

内服用新 Cephalosporin 系製剤 Cefatrizine の小児科領域 における基礎的、臨床的検討

中沢 進・佐藤 肇・藤井尚道・小島碩哉

都立荏原病院小児科, 昭和大学医学部小児科

岡 秀

田園調布中央病院小児科

近 岡 秀 次 郎

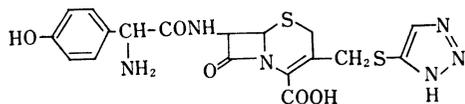
高津中央病院小児科

平 間 裕 一

昭和大学医学部薬理学教室

Cefatrizine (以下 CFT と略記する) は, 米国プリストル社研究所で開発された新しい内服用半合成 Cephalosporin 系製剤であり, 従来の同種製剤に比較して諸菌に対する感性態度がすぐれている点を特徴としている^{1)~3)}。

本剤には Capsule 剤と Dry syrup 剤があるが両者を使用している小児科領域における一連の検討を行なうことができたので, その概況について以下報告する。



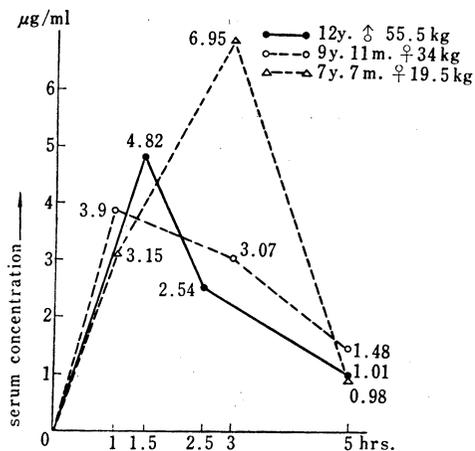
Cefatrizine

7-[D-2-amino-2-(*p*-hydroxyphenyl) acetamido]-3-(1, 2, 3-triazol-5-ylthiomethyl) 3-cephem-4-carboxylic acid. (propylene glycol solvate)

1) 体液濃度測定成績

測定法は試験菌として *Sarcina lutea* ATCC 9341 株,

Fig. 1 Serum concentration of cefatrizine after an oral administration of 250 mg.



標準液の希釈には pH 7.0 phosphate buffer 使用, cup plate method によって行なった。

A) 血中濃度 (Fig. 1)

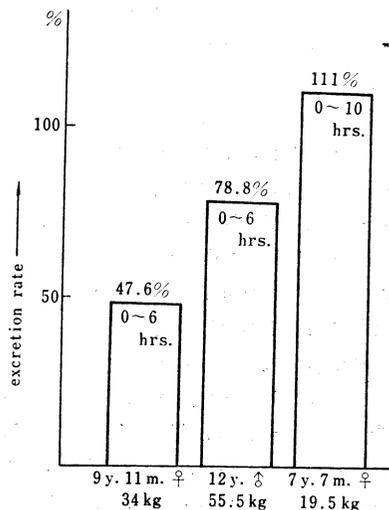
学童期の小児に 1 回 250.0 mg の CFT を内服させ, 1, 1.5, 2.5, 3, 5 時間目の血中濃度について測定を行なった。

Peak は 1, 1.5, 3 時間目に分布していて不定であったがいずれも高い血中濃度を維持し, 5 時間目になると低下の傾向を辿ったが測定可能な血中濃度が維持されていた。

B) 尿中排泄率 (Fig. 2)

血中濃度測定在同一小児 6 時間または 10 時間までの尿中排泄率について測定を行なった。このさい測定に使用した原尿は pH 7.0 phosphate buffer solution で 100

Fig. 2 Urinary excretion rate (%) of cefatrizine after an oral administration of 250 mg



倍に希釈したものである。2例の6時間までの排泄率は47.6~78.8%に分布していたが、10時間まで蓄尿した1例では111%と使用用量より多くなっていたが、この点については此後症例を追加して検討してゆく予定である。

2) 臨床使用成績

A) 使用製剤

Capsule 製剤……125.0mg 含有 Capsule 製剤
Dry syrup 製剤……1.0g 中 CFT 100mg 含有の年少小児用甘味顆粒製剤で、そのまま、または懸濁液として服用が可能である。

B) 臨床効果判定基準

著効(++)……内服後 3~4 日以内に主症状消失または著しく好転
(肺炎の場合 5~6 日以内)
有効(+)……内服後 5~6 日以内に主症状消失または著しく好転
(肺炎では 7~8 日)

C) 副作用に対する観察

服用状況、消化器障害症状の出現(食慾不振、嘔吐、嘔気、腹痛、下痢)、肝、腎機能検査(GOT, GPT, BUN, 沈渣等)等を中心として副作用の一部をチェックしてみた。

