

AB-206 による尿路感染症の治療経験

高橋崎三・鈴木信行・大日向 充・大堀 勉

岩手医科大学医学部泌尿器科学教室

(主任：大堀 勉教授)

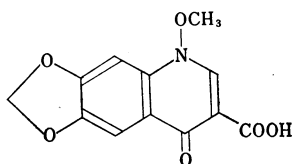
沼 里 進

盛岡赤十字病院泌尿器科

AB-206 は住友化学工業株式会社および大正製薬株式会社の両社で研究開発中の抗菌剤 (Fig.1) で、ほとんどすべてのグラム陰性菌、一部のグラム陽性菌、嫌気性菌、マイコプラズマなどに抗菌活性を示し、また従来の Nalidixic acid (NA), Piromidic acid (PA) に比べはるかに優れた抗菌力を示すなどの特徴をもった薬剤である^{1),2)}。

Fig.1 AB-206

Chemical structure



Chemical name: 5,8-dihydro-5-methoxy-8-oxo-2H-1,3-dioxolo-[4,5-g]quinoline-7-carboxylic acid

Molecular formula: $C_{12}H_9NO_5$

Molecular weight: 263.21

今回われわれは本剤を使用して尿路感染症を治療する機会を得たので、その成績を報告する。

I. 対 象

昭和 52 年 6 月 6 日より約 1 カ月間における岩手医科大学附属病院泌尿器科の外来ならびに入院患者と盛岡赤十字病院外来患者のうちで急性および慢性の尿路感染を有する 22 名の患者を対象とした。

そのうち急性膀胱炎が 8 例、慢性膀胱炎が 14 例である。慢性膀胱炎中基礎疾患を有するものは 9 例で、その内訳は前立腺肥大症術後が 3 例、膀胱腫瘍の根治手術後 1 例、腹部腫瘍による尿管圧迫のための水腎症 1 例、副睾丸炎で尿路結石の疑いのあるもの 1 例、両側腎結石症 1 例、前立腺部よりの横紋筋肉腫による排尿困難なもの 1 例、排尿困難にて経尿道的にカテーテル留置したもの 1 例であった。

性別は男子が 9 例、女子が 13 例である。年齢分布は 19 歳から 75 歳であるが、例外的に 2 歳の男子も 1 例含めた。

慢性膀胱炎 11 例は AB-206 投与前に各種抗生剤および抗菌剤の投与をうけていたが、完治をみないが再発をくり返していた症例である。

II. 投与方法および用量

投与方法は AB-206 (1 錠 250mg) を臨床症状の程度に応じ、1 日 2 錠 (500mg) から 6 錠 (1,500mg) を 2~4 回に分服投与した。投与期間は最短 3 日間、最長 10 日間で主として 7 日間の投薬を行なった。

III. 治療効果の判定法

薬剤投与後の効果判定は UTI 薬効評価基準³⁾ に準じて、自覚症状、膿尿、細菌尿を指標とした。なお、投与症例中、1 例は初診時以後来院しなかったため脱落とした。また、6 例は投与前尿中細菌数 10^3 個/ml 以下であったため薬効評価の判定の対象から除外し、副作用の検討のみ行なった。

副作用については、患者の自覚症状の問診によって調査し、さらに慢性尿路感染症の 6 例については、投与前後の末梢血の変化と腎機能、肝機能に対する影響について調べた。

IV. 治療効果

本剤を投与した 22 例の年齢、性別、症状、病名、投与量、投与期間、起炎菌の種類、治療前後の白血球数および赤血球数、尿中細菌の推移、自覚症状改善の有無、副作用、臨床効果などについては Table 1 に示したとおりである。

臨床効果についてみると、15 例中著効の得られたものは 4 例、有効 5 例、無効 6 例で、その有効率は 60.0% であった。15 例中急性単純性膀胱炎の 6 例では、著効 3 例、有効 3 例で、その有効率は 100% であった。残り 9 例の慢性尿路感染症では、著効 1 例、有効 2 例、無効 6 例で、その有効率は 33.3% であった。無効 6 例 (66.7%) の内訳は前立腺肥大症手術後にカテーテルを留置したものの 2 例、排尿困難のため留置カテーテルをおいたもの 1 例、排尿困難のもの 1 例などが主なものであった。これらの症例では尿中細菌数の改善はみられないかまたは菌交代現象がみられた。

