

Enduracidin の臨床的応用

中川圭一・庄司文久

東京共済病院内科

横沢光博

同 検査科

武田薬品工業研究所で開発された Polypeptide 性の新抗生物質 Enduracidin (EDC) を数例の感染症に応用し、若干の基礎的実験を行なったので、それらの成績について報告する。

I. 血中濃度 (表1) および尿中排泄率

50 mg 筋注を3例に行なつたが、表にみるごとく1時間後 $<0.05 \sim 0.154$ mcg/ml, 2時間後 $<0.1 \sim 6.0$ mcg/ml, 3時間後 $<0.1 \sim 0.154$ mcg/ml, 6時間後 $<0.05 \sim 0.154$ mcg/ml, 12時間後 $0.154 \sim 0.44$ mcg/ml を示し、100 mg 筋注例では50 mg 筋注例に比しやや高値を示したが、その peak は1 mcg/ml に達しなかつた。

尿中排泄率は50 mg 注射例4例において12時間まで測定したが、1.7~4.5% で低率であつた。

表1 EDC 筋注時の血中濃度

症 例	投与量	血中濃度 (mcg/ml)				
		1 h	2 h	3 h	6 h	12 h
1. 77才 ♂ 40 kg	50mg	0.154	0.154	0.154	0.154	0.154
2. 28才 ♂ 60 kg	"	<0.1	<0.1	<0.1	<0.1	0.44
3. 22才 ♂ 53 kg	"	<0.05	6.0	0.12	<0.05	0.26
4. 29才 ♂ 55 kg	100mg	0.39	0.83	0.83	0	0

測定法・重層法, *B. subtilis* PCI 219 使用

II. 黄色ブ菌 70 株に対する EDC の MIC および他剤との比較 (表2)

当院保存の黄色ブ菌 70 株について各種抗生剤に対する MIC を EDC のそれと比較した成績は表2のごとくであり、EDC に対しては大部分が 0.2 mcg/ml あるいはそれ以下の MIC を示した。

III. 臨床成績 (表3)

臨床実験例は5例で、その成績は表3のごとくで効果判定に不適当な第5例を除けば有効2例、やや有効1

表2 黄色ブ菌 70 株に対する各種抗生剤の MIC (mcg/ml)

	≤ 0.2	0.4	0.8	1.6	3.2	6.3	12.5	25	50	100	>100
PCG (unit)		12	5	16	11	5	4	3	5	2	8
TC				47		3					20
SM				41	6	5	1		7	1	9
CP					25	41			4		
EM	50	3	1		1						15
SPM				8	29	21	2				10
AB-PC	11	2	2	23	14	1	2	7	6	2	
LCM	9	51	1								9
MPI-PC	46	22	1			1					
CER	67	3									
EDC	66	2	1	1							

測定法：平板寒天稀釈法, Heart-Infusion Agar (pH = 7.4 ± 0.2)

表3 EDC の臨床成績

症 例	性	年 令	臨 床 診 断	原因菌	投 与 法		臨床効果	副作用	備 考
					投与量 (g/日)	投与期間			
1.	♂	56	肺化膿症	常在菌	100 mg	16日	有効	局所硬結	咯痰減少咳嗽
2.	♂	25	急性熱性発疹性疾患	常在菌	100 mg	10日	有効		5日目より解熱
3.	♀	28	気管支喘息+急性気管支炎	黄色ブ菌	200 mg	14日	やや有効		ブ菌の消失, 血沈, 白血球増多改善
4.	♂	29	不明熱	?	100 mg	12日	無効		
5.	♂	65	心不全+気管支肺炎	?	100 mg	3日	無効		投与後3日で死亡

例1, 無効1例となる。投与対象が抗生物質の効果判定には必ずしも適当な症例とはいえないが, 著効例はなかつた。

む す び

EDC はグラム陽性球菌に対してすぐれた感受性を有

する新抗生物質であるが, われわれの行なつた黄色ブドウ菌に対する他の抗生剤との比較実験でも CER と同程度の高度の感受性を示した。しかし血中濃度は1回 50~100 mg 程度の筋注では, きわめて低く, そのためか臨床効果は満足すべきものではなかつた。

CLINICAL APPLICATION OF ENDURACIDIN IN INTERNAL MEDICINE

KEIICHI NAKAGAWA & FUMIHISA SHOJI

Department of Internal Medicine, Tokyo Kyosai Hospital

MITSUHIRO YOKOZAWA

Department of Central Clinical Laboratories, Bacteriological Section,
Tokyo Kyosai Hospital

The mean minimum inhibitory concentration of the new polypeptide antibiotic "Enduracidin" against the 70 strains of *Staphylococcus aureus* was lower than PC-G, TC, SM, CP, EM, SPM, AB-PC and LCM, and of the same order as in MPI-PC and CER.

Although antimicrobial activity of the drug *in vitro* was demonstrated, the clinical effectiveness to the five case of infectious diseases including pneumonia, lung abscess and sepsis was not remarkable. Serum levels at 1 to 2, 3, 6 and 12 hours after 50 and 100 mg intramuscular injection of enduracidin ranged from undetectable to 6.0 mcg/ml and the urinary excretion rate ranged from 1.7 to 4.5%.

The low serum levels and urinary excretion obtained suggested poorer absorption than was anticipated, although rapid degradation or tissue binding of absorbed drug cannot be excluded.