D) Capsule 製剤についての臨床成績 (Table 1, 2, 3)

小児期の急性感染症6種類、計47例に抗生剤としては本剤だけを使用して臨床経過を観察した。また、呼吸器疾患では喀痰または咽頭粘液をCFT投与開始時に採取、培養を行ない、病原菌のある場合にはその感性態度について測定を行なった。このさいCephalosporin系製剤に対する感性検査は検査の都合上CERディスクを使用した。

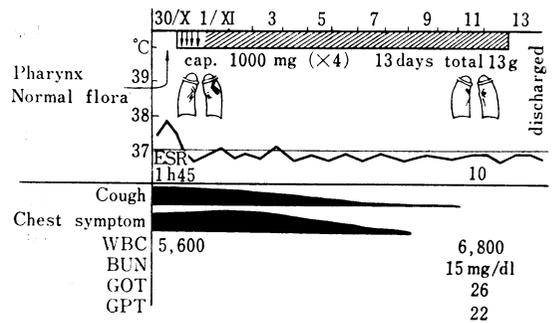
a) 急性扁桃炎……7例

4年6カ月から9年1カ月までの小児症例であるが、発熱、咽頭痛、咳嗽、咽頭諸粘膜の発赤、腫脹を主症状とした病型であるが、CFT約20~30mg/kg, 3~4日の使用で全例2~4日目には平温となり、咽頭痛を消失し、食慾も好転した。咽頭粘液培養上 β -Strept., Staph. aureusの陽性症例に対しても全例著効を示した。

b) 腺窩性扁桃炎……13例

全例38~39.0°C前後の高熱、咽頭痛、咽頭粘膜の著明な発赤腫脹、扁桃腺窩上義膜があり、両側顎下淋巴腺の腫脹を伴った病型であり、多くの症例からの咽頭粘液培養上 β -Strept., Staph. aureusが証明され、これらの菌株の大半はTC, EM耐性または低感性株によって占められていた。CFTの投与量は約20~30mg/kg, 使用

Fig. 3 Bronchopneumonia (6y., ♀, 19kg)



期間 3~8 日となっているが全例 2~4 日目に平温に復し、以後の再発熱をみていない。

c) 急性気管支炎……14例

発熱、咳嗽増加、胸部の散在性ラッセルを主症状とした病型である。CFT 投与量約 30~40mg/kg, 4~6日間。1例を除き 3~6 日目には胸部所見は消失している。

d) 気管支肺炎……5例 (Fig. 3)

3年から7年4カ月に至る5例。胸部レントゲン所見上、また臨床所見からいずれも気管支肺炎の所見が証明されていた。

CFT の投与量約 30~60 mg/kg, 6~13日間となり、喀痰培養上 β -Strept. 3例, Pneumo. 1例が証明されているが、全例 4~7 日間で平温に復するとともに胸部所見も著しく好転した。5例中3例について CFT 投与開始時ならびに 10 日後の GOT, GPT, BUN について比較測定を行なってみたが、異常所見は認められなかった。

e) 顎下淋巴節炎……6例

β -Strept. を起因菌とした習慣性扁桃炎に併発した病型であり、いずれも自然痛を伴い顎下淋巴節(両側)が拇指頭大に腫大していた。CFT 約 30~40mg/kg 投与で 3~6 日目には淋巴節の腫大は縮小し、圧痛も消失している。

f) 急性膀胱炎……2例

2例とも E. coli を起因菌とした病型で、頻尿、排尿痛を主訴として来院している。CFT 約 30~40mg/kg, 6~8 日間の投与で 5~6 日目には自覚症状の消失とともに尿中細菌数も著しく減少、以後の再発をみていない。

E) Dry syrup 製剤についての臨床成績 (Table 4, 5, 6)