これらの結果より、慢性尿路感染症においては基礎疾

Table 1-1 Clinical results in urinary tract infection

Cases			Diagnosis	Subjective symptom	Method of administration		Urinalysis						Course	Side effect	Clinical effect	Remarks
					Single dose (mg)	Times per day	Days	WBC/HPF		RBC/HPF	Bacteria (cells/ml)					
								Before	After		Before	After				
No.	Name	Sex & Age														
1	N. A.	F 39	Acute cystitis (Simple)	Po, SR	250	3	5	5~10	0	0	0	<i>E. coli</i> 10 ⁵	—	SS resolved UF improved	—	Excellent
2	T. K.	F 30	Acute cystitis (Simple)	Po, MP	500	3	7	##	0	0	0	<i>E. coli</i> 10 ⁵	—	SS resolved UF improved	—	Excellent
3	N. H.	F 29	Acute cystitis (Simple)	Po, MP, SR	500	3	7	##	3~4	5~10	0	<i>E. coli</i> 10 ⁵	—	SS resolved UF improved	Dizziness	Side effect disappeared after administration
4	K. K.	F 42	Acute cystitis (Simple)	Po, MP, SR	250	4	7	20~30	3~4	##	1~2	<i>Proteus mirabilis</i> 10 ⁵	—	SS, UF improved	—	Good
5	S. I.	F 29	Acute cystitis (Simple)	Po, MP, Hematuria	500	3	5	##	10~15	##	10~15	<i>E. coli</i> 10 ⁵	—	SS improved UF slightly improved	—	Good
6	I. T.	F 37	Acute cystitis (Simple)	Po, MP Hematuria	500	3	7	##	0	##	0	<i>E. coli</i> 10 ⁵	—	SS, UF improved	—	Good
7	T. K.	F 41	Chronic cystitis (Simple)	UC	250	3	7	5~6	5~6	0	2~3	<i>Citrobacter freundii</i> 10 ⁵	<i>Candida</i> 10 ⁴	UC unchanged Bacteria replaced	—	Poor Admission for tumor of the gall bladder
8	S. S.	F 19	Chronic cystitis (Simple)	S R	500	3	5	5~6	5~6	0	0	<i>Enterococcus</i> 10 ⁴ <i>F. meningosepticum</i> 10 ⁴	<i>Enterococcus</i> 10 ⁴ <i>F. meningosepticum</i> 10 ⁴	UF, Bacteria unchanged	—	Poor
9	K. N.	F 68	Chronic pyelocystitis (Complicated)	UC	500	3	7	5~6	0~1	0	0	<i>Acinetobacter anitratum</i> 10 ⁵	—	UF slightly improved	—	Excellent Bilateral renal calculus
10	S. K.	F 41	Chronic pyelocystitis (Complicated)	UC	250	4	7	##	15~20	20~25	0	<i>Serratia marcescens</i> 10 ⁴	—	UC improved	—	Good Post operation of vesicovaginal fistula
11	S. K.	M 75	Chronic cystitis (Complicated)	UC	250	3	7	##	##	0	0	<i>Pseudomonas</i> 10 ⁵ <i>F. meningosepticum</i> 10 ⁵	<i>Enterococcus</i> 10 ⁵	UF unchanged Bacteria replaced	—	Poor Indwelling catheter for dysuria

Po : Pollakiuria SR : Sense of retention LD : Lower abdominal discomfort MP : Miction pain
UC : Urinary cloudiness SS : Subjective symptom UF : Urinary findings

