in 5. *Streptococcus pyogenes* and *Streptococcus pneumoniae*, isolated as the causative bacteria, were eradicated. No side effects or abnormal changes in clinical laboratory test values probably attributable to the drug were observed in any of the patients.