a) 急性扁桃炎……5例

病型は Capsule 治療群と類似しており CFT の投与量も約 20~30mg/kg となっているが、全例服用も容易で 2~3 日目には平温に復している。

b) 腺窩性扁桃炎……5例

Table 1 Results of cefatrizine capsules treatment for infection in children

No.	Age, Sex, Body weight (kg)	Diagnosis	Dosage			Causal or isolated organisms and drug sensitivity	Disappearance of main symptom (days)	Clinical response	Side effect
			Daily dose (mg)	Days	Total dose (g)				
1	4y. 6m. ♀ 18.5	Acute tonsillitis	375 (125×3)	4	1.5	Normal flora	3	++	(-)
2	5y. 2m. ♂ 24.0	Acute tonsillitis	750 (250×3)	4	3.0	Normal flora	4	++	(-)
3	5y. 6m. ♂ 22.4	Acute tonsillitis	375 (125×3)	4	1.5	β-Strept. (PC(##), TC(-), CP(+), EM(+), CER(##))	3	++	(-)
4	6y. 1m. ♂ 19.0	Acute tonsillitis	750 (250×3)	3	2.25	β-Strept. (PC(##), TC(+), CP(-), EM(-), CER(##))	3	++	(-)
5	6y. 2m. ♀ 20.0	Acute tonsillitis	750 (250×3)	4	3.0	Staph. aureus (CFT(+), PC(+), TC(+), CP(+), EM(+), CER(##))	3	++	(-)
6	6y. 10m. ♂ 27.0	Acute tonsillitis	375 (125×3)	4	1.5	Normal flora	2	++	(-)
7	9y. 1m. ♂ 30.5	Acute tonsillitis	750 (250×3)	4	3.0	Staph. aureus (PC(##), TC(##), CP(##), EM(+), CER(##))	2	++	(-)
8	4y. 10m. ♂ 18.2	Lacunar tonsillitis	750 (250×3)	3	2.25	Strept. (PC(##), TC(+), CP(+), EM(+), CER(##)), Staph. aureus (PC(+), TC(+), CP(+), EM(+), CER(##))	3	++	(-)
9	4y. 10m. ♂ 18.6	Lacunar tonsillitis	750 (250×3)	3	2.25	Staph. aureus (PC(##), TC(-), CP(+), EM(+), CER(##))	3	++	(-)
10	6y. ♀ 20.2	Lacunar tonsillitis	1,000 (250×4)	3	3.0	Staph. aureus (PC(+), TC(+), CP(+), EM(+), CER(##))	3	++	(-)
11	6y. 6m. ♀ 18.5	Lacunar tonsillitis	750 (250×3)	3	2.25	Staph. aureus (PC(+), TC(##), CP(##), EM(##), CER(##))	3	++	(-)
12	6y. 6m. ♀ 21.0	Lacunar tonsillitis	1,500 (500×3)	3	4.5	β-Strept. (PC(##), TC(+), CP(+), EM(+), CER(##)), Staph. aureus (PC(##), TC(##), CP(##), EM(##), CER(##))	3	++	(-)

13	6y. 7m. ♂ 22.4	Lacunar tonsillitis	1,500 (500×3)	8	12.0	β -Strept. (PC(##), TC(##), CP(##), EM(##), CER(##))	4	+	(-)
14	6y. 8m. ♀ 21.5	Lacunar tonsillitis	1,000 (250×4)	3	3.0	Staph. aureus(##) (PC(+), TC(+), CP(+), EM(+), CER(##))	3	+	(-)
15	6y. 10m. ♂ 23.2	Lacunar tonsillitis	1,500 (500×3)	5	7.55	β -Strept. (PC(##), TC(-), CP(+), EM(+), CER(##))	2	+	(-)
16	6y. 11m. ♂ 19.5	Lacunar tonsillitis	750 (250×3)	4	3.0	Normal flora	2	+	(-)
17	7y. 4m. ♀ 26.5	Lacunar tonsillitis	750 (250×3)	5	3.75	β -Strept. (PC(##), TC(+), CP(+), EM(+), CER(##))	2	+	(-)
18	8y. 11m. ♂ 31.2	Lacunar tonsillitis	1,000 (250×4)	5	5.0	Staph. aureus(##) (PC(##), TC(-), CP(-), EM(+), CER(##))	3	+	(-)
19	9y. 2m. ♀ 30.5	Lacunar tonsillitis	750 (250×3)	5	3.75	Normal flora	2	+	(-)
20	10y. 8m. ♂ 35.1	Lacunar tonsillitis	1,000 (250×4)	7	7.0	Staph. aureus(##) (PC(##), TC(-), CP(-), EM(+), CER(##))	3	+	(-)

Table 2 Results of cefatrizine capsules treatment for acute bronchitis in children

No.	Age, Sex, Body weight (kg)	Diagnosis	Dosage		Causal or isolated organisms and drug sensitivity	Disappearance of main symptom (days)	Clinical response	Side effect	
			Daily dose (mg)	Total dose (g)					
1	3y. 6m. ♀ 17.0	Acute bronchitis	1,000 (250×4)	7	7.0	Normal flora	4	+	(-)
2	3y. 11m. ♂ 14.5	Acute bronchitis	750 (125×6)	5	3.75	Normal flora	5	+	(-)
3	4y. 7m. ♂ 14.8	Acute bronchitis	500 (125×4)	10	5.0	Normal flora	6	+	(-)
4	4y. 9m. ♀ 16.2	Acute bronchitis	750 (250×3)	7	5.25	Normal flora	5	+	(-)
5	5y. 8m. ♀ 18.1	Acute bronchitis	1,000 (250×4)	12	12.0	Normal flora	3	+	(-) G O T 32→31 (10) G P T 22→20 (10) B U N 18→14 (10)