Table 1-2 Clinical results in urinary tract infection

Cases			Diagnosis	Subjective symptom	Method of administration		Urinalysis						Side effect	Clinical effect	Remarks	
					Single dose (mg)	Times per day	Days	WBC/HPF		RBC/HPF		Bacteria (cells/ml)				
								Before	After	Before	After	Before				After
12	S. M.	M 2	Chronic cystitis (Complicated)	Po, Dysuria	250	2	6	10~15	10~15	5~6	5~6	<i>E. coli</i> 10 ⁵	—	Poor	Prostatic sarcoma	
13	N. T.	M 69	Chronic cystitis (Complicated)	UC, Po	250	3	8	卄	30~40	2~3	2~3	<i>Serratia marcescens</i> 10 ⁴	—	Good	Post prostatectomy	
14	K. T.	M 74	Chronic vesical urethritis (Complicated)	MP, Po, LD	500	3	7	5~6	5~6	1~2	1~2	<i>Citrobacter freundii</i> 10 ⁵	—	Poor	Indwelling catheter after prostatectomy	
15	H. T.	M 72	Chronic vesical urethritis (Complicated)	U C	250	4	7	50~60	50~60	5~10	8~10	<i>Serratia marcescens</i> 10 ⁴ <i>Enterobacter cloacae</i> 10 ⁴	—	Poor	Indwelling catheter after prostatectomy	
16	K. S.	F 20	Chronic cystitis (Simple)	Po, SR	250	3	7	5~7	N D	0	N D	<i>E. coli</i> 10 ⁵	—	Drop out		
17	Y. T.	F 29	Acute cystitis (Simple)	Po, MP	250	3	3	4~5	8~10	0	0	<i>Pseudomonas</i> 10 ³	Na-usea	—	Side effect disappeared after discontinuance of administration	
18	M. S.	F 26	Acute cystitis (Simple)	Po, MP	250	3	7	15~20	1~3	15~20	0	—	Dis-ziness Na-usea	—	Side effect disappeared after administration	
19	K. Y.	M 43	Chronic cystitis (Simple)	SR, LD	500	3	10	5~6	0~1	0	0	—	—	—		
20	M. K.	M 30	Chronic cystitis (Complicated)	U C	250	4	7	5~6	1~2	0	0	—	—	—	Epididymitis and urinary tract calculus	
21	H. S.	M 64	Chronic cystitis (Complicated)	U C	250	4	7	7~8	3~4	1~2	0	—	—	—	Hydro-nephrosis	
22	K. S.	M 40	Chronic cystitis (Complicated)	Po, SR	250	4	7	10~20	2~3	2~3	0~1	—	—	—	SS appeared before 3 months	

Po : Pollakiuria SR : Sense of retention LD : Lower abdominal discomfort MP : Miction pain

UC : Urinary cloudiness SS : Subjective symptom UF : Urinary findings ND : Not done

Table 2 Clinical results classified by organism

Organism		No. of cases	Clinical efficacy	
			Excellent or good	Poor
Simple infection	<i>E. coli</i>	6	5	1
	<i>Acinetobacter anitratum</i>	1	1	
	<i>Proteus mirabilis</i>	1	1	
	<i>Serratia marcescens</i>	3	2	1
	<i>Citrobacter freundii</i>	2		2
Mixed infection	(<i>Enterococcus</i> <i>F. meningosepticum</i>)	1		1
	(<i>Pseudomonas</i> <i>F. meningosepticum</i>)	1		1

Table 3 Susceptibility of clinical isolated strains to AB-206

MIC (μg/ml)		≤0.1	0.2	0.39	0.78	1.56	3.12	6.25	12.5	25	50	100	>100	200	>200
Organism	Inoculum size 10 ⁶ /ml														
<i>E. coli</i>			4	4											
<i>Proteus mirabilis</i>				1											
<i>Enterococcus</i>												1			2
<i>F. meningosepticum</i>								2							1
<i>Citrobacter freundii</i>						1				1					
<i>Candida</i>															1
<i>Serratia marcescens</i>									2	3					
<i>Enterobacter cloacae</i>										1					
<i>Acinetobacter anitratum</i>						1									
<i>Pseudomonas</i>														1	
MIC (μg/ml)		≤0.1	0.2	0.39	0.78	1.56	3.12	6.25	12.5	25	50	100	>100	200	>200
Organism	Inoculum size 10 ⁸ /ml														
<i>E. coli</i>			2	6											
<i>Proteus mirabilis</i>				1											
<i>Enterococcus</i>															3
<i>F. meningosepticum</i>								2							1
<i>Citrobacter freundii</i>							1				1				
<i>Candida</i>															1
<i>Serratia marcescens</i>										3	2				
<i>Enterobacter cloacae</i>											1				
<i>Acinetobacter anitratum</i>							1								
<i>Pseudomonas</i>															1

