

## SF-837 (ミデカマイシン) の使用経験

中川 圭一・可部順三郎・渡辺健太郎

東京共済病院内科

横沢光博

同 臨床検査科

SF-837 は明治製菓中央研究所において研究開発されたマクロライド系新抗生物質で、グラム陽性球菌に対し、強い抗菌力を示すものである。われわれは本物質につき、若干の基礎的実験を行ない、呼吸器感染症9例に本剤を使用したもので、これらの成績について報告する。

## 実験成績

## I. 黄色ブドウ菌に対する感受性

臨床材料から分離した黄色ブ菌45株に対するSF-837の感受性をEMのそれと比較した。その成績は、第1表に示すように、EMより若干その感受性は劣り、SF-837の感受性分布の山はMIC 0.78 mcg/mlであつたが、EMではMIC 0.2 mcg/mlあるいはそれ以下であつた。またSF-837のMICが>100 mcg/mlを示したものは4株あつたが、これらの株はEMに対しても>100 mcg/mlの耐性を示した。これらの結果は一応SF-837耐性菌はEMと交叉耐性を示すものといえよう。

## II. SF-837 1,000 mg 投与時の血中濃度および尿中排泄

体液中濃度測定は *Sarcina lutea* PCI 1001 を試験菌とする薄層カップ法を用いた。

健康人6例に本剤1,000 mgを1回に内服させ、血中濃度および尿中排泄を測定した。その結果は、表2にみるとおり、血中濃度はきわめて低く、1 mcg/mlを超えたものはなく、6例の平均値で見ると、その最高は2時間値で0.09 mcg/mlであり、6時間後では測定しえたものはなかつた。また尿中排泄も、8時間まで測定したが、0.29~1.78%で、平均1.22%で、きわめて低い尿中排泄率を示した。

## 臨床成績

呼吸器感染症9例にSF-837を投与し、その臨床効果を観察した。呼吸器感染症の内訳は急性肺炎4例(入院患者)、急性気管支炎4例、急性扁桃炎1例(以上5例は外来患者)である。

SF-837は1カプセル200 mg含有のものを1回400 mg、1日3回計1,200 mgを投与した。投与期間は6~10日間であつた。

効果判定は肺炎、急性気管支炎については発熱、咳嗽、喀痰、胸部X線および理学的所見、扁桃炎については発熱、咳嗽、喀痰、局所の発赤、腫脹、白苔について観察し、喀痰培養、赤沈、白血球数の検査所見をも参考とし、すべての自他覚的所見が投与後3日以内に著しく改善したものを著効、7日以内に軽快したものを有効とし、7日以上投与しても諸症状の改善をみないものを無効とした。喀痰培養は肺炎全例と急性気管支炎1例に行なつたが、起炎菌の判明したものは *Staphylococcus aureus* を検出した肺炎の1例だけで、他は常在菌であつた。この症例はSF投与後4日目に黄色ブ菌が僅少となり、7日後には検出されなくなつたので、細菌学的効果も有効と判定した。

臨床効果の成績は、表3に示すとおりで、投与全例に有効、急性扁桃炎の1例は著効で、無効例はなかつた。代表的症例の経過についてのべる。

## 症例1 T.T. 34才 ♂ 急性肺炎

昭和46年7月5日腰痛のため入院。種々検査を施行し、経過観察中7月20日悪寒を伴う発熱あり、体温39.2℃におよぶ。咳嗽、喀痰あり。胸部X線像で左中

Table 1 Antibacterial activities of SF-837 and erythromycin against 45 strains of *Staphylococcus aureus*

Antibiotic	MIC of <i>Staph. aureus</i> 209P JC-1	MIC (mcg/ml)											
		≤0.20	0.39	0.78	1.56	3.13	6.25	12.5	25.0	50	100	>100	
SF-837	0.78			29	9	3							4
EM	0.2	38		1	2	2							4

Table 2 Serum levels and urinary excretion of SF-837 after a single oral administration of 1,000 mg in adult

Method : Thin layer cup method  
 Test organism : *Sarcina lutea* PCI 1001  
 pH : 8.0  
 Buffer : SOERENSEN's Phosphate buffer

No.	Age & Sex	Body weight (kg)	Serum levels at hour (mcg/mg)					Urinary excretion (mg)					
			1	2	3	6	8	0-2 hr.	2-4 hr.	4-6 hr.	6-8 hr.	Total mg	Total %
1	33 M.	78	0.0	0.11	0.05	trace	0.0	2.51	5.25	3.75	0.81	12.32	1.23
2	20 F.	45	0.12	0.2	0.11	trace	0.0	9.60	4.76	2.20	1.30	17.86	1.78
3	38 M.	46	0.0	0.14	0.11	trace	0.0	7.52	5.26	2.24	0.53	15.56	1.55
4	46 M.	56	trace	0.0	0.0	0.0	0.0	1.84	0.58	0.50	0.0	2.92	0.29
5	27 M.	62	0.0	trace	0.08	0.0	0.0	2.15	2.94	4.50	1.30	10.89	1.08
6	24 M.	46	0.07	0.15	0.08	trace	0.0	10.0	1.70	2.20	0.0	13.90	1.39
Mean			0.01	0.09	0.07	0.0	0.0	5.60	3.41	2.56	0.65	12.24	1.22