6	6y. 2m. ♂ 15.5	Acute bronchitis	375 (125×3)	7	2.65	—	5	+	(-)
7	6y. 8m. ♀ 17.6	Acute bronchitis	750 (250×3)	7	5.25	Normal flora	4	+	(-)
8	6y. 9m. ♂ 16.8	Acute bronchitis	750 (250×3)	3	2.25	Normal flora	5	?	(-)
9	6y. 10m. ♂ 21.2	Acute bronchitis	1,000 (250×4)	8	8.0	Normal flora	4	+	(-)
10	6y. 10m. ♂ 25.0	Acute bronchitis	1,000 (250×4)	5	5.0	Normal flora	3	+	(-)
11	7y. 2m. ♀ 28.5	Acute bronchitis	750 (250×3)	6	4.5	<i>Haemophilus</i> (+) (ABPC(##), CER(##))	4	+	(-)
12	7y. 4m. ♀ 26.4	Acute bronchitis	750 (250×3)	8	6.0	Normal flora	4	+	(-)
13	7y. 7m. ♀ 28.0	Acute bronchitis	750 (250×3)	8	6.0	<i>Haemophilus</i> (+) (ABPC(##), CER(##))	4	+	(-)
14	8y. 2m. ♂ 33.5	Acute bronchitis	750 (250×3)	8	6.0	Normal flora	5	+	(-)

Table 3 Results of cefatrizine capsules treatment for bronchopneumonia in children

No.	Age, Sex, Body weight (kg)	Diagnosis	Dosage		Causal or isolated organisms and drug sensitivity	Disappearance of main sym- ptom (days)	Clinical response	Side effect	
			Daily dose (mg)	Total dose (g)					
1	3y. ♂ 18.0	Broncho- pneumonia	375~750 (125×3 ~250×3)	6	3.375	<i>β-Strept.</i> (PC(##), TC(+), CP (+), CER(##))	5	+	(-)
2	6y. 2m. ♀ 18.5	Broncho- pneumonia	500~750 (125×4 ~250×3)	7	4.25	<i>Diplo. pneumoniae</i> (PC(##), TC (##), CP(##), CER(##))	7	+	(-)
3	6y. 5m. ♀ 19.2	Broncho- pneumonia	1,000 (250×4)	13	13.5	Normal flora	7	+	(-)
4	7y. 3m. ♂ 19.8	Broncho- pneumonia	1,000 (250×4)	12	12.0	<i>β-Strept.</i> (PC(##), TC(+), CP (+), CER(##))	4	+	(-)
5	7y. 4m. ♂ 22.0	Broncho- pneumonia	1,000 (250×4)	12	12.0	<i>β-Strept.</i> (PC(##), TC(+), CP (+), CER(##))	6	+	(-)

Table 4 Results of cefatrizine capsules treatment for infections in children

No.	Age, Sex, Body weight (kg)	Diagnosis	Dosage		Causal or isolated organisms and drug sensitivity	Disappearance of main symptom (days)	Clinical response	Side effect
			Daily dose (mg)	Total dose (g)				
1	4y. 8m. ♂ 16.0	Lymphonoditis of the neck	750 (250×3)	5.25	Normal flora	6	+	(-)
2	4y. 11m. ♂ 18.2	Lymphonoditis of the neck	750 (250×3)	6.0	β -Strept. (##) (PC(##), TC(+), CP(+), EM(##), CER(##))	5	+	(-)
3	5y. 2m. ♀ 18.6	Lymphonoditis of the neck	750 (250×3)	6.0	β -Strept. (##) (PC(##), TC(-), CP(+), EM(-), CER(##))	5	+	(-)
4	7y. 1m. ♂ 20.0	Lymphonoditis of the neck	1,000 (250×4)	4.0	Normal flora	4	##	(-)
5	9y. 3m. ♀ 26.0	Lymphonoditis of the neck	1,000 (250×4)	5.0	β -Strept. (##) (CP(##), TC(+), EM(+), CER(##))	3	##	(-)
6	10y. 1m. ♂ 31.5	Lymphonoditis of the neck	1,000 (250×4)	8.0	β -Strept. (##) (PC(##), TC(-), CP(+), EM(+), CER(##))	6	+	(-)
7	6y. 4m. ♀ 18.0	Acute cystitis	750 (250×3)	4.5	<i>E. coli</i> ($5 \times 10^8 \rightarrow 6 \times 10^2$, 6th day) (SM(+), KM(+), CER(+))	6	+	(-)
8	7y. 3m. ♀ 23.4	Acute cystitis	750 (250×3)	6.0	<i>E. coli</i> ($6 \times 10^5 \rightarrow 3 \times 10^2$, 5th day)	4	##	(-)