患を有しない単純性の場合には本剤は有用な薬剤であると思われるが、いわゆる難治性複雑性の尿路感染症に対しては効果は期待できないと考えられた。

V. 菌種別による治療効果

Table 2 に示すとおり、単独感染の場合、*E. coli* では7例中著効3例、有効2例、無効1例であった。*Acinetobacter anitratum* では著効1例、*Proteus mira-*

bilis では有効1例、*Serratia marcescens* では有効2例、無効1例、*Citrobacter freundii* 2例はともに無効であった。

一方、混合感染では、*Enterococcus*、*F. meningosepticum* によるもの1例、および *Pseudomonas*、*F. meningosepticum* によるもの1例、いずれも無効であった。

Table 4 Susceptibility of clinical isolated strains to NA

MIC ($\mu\text{g/ml}$)	≤ 0.1	0.2	0.39	0.78	1.56	3.12	6.25	12.5	25	50	100	>100	200	>200
Organism Inoculum size $10^6/\text{ml}$														
<i>E. coli</i>					1	5	2							
<i>Proteus mirabilis</i>								1						
<i>Enterococcus</i>														3
<i>F. meningosepticum</i>									2					1
<i>Citrobacter freundii</i>								1						1
<i>Candida</i>														1
<i>Serratia marcescens</i>														5
<i>Enterobacter cloacae</i>														1
<i>Acinetobacter anitratum</i>								1						
<i>Pseudomonas</i>														1

MIC ($\mu\text{g/ml}$)	≤ 0.1	0.2	0.39	0.78	1.56	3.12	6.25	12.5	25	50	100	>100	200	>200
Organism Inoculum size $10^8/\text{ml}$														
<i>E. coli</i>						4	4							
<i>Proteus mirabilis</i>									1					
<i>Enterococcus</i>														3
<i>F. meningosepticum</i>										2				1
<i>Citrobacter freundii</i>									1					1
<i>Candida</i>														1
<i>Serratia marcescens</i>														5
<i>Enterobacter cloacae</i>														1
<i>Acinetobacter anitratum</i>									1					
<i>Pseudomonas</i>														1

VI. 抗 菌 力

薬効評価対象症例および脱落症例から分離された26株について、それぞれ AB-206, NA (Nalidixic acid), ABPC (Aminobenzyl penicillin) の MIC を測定し比較検討した。その結果は、Table 3, 4, 5 に示すとおりで、26 株の内訳は、*E. coli* 8 株、*Proteus mirabilis* 1 株、*Enterococcus* 3 株、*F. meningosepticum* 3 株、*Citrobacter freundii* 2 株、*Candida* 1 株、*Serratia marcescens* 5 株、*Enterobacter cloacae* 1 株、*Acinetobacter anitratum* 1 株、*Pseudomonas* 1 株であった。

E. coli の 8 株についてみると、接種菌量 $10^8/\text{ml}$ では AB-206 の MIC 分布は 0.2, 0.39 $\mu\text{g/ml}$ にそれぞれ 4 株、NA では 1.56 $\mu\text{g/ml}$ に 1 株、3.12 $\mu\text{g/ml}$ に 5 株、6.25 $\mu\text{g/ml}$ に 2 株、ABPC では、3.12 $\mu\text{g/ml}$ に 3 株、6.25 $\mu\text{g/ml}$ に 1 株、>200 $\mu\text{g/ml}$ に 4 株であった。すなわち *E. coli* については AB-206 が NA, ABPC よりはるかに優れていた。また接種菌量 $10^8/\text{ml}$ においてもほぼ同様であった。

Serratia marcescens の 5 株についてみると、接種菌

量 $10^6/\text{ml}$ では AB-206 の MIC 分布は 12.5 $\mu\text{g/ml}$ 2 株、25 $\mu\text{g/ml}$ 3 株、NA では >200 $\mu\text{g/ml}$ 5 株、ABPC でも >200 $\mu\text{g/ml}$ 5 株であった。すなわち *Serratia marcescens* についても AB-206 は NA, ABPC に比べはるかに優れていた。また、接種菌量 $10^8/\text{ml}$ でもほぼ同様であった。