Table 3 Clinical results of SF-837 in respiratory diseases

Case	Sex	Age	Disease	Daily dosis	Duration of administration	Total dosis	Bacteria isolated from sputum	Effect
1. T.T	♂	34	Acute pneumonia	1,200 mg	10 days	12 g	<i>Neisseria Strept. epid.</i>	good
2. O.F	♀	63	Acute pneumonia	1,200	10	12	<i>Neisseria Klebsiella</i>	good
3. T.Z	♂	76	Acute pneumonia Cor pulmonale	1,200	7	8.4	<i>Staph. aureus</i>	good
4. K.K	♂	28	Acute pneumonia	1,200	7	8.4	<i>Neisseria Strept. epid.</i>	good
5. I.T	♀	77	Acute bronchitis	1,200	7	8.4		good
6. T.R	♀	20	Acute bronchitis	1,200	7	8.4		good
7. O.K	♀	20	Acute bronchitis Asthma bronchiale	1,200	6	7.2	<i>Neisseria γ-Strept.</i> <i>Haemoph. Sp.</i>	good
8. Y.Y	♂	33	Acute bronchitis	1,200	5	6.0	<i>Strept. aureus Neisseria</i>	good
9. Y.K	♀	28	Acute tonsillitis	1,200	7	8.4		excellent

肺野に気管支肺炎様の陰影をみとめ、赤沈促進、白血球増多あり。SF-837を本例に投与したところ、投与3日目に体温37℃以下となり、胸部理学的所見も正常となる。7日後には胸部X線像も改善し、白血球数も改善、投与14日後の胸部X線像はほぼ正常となった。

#### 症例2 F.K. 63才 ♀ 急性肺炎

3~4週来38.5℃前後の弛張熱がにつき、近医により治療をうけていたが、下熱せず、46年9月22日入院。入院時胸部X線像で左中下肺野、左下肺野に気管支肺炎様の陰影あり。さび色の痰をだし、赤沈値促進、白血球増多をみとめた。SF-837を入院日から投与しはじめたところ、3日後には平熱となり、咳嗽、喀痰も漸次減少

し、胸部X線像も投与3週後にはほぼ正常となった。

全症例において検血、検尿、BUN、GOT、GPT、Alkali-phosphataseを投与前と終了後に検査したが、全く変化はなかつた。また本剤投与による自覚的副作用も全例においてみとめられなかつた。

#### ま と め

1) SF-837の黄色ブ菌45株に対するMICは0.78 mcg/mlを示すものが最も多かつたが、EMにくらべ若干感受性は劣つた。またSF-837に対しMIC>100 mcg/mlの株はEMと交叉耐性を示した。

2) SF-837 1,000 mg投与時の血中濃度は6例の平均

値で2時間値が peak で 0.09 mcg/ml を示し、尿中排泄率は8時間までで 1.22% と低率であつた。

3) 呼吸器感染症9例に1日1,200 mg を投与し、著効1例、有効8例の治療成績をえた。

なお自覚的に副作用として特記すべきものはなく、血液、尿、BUN、GOT、GPT、Alkali-phosphatase を投与前後に検査したが変化はなかつた。

## CLINICAL STUDIES ON SF-837 (MYDECAMYCIN)

KEIICHI NAKAGAWA, JUNZABURO KABE, KENTARO WATANABE  
and MITSUHIRO YOKOZAWA

Department of Internal Medicine, Tokyo Kyosai Hospital, Tokyo, Japan

1) Forty-five strains of *Staphylococcus aureus* cultured from clinical specimens were tested for susceptibility to SF-837 and erythromycin. Most of the strains were inhibited in 0.78 mcg/ml of SF-837 and in 0.20 mcg/ml of erythromycin. However, 4 strains showed more than 100 mcg/ml of MIC to both SF-837 and erythromycin.

2) Blood levels of SF-837 after a single oral administration of 1,000 mg in healthy volunteers were very low (trace to 0.2 mcg/ml at 2 hours after administration). Urinary excretion rate was 1.22% in mean value of 6 cases during 8 hours after a single oral administration of 1,000 mg SF-837.

3) Clinical results of SF-837 in 9 cases of respiratory infectious diseases were remarkable (excellent 1, good 8). No side effects were seen in all patients.