Table 5 Results of cefatrizine dry syrup treatment for infections in children

No.	Age, Sex, Body weight (kg)	Diagnosis	Dosage		Causal or isolated organisms and drug sensitivity	Disappearance of main symptom (days)	Clinical response	Side effect
			Daily dose (mg)	Total dose (g)				
1	1y. 4m. ♂ 11.2	Acute tonsillitis	300 (100×3)	1.2	Normal flora	2	##	(-)
2	1y. 6m. ♂ 10.8	Acute tonsillitis	300 (100×3)	1.5	Normal flora	2	##	(-)
3	2y. 2m. ♀ 12.4	Acute tonsillitis	300 (100×3)	1.8	β -Strept. (PC(##), TC(-), CP(-), EM(+), CER(##))	3	##	(-)
4	2y. 4m. ♂ 13.6	Acute tonsillitis	300 (100×3)	1.5	Normal flora	3	##	(-)
5	2y. 9m. ♂ 14.9	Acute tonsillitis	300 (100×3)	1.8	<i>Staph. aureus</i> (PC(##), TC(-), CP(-), EM(##), CER(##))	3	##	(-)
6	1y. 5m. ♀ 11.2	Lacunar tonsillitis	400 (100×4)	3.6	Normal flora	5	+	(-)
7	2y. 6m. ♂ 13.4	Lacunar tonsillitis	400 (100×4)	3.2	β -Strept. (PC(##), TC(+), CP(+), EM(+), CER(##))	3	##	(-)

No.	Age, Sex, Body weight (kg)	Diagnosis	Dosage		6	2.4	3	+	(-)
			Daily dose (mg)	Days	Total dose (g)				
8	3y. 2m. ♀ 14.2	Lacunar tonsillitis	400 (100×4)	7	2800	2.4	3	+	(-)
9	3y. 5m. ♂ 13.0	Lacunar tonsillitis	500 (125×4)	7	3500	3.5	3	+	(-)
10	3y. 9m. ♂ 14.5	Lacunar tonsillitis	400 (100×4)	8	3200	3.2	2	+	(-)
11	1y. 3m. ♀ 10.0	Lymphonoditis of the neck	300 (100×3)	8	2400	2.4	5	+	(-)
12	1y. 9m. ♂ 12.5	Lymphonoditis of the neck	400 (100×4)	8	3200	3.2	5	+	(-)
13	2y. 2m. ♂ 14.5	Lymphonoditis of the neck	400 (100×4)	8	3200	3.2	4	+	(-)
14	3y. 6m. ♂ 15.2	Lymphonoditis of the neck	400 (100×4)	10	4000	4.0	5	+	(-)
15	3m. ♂ 6.0	Acute cystitis	400 (100×4)	10	4000	4.0	3	+	(-)
16	1y. 2m. ♀ 9.6	Acute cystitis	400 (100×4)	10	4000	4.0	4	+	(-)

Table 6 Results of cefatrizine dry syrup treatment for infections in children

No.	Age, Sex, Body weight (kg)	Diagnosis	Dosage		Disappearance of main symptom (days)	Clinical response	Side effect
			Daily dose (mg)	Days			
1	1y. 10.2 ♀	Bronchitis	800 (200×4)	7	56	+	(-)
2	1y. 9m. ♂ 12.5	Bronchitis	800 (200×4)	2	1.6	?	(-)
3	2y. 11m. ♀ 15.5	Bronchitis	450 (150×3)	12	5.4	+	(-)
4	4y. 3m. ♀ 15.5	Bronchitis	800 (200×4)	7	5.6	+	(-)
5	1y. 8m. ♀ 10.0	Broncho-pneumonia	800 (200×4)	10	8.0	+	(-)
6	1y. 8m. ♀ 9.5	Broncho-pneumonia	800 (200×4)	7	5.6	+	(-)
7	2y. 9m. ♂ 12.0	Broncho-pneumonia	1,200 (400×3)	10	12	+	(-)
8	4y. 4m. ♀ 15.2	Broncho-pneumonia	800 (200×4)	10	8.0	+	(-)
9	5y. 6m. ♂ 16.3	Broncho-pneumonia	800 (200×4)	10	8.0	+	(-)

G O T 53→29(10)
G P T 33→21(10)
B U N14.5→12.7(10)