Enterococcus の 3 株についてみると、接種菌量 $10^6/\text{ml}$ では ABPC の抗菌力をもっとも優れており、 $\leq 0.1 \mu\text{g/ml}$ 1 株、0.78 $\mu\text{g/ml}$ 2 株であった。接種菌量 $10^8/\text{ml}$ でもほぼ同様であった。

以上のごとく、*Enterococcus* については ABPC の抗菌力がすぐれていたが、他の菌種については概して AB-206 は NA, ABPC より優れた抗菌力を示していた。

AB-206 の抗菌力に対する NA, ABPC, CEX, GM との相関を *E. coli* について Fig. 2~5 に、*Enterococcus* については Fig. 6~9 に示した。すなわち、*E. coli* については接種菌量 $10^6/\text{ml}$ および $10^8/\text{ml}$ のいずれにおいても、AB-206 が他の 4 剤よりも優れていた。しかし、*Enterococcus* については AB-206 が ABPC, CEX, GM の 3 剤よりも劣っていた。また、AB-206 の抗菌力に対

Table 5 Susceptibility of clinical isolated strains to ABPC

MIC (μg/ml)															
Organism	Inoculum size 10 ⁶ /ml	≤0.1	0.2	0.39	0.78	1.56	3.12	6.25	12.5	25	50	100	>100	200	>200
<i>E. coli</i>							3	1							4
<i>Proteus mirabilis</i>							1								
<i>Enterococcus</i>		1			2										
<i>F. meningosepticum</i>															3
<i>Citrobacter freundii</i>															2
<i>Candida</i>															1
<i>Serratia marcescens</i>															5
<i>Enterobacter cloacae</i>															1
<i>Acinetobacter anitratum</i>											1				
<i>Pseudomonas</i>															1

MIC (μg/ml)															
Organism	Inoculum size 10 ⁸ /ml	≤0.1	0.2	0.39	0.78	1.56	3.12	6.25	12.5	25	50	100	>100	200	>200
<i>E. coli</i>							1	3							4
<i>Proteus mirabilis</i>							1								
<i>Enterococcus</i>		1			2										
<i>F. meningosepticum</i>															3
<i>Citrobacter freundii</i>															2
<i>Candida</i>															1
<i>Serratia marcescens</i>															5
<i>Enterobacter cloacae</i>															1
<i>Acinetobacter anitratum</i>												1			
<i>Pseudomonas</i>															1

Table 6 Hematological findings before and after AB-206 administration

Case	RBC (×10 ⁴)		W B C		Hb (g/dl)		Ht (%)	
	Before	After	Before	After	Before	After	Before	After
No. 7 T. K.	425	410	22,000	21,000	12.2	11.9	36.0	34.9
No. 9 K. N.	393	358	7,800	5,400	12.6	11.2	37.2	32.9
No.10 S. K.	446	486	10,000	12,000	12.0	13.0	34.7	38.6
No.21 H. S.	359	266	3,900	2,800	12.2	8.8	34.6	25.6
No.12 S. M.	467	480	8,700	24,000	12.6	13.8	36.5	39.1
No.14 K. T.	364	359	12,000	9,300	11.8	11.6	33.9	34.1

Table 7 Laboratory findings before and after AB-206 administration

Case	BUN (mg/dl)		s-Creatinine (mg/dl)		G O T		G P T		Al-P	
	Before	After	Before	After	Before	After	Before	After	Before	After
No. 7 T. K.	14.1	9.0	0.7	0.6	14	15	5	11	14.3	12.0
No. 9 K. N.	9.9	13.3	0.9	0.7	17	14	6	5	11.8	—
No.10 S. K.	8.8	9.9	—	—	34	15	14	4	5.5	6.0
No.21 H. S.	—	—	—	—	24	22	22	5	7.8	10.1
No.12 S. M.	—	14.5	1.0	0.6	26	30	8	10	18.2	10.0
No.14 K. T.	25	12.2	0.8	0.9	15	28	4	7	4.6	4.4

