

フルオロキノロン系抗菌薬（ラスビック®錠）

2020年1月、ラスビック®錠（一般名：ラスクフロキサシン塩酸塩）が発売されました。グレースビット®錠・細粒（一般名：シタフロキサシン水和物）以来、12年振りのフルオロキノロン系抗菌薬（キノロン系薬）の新薬です。

キノロン系薬は、グラム陽性菌（肺炎球菌）からグラム陰性菌（インフルエンザ菌）、非定型病原体（肺炎マイコプラズマ）まで広い抗菌スペクトルを有し、呼吸器から尿路まで全身の感染症に処方されています。反面、汎用に伴う薬剤耐性（AMR）や安全面の課題も懸念されます。今回のラスビック®錠は、呼吸器および耳鼻咽喉科感染症に特化したレスピラトリー（呼吸器）キノロンです。キノロン耐性大腸菌が増加している泌尿器科領域の適応はありません。肺組織への移行性が良好で、in vitro で肺胞上皮被覆液に存在するリン脂質（ホスファチジルセリン）と結合性が高いことが確認されています。市中肺炎の主な原因菌である肺炎球菌、インフルエンザ菌、肺炎マイコプラズマ、また、近年、呼吸器感染症の原因菌として注目されている口腔内菌、嫌気性菌にも有効です。市中肺炎を対象とした第Ⅲ相二重盲検比較試験ではクラビット®錠 500mg（一般名：レボフロキサシン水和物）に対しラスビック®錠 75mg の低用量で非劣性を示しました。ただし、『JAID/JSC 感染症治療ガイドライン』では、キノロン系薬はβラクタム薬が使えない場合の第二選択という位置付けになっています。

キノロン系薬の作用機序は、細菌の DNA 複製に必要な DNA ジャイレース（DNA をねじるスーパーコイルング）とトポイソメラーゼ IV（DNA を切断するデカテネーション）を阻害します。既存のキノロン系薬は、どちらか片方の酵素活性を強く阻害するのに対し、ラスビック®錠は、両方を同程度に阻害するため、最小発育阻止濃度（MIC）の上昇が起こりにくいとされます。多くのキノロン系薬は腎排泄型で、腎機能障害時に用量調節が必要になります。ラスビック®錠は、肝・胆汁排泄型なので、腎機能障害時でも用量調節の必要はありません。主に CYP3A4 で代謝されるため、CYP3A4 を誘導するリファンピシン、フェニトイン、カルバマゼピンなどは併用注意です。主な副作用は、下痢、好酸球数増加などです。直径 7.8mm、厚さ 3.8mm と小型のため高齢者でも飲みやすい錠剤です。

商品名	ラスビック®錠 75mg
一般名（略号）	ラスクフロキサシン塩酸塩（LSFX）
会社名	杏林製薬株式会社
適応症	咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、中耳炎、副鼻腔炎
用法・用量	成人には、1回 75mg を 1日 1回経口投与する
禁忌	妊婦、小児、本剤の過敏症
排泄経路	肝・胆汁排泄
薬価	75 mg：353.40 円

使用に際しては、添付文書を必ずお読み下さい。

ラスビック®錠とクラビット®錠の比較

商品名	ラスビック®錠 75mg	クラビット®錠 500mg
一般名	ラスクフロキサシン塩酸塩	レボフロキサシン水和物
略号	LSFX	LVFX
会社名	杏林製薬株式会社	第一三共株式会社
用法・用量	1日 1回 75mg	1日 1回 500 mg
慎重投与	肝機能障害（中等度以上）	腎機能障害（高度）
適応領域	呼吸器と耳鼻咽喉科	全科
代謝／排泄	肝・胆汁排泄	腎排泄
Tmax	2.48 時間（空腹時）	0.99 時間（空腹時）
半減期	13.9 時間	7.89 時間
分配係数	6.40（脂溶性）	0.553（水溶性）
錠剤の大きさ	直径：7.8mm	16.2（長径）7.9（短径）mm

主なフルオロキノロン系薬

	投与回数	テオフィリン	NSAIDs	小児適応	排泄経路
バクシダール（ノルフロキサシン）	3～4	△	×	○	腎
クラビット（レボフロキサシン）*	1		△		腎
シロキサ（シプロフロキサシン）	2～3	△	×		腎
オゼックス（トスフロキサシン）*	2～3	△	△	○	腎肝
パレオン（ロメフロキサシン）	2～3		×		腎
スオード（ブルフロキサシン）	2	△	×		腎
アベロックス（モキシフロキサシン）*	1		△		肝
ジェニナック（ガレノキサシン）*	1	△	△		腎肝
グレースビット（シタフロキサシン）*	1～2		△		腎
ラスビック（ラスクフロキサシン）*	1	△	△		肝

*レスピラトリーキノロン（レボフロキサシンは高用量のみ）
 【併用禁忌あり】NSAIDs × 【併用注意】△ 【小児適応あり】○
 【禁忌】妊婦、【併用注意】金属イオンを含む薬剤（Al、Mg、Ca 等）
 【PK/PD】Cmax（peak）/MIC ピーク濃度依存性（ピークを高くトラフを低く）