CFT 約 30mg/kg 前後 6~9 日間の投与で 5 例中 4 例は 2~3 日中に平温に復している。

c) 顎下リンパ節炎…… 4 例

症状は Capsule 群と類似しているが CFT 約 30mg/kg, 8~10 日間の投与で満足すべき治療成績を得ている。

d) 急性膀胱炎…… 2 例 (Fig. 4)

3 月 8 症例は尿培養によって *E. coli*, *Enterococcus*, *Staph. epidermidis* 3 者の混合感染の証明された症例であり, 定量培養上 6×10^5 の菌数であったが, CFT 約 70mg/kg, 10 日間の投与によって 3 日目には尿中細菌は 2×10^2 まで減少, 以後順調に経過している。分離された 3 菌種は CER に対していずれも感性であった。他の *E. coli* を起因菌とした症例に対しても CFT の投与は有効であった。本症例から分離された *E. coli* は SM, TC, CP に対して低感性であった。

e) 気管支炎…… 4 例

CFT 約 30~80mg/kg を使用しているが 4 例中 1 例の 2 日間使用例を除き 3 例は 3~6 日以内に胸部所見はほとんど消失している。

f) 気管支肺炎…… 5 例 (Fig. 5, 6, 7(1)(2), 8(1)(2))

全例多葉性に病変があり, 5 例中 4 例の喀痰からは *Staph. aureus* が多数に培養上証明され, それらは PC に対し耐性または低感性であったが CER に対しては全株感性であった。CFT の使用用量約 50~80mg/kg, 7

~10 日間の使用で 3~6 日目には一般症状とともに胸部所見も好転している。また, 治療開始当日ならびに 10 日目の肝, 腎機能についても検査してみたが異常所見は認められなかった。

3) 副作用ならびに服用状況について (Fig. 9, 10, 11, 12)

Capsule ならびに Dry Syrup の服用による嘔吐, 下痢, 腹痛, 発疹等のみられた症例には遭遇しなかったが, Dry syrup 服用の 25 例中 1 例だけ薬嫌いのため連続服用が困難であった。また, 両剤を 7~10 日投与した場合の前, 後の肝, 腎機能についても比較検査を行なってみたが異常所見は認められなかった。

Fig. 6 Bronchopneumonia (5y. 6m., ♂, 16.3 kg)

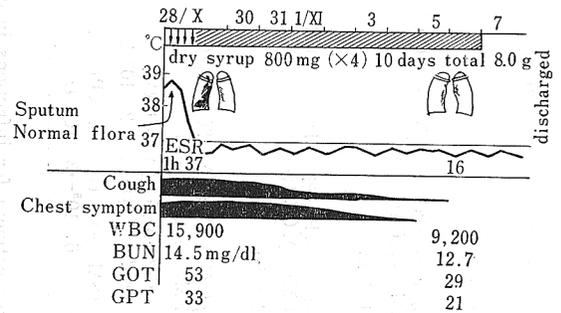


Fig. 7 (1) Bronchopneumonia (2y. 9m., ♀) (Dry syrup)

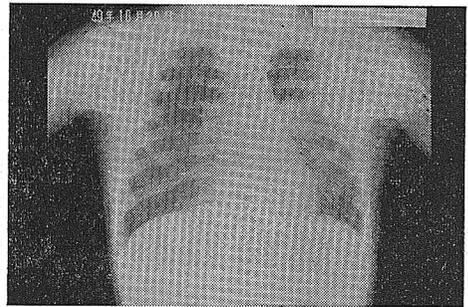


Fig. 7 (2) 14 days after

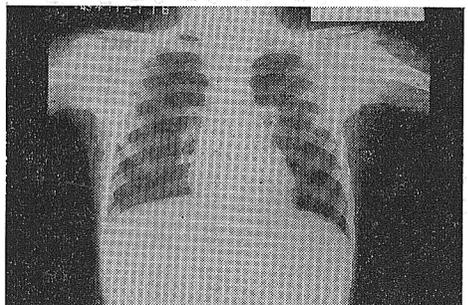


Fig. 4 Urinary tract infection (+VSD) (3m., ♂, 6 kg)

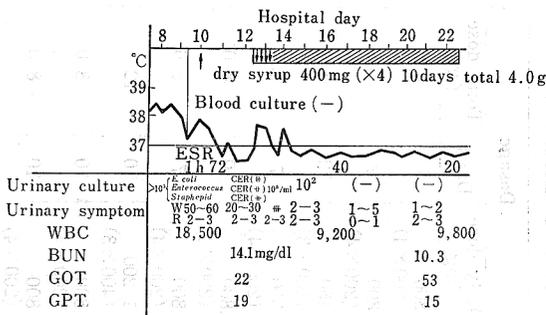


Fig. 5 Bronchopneumonia (2y. 9m., ♂, 12 kg)

