

Methyl chlorophenyl isoxazolyl penicillin (メトシリンS)

の眼内科行と感受性試験成績について

徳田久弥・右田寛

熊大眼科

(昭和38年7月27日受付)

Methyl chlorophenyl isoxazolyl penicillin (メトシリンS)の眼内移行と、眼起炎菌のこれに対する感性分布を調べたので報告する(他の合成ペニシリンとの詳細な比較検討は、研究者のひとりである右田がおつて発表する予定である)。

1. メトシリンSの眼内移行

実験方法

実験には2kg前後の成熟白色家兎を用いた。投与量は筋注例では50mg/kgを、経口投与例では体重をとわず一律に250mgをそのまま投与した。被検サンプルは血清と第1房水及び第2房水(第1房水採取後30分たつたのちに再生される房水で、その性状は血漿に非常に類似したものである。炎症時及び外傷眼の眼内移行は、第1房水における値よりも、第2房水における値の方が臨床より合理的な指標となる)である。房水はいずれも少量しか採取できないので(約0.15ml)多くの実験は両眼からの採取液を混合して行なつた。例数は各々4羽づつを原則とした。測定時間は投与後1時間と2時間である。測定法は、ブドウ球菌209P株を用い重層法によつた。

実験成績

第1表に示す通りである。即ち投与量が少ないにもかかわらず、筋注の方が内服よりも血清・房水への移行量は明らかに大である。

また一般に投与1時間後の値の方が2時間後よりも大であるが、特にその傾向は筋注の場合の血清と第2房水の場合に著明である。しかし内服の場合の血清内移行値は1時間と2時間値で殆んど差がなく、第2房水でも同

第1表 メトシリンSの家兎前房内移行(mcg/ml)

		血清	第1房水	第2房水
50 mg/kg	1時間	9.0~3.2 (7.0)	0.08~<0.08 (0.08)	1.7~0.08 (0.85)
	筋注 2時間	4.0~0.22 (2.23)	0.1~<0.08 (0.08)	0.45~0.08 (0.22)
250 mg	1時間	3.8~1.2 (3.47)	<0.08	0.095~0.08
	内服 2時間	5.0~1.0 (3.8)	<0.08	0.1~0.08

()は平均値を示す。

じような傾向が認められた。

筋注の場合の血中濃度と房水中濃度の比は、ペニシリンGの場合が大体10:1であるから、それにくらべるとメトシリンSの第1房水中の移行は余りすぐれたものではない。しかし第2房水中への移行はかなり良好である。これを他の合成ペニシリンと比較してみると、血中濃度は内服の場合 Aminobenzyl PC (ビクシリン)につぎ Phenoxyethyl PC (シンセペン), Phenoxypropyl PC (シンセペンP)よりややまさっている。これらのうちビクシリンの移行が最もすぐれ、ことに滞留性においてもまさっている。

一方、内服による房水内移行はやはりビクシリンがよく、メトシリンSは他の合成ペニシリンよりはやや劣るようである。したがって麦粒腫や眼瞼膿瘍、眼窩蜂窩織炎のような、血管に富んだ眼球附属器の感染症の場合には内服でもよいが、眼球の外傷、眼内感染症の場合には筋注の方がのぞましい。

2. 眼病巣より分離したブドウ球菌に対するメトシリンSの抗菌力

麦粒腫、睫毛性眼瞼縁炎、眼瞼膿瘍その他の眼感染症の病巣から得られた28株のブドウ球菌について、各種合成ペニシリンの抗菌力を比較検討した。その結果は第2表に示す通りである。なおシンセペンP、ビクシリン、

第2表 ペニシリン類のブドウ球菌に対する抗菌力

	感性	卍	(卍)+ (卍)	-(%)
メトシリンS	0%	78.6%	78.6%	10.7%
シンセペンP	21.4	28.6	50.0	10.7
シンセペン	17.9	35.7	53.6	21.4
ビクシリン	21.4	25.0	46.4	25.0
ペニシリンG	14.3	10.7	25.0	42.9

第3表 諸抗生物質のブドウ球菌に対する抗菌力

	卍	卍	(卍)+ (卍)	-(%)
フラジオマイシン	53.5	42.9	96.4	0
カナマイシン	35.7	60.7	96.4	0
クロラム フェニコール	64.3	28.6	93.9	3.6
エリスロマイシン	71.4	17.9	89.3	10.7
オレアンドマイシン	37.0	44.4	81.4	11.1
テトラサイクリン	60.7	7.1	67.8	3.6
ストレプトマイシン	18.5	44.4	62.9	29.6

メトシリンSの抗菌力は結晶を用いた平板寒天稀釈法によつた。判定は最小阻止濃度 0.2 u/ml 以下を感性(卅), 1.0 u/ml 以下:(+), 10.0 u/ml 以下:(+), 10.0 u/ml 以上を不感受性(-)とした。表にみるように、感性(卅)と(+)をあわせたもののパーセンテージはメトシリンSが最も大で78.6%をしめ、不感受性株の頻度も10.7%で最も少なく、合成ペニシリン4種とペニシリンGの間では、ブドウ球菌に対して最も感性が大であることが判明した。

ついでにはシンセペンP、シンセペン、ピクシリンの順であつて、当然のことながらペニシリンGが最も低感受性であつた。

同じ株について調べた他の抗生物質の抗菌力は第3表に示す通りである。即ちフラジオマイシンとカナマイシンは殆んど同じ感性を示し高感性株の頻度は96.4%であり、不感受性株の頻度は0で、現在眼科領域における

ブドウ球菌感染症に対して用いられるべき第一選択の抗生物質であることがわかる。ついでにはクロラムフェニコール、エリスロマイシンがよく、オレアンドマイシンがこれにつぐ。メトシリンSはこのオレアンドマイシンとほぼ同程度の感性分布といえる。

結 語

Methyl chlorophenyl isoxazolyl Penicillin (メトシリンS)の家兎前房内移行は、内服の場合血中移行にくらべやや劣るが、筋注の場合にはかなりの程度に移行を認める。ことに第2前房水中の移行は良好である。

眼病巣より分離したブドウ球菌のメトシリンSに対する感受性は、かなりすぐれており、合成ペニシリンのうちでは最も高い感性分布を示した。他の抗生物質との比較ではオレアンドマイシンに類似していた。

薬剤供与等の御好意をうけた 明葉薬品部に深謝します。