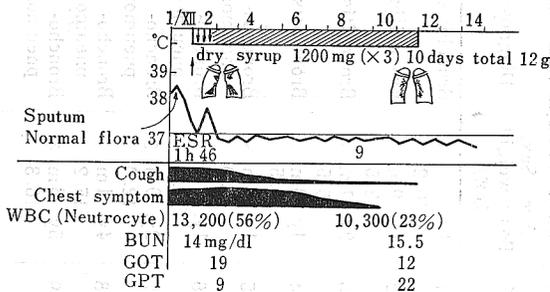


Fig. 8 (1) Bronchopneumonia (5y.6m., ♂)
(Dry syrup)

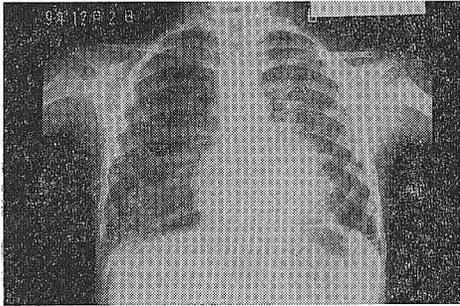


Fig. 8 (2) 9 days after

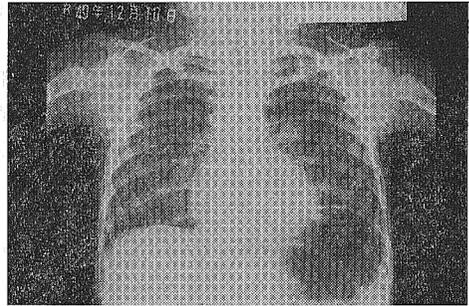


Fig. 9 Influence on S-GOT and S-GPT in continuous administration of cefatrizine (cap.)

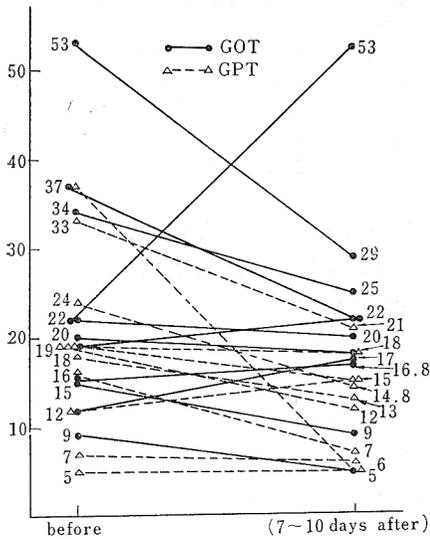


Fig. 10 Influence on BUN in continuous administration of cefatrizine (cap.)

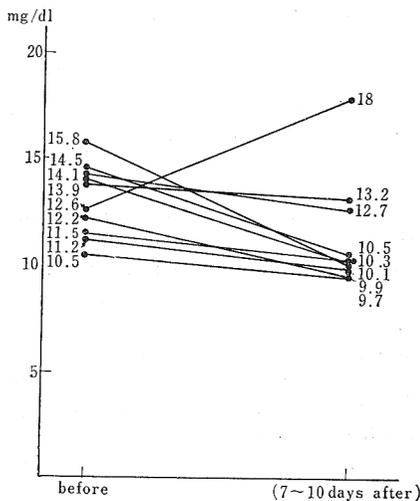


Fig. 11 Influence on S-GOT and S-GPT in continuous administration of cefatrizine (dry syrup) for 7 days

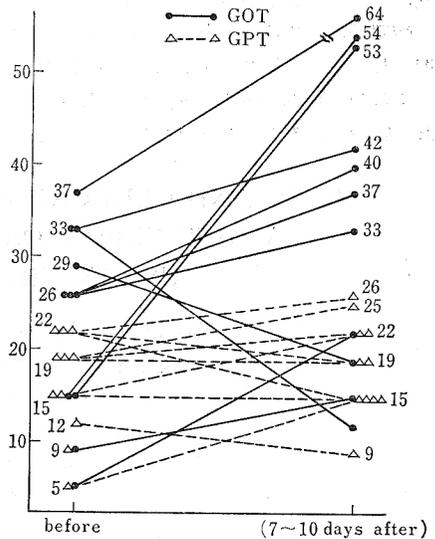
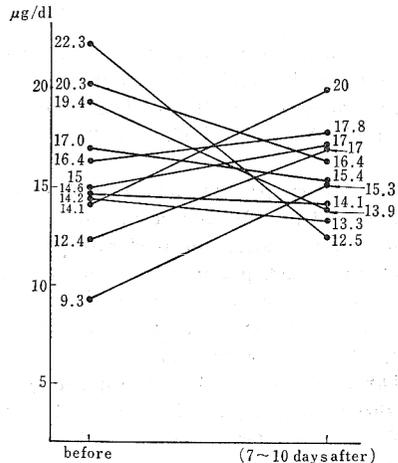


Fig. 12 Influence of BUN in continuous administration of cefatrizine (dry syrup) for 7 days



結 び

1) 本剤は内服によってよく吸収され 1~3 時間までの血中活性濃度は高く, 6 時間以内に投与量の 47.6~78.8% が尿中に活性の状態では排泄された。

2) 小児急性感染症 6 種類, 計 47 例を本剤の内服を主体として治療し, 大半の症例に満足すべき治療成績が得られた。このさいの使用用量は本剤感性軽, 中等感染症では約 20~30mg/kg/日, 肺炎等に対しては約 30~40mg/kg/日であった。

3) Capsule 製剤治療の対象となった, ほぼ類似の小児急性感染症計 33 例を Dry syrup を主体として治療し, 薬嫌いによる継続内服困難の 1 例をのぞき, 全例に明らかな本剤による臨床効果がみられ, 使用用量も Capsule の場合に近似していた。また, Dry syrup 製剤は乳, 幼児でも服用が容易であった。

4) 咽頭粘液, 喀痰培養上耐性 *Staph. aureus* の多数に証明された上, 下気道感染症にも本剤は有効であった。

5) 本剤約 30~50mg/kg/日, 10 日間以内の投与によって肝, 腎機能に悪影響を及ぼした症例はなかった。

(以上の報告の一部は昭和 50 年 9 月, 第 22 回日本化学療法学会東日本支部総会において報告された。)

今回の治験に用いられた Cefatrizine は萬有製薬(株)から提供されたものである。

文 献

- 1) LEITNER, F.; R. E. BUCK, M. MISIEK, T. A. PURSIANO & K. E. PRICE: BL-S640, a cephalosporin with a broad spectrum of antibacterial activity: Properties *in vitro*. Antimicrob. Agents & Chemoth. 7: 298~305, 1975
- 2) LEITNER, F.; D. R. CHISHOLM, Y. H. TSAI, G. E. WRIGHT, R. G. DEREGIS & K. E. PRICE: BL-S640, a cephalosporin with a broad spectrum of antibacterial activity: Bioavailability and therapeutic properties in rodents. Antimicrob. Agents & Chemoth. 7: 306~310, 1975
- 3) WATANAKUNAKORN, C.; T. BANNISTER & C. GLOTZBECKER: Susceptibility of clinical isolates of *Enterobacteriaceae* to BL-S640, a new oral cephalosporin. Antimicrob. Agents & Chemoth. 7: 381~385, 1975

BASIC AND CLINICAL INVESTIGATIONS ON CEFATRIZINE, A NEW CEPHALOSPORIN DERIVATIVE FOR ORAL USE IN THE FIELD OF PEDIATRICS

SUSUMU NAKAZAWA, HAJIME SATO, NAOMICHI FUJII and SEKIYA KOJIMA

Department of Pediatrics, Metropolitan Ebara Hospital and
School of Medicine, Showa University

SHUH OKA

Department of Pediatrics, Denenchofu Central Hospital

HIDEJIRO CHIKAOKA

Department of Pediatrics, Takatsu Central Hospital

YUICHI HIRAMA

Department of Pharmacology, School of Medicine, Showa University

Dry syrup and capsules of cefatrizine, a cephalosporin derivative for oral use, were administered to the patients in the field of pediatrics, and the following results were obtained.

1) This drug was well absorbed in oral forms. Active blood concentration was high during the time of 1 to 3 hours, and 47.6 to 78.8% of the drug administered were excreted into the urine in active state.

2) Forty-seven patients suffering from 6 kinds of infantile acute infections were given capsules of cefatrizine, and satisfactory result was obtained in most of the patients treated. The daily doses were 20 to 30 mg/kg in slight or moderate infections, and 30 to 40 mg/kg in pneumonia and others.

3) Thirty-three patients with infantile acute infections who suffered from almost same infections as the patients given capsules, were administered dry syrup. Except one patient to whom continuous medication was difficult due to the dislike of drugs, favourable clinical results were obtained in all the patients, and the dosage was similar to capsules. Dry syrup was well accepted to the infant patients.

4) The patients with lower respiratory infections confirmed a lot of resistant strains of *Staphylococcus aureus* in pharyngeal mucus and phlegm showed favourable responses to this drug.

5) No unfavourable influence to liver and renal functions was observed within 10 days medication of about 30 to 50 mg/kg/day.