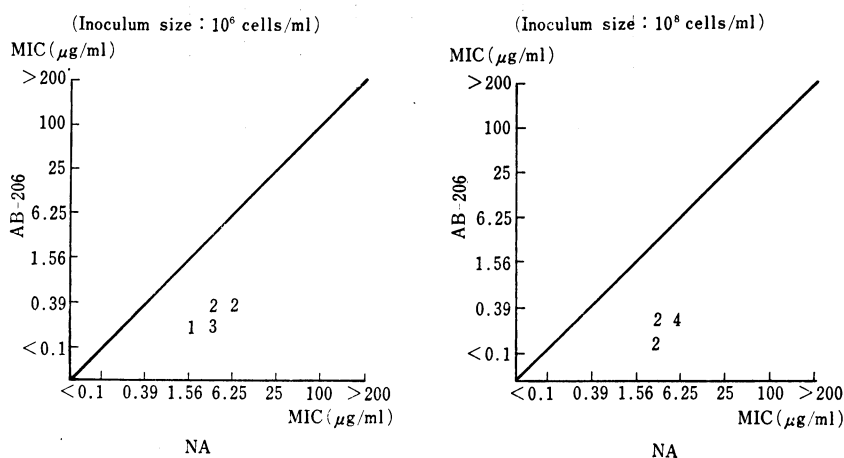
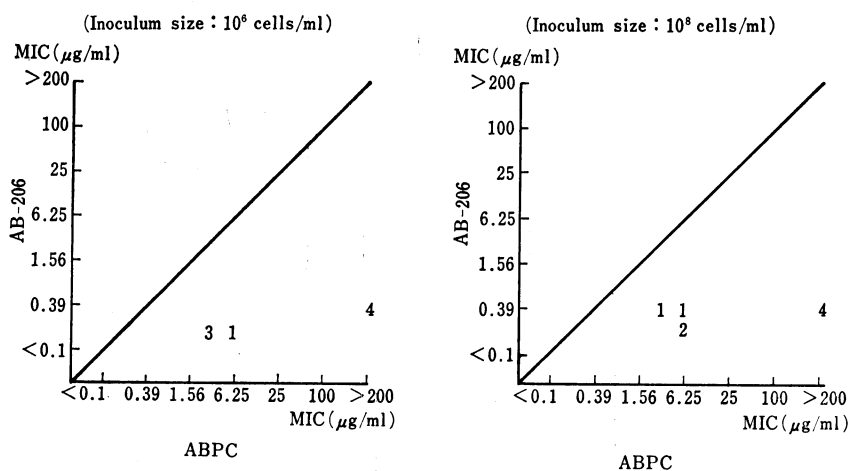
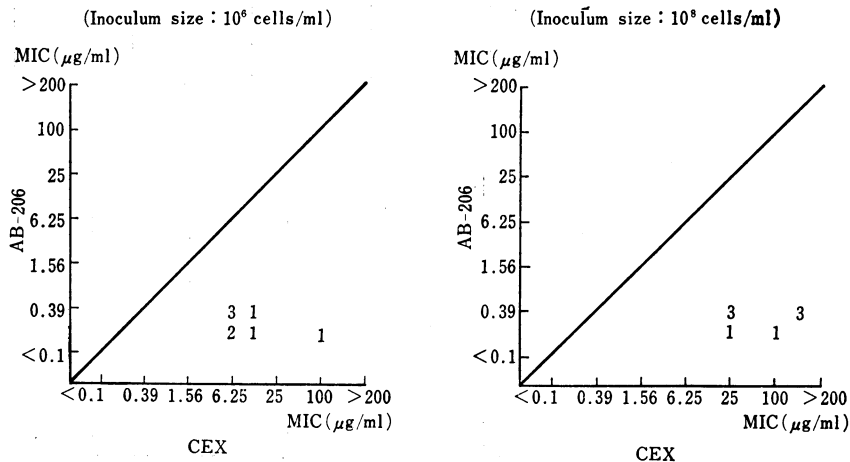
Fig.2 Sensitivity correlogram of *E. coli* (8 strains)Fig.3 Sensitivity correlogram of *E. coli* (8 strains)Fig.4 Sensitivity correlogram of *E. coli* (8 strains)

Fig.5 Sensitivity correlogram of *E. coli* (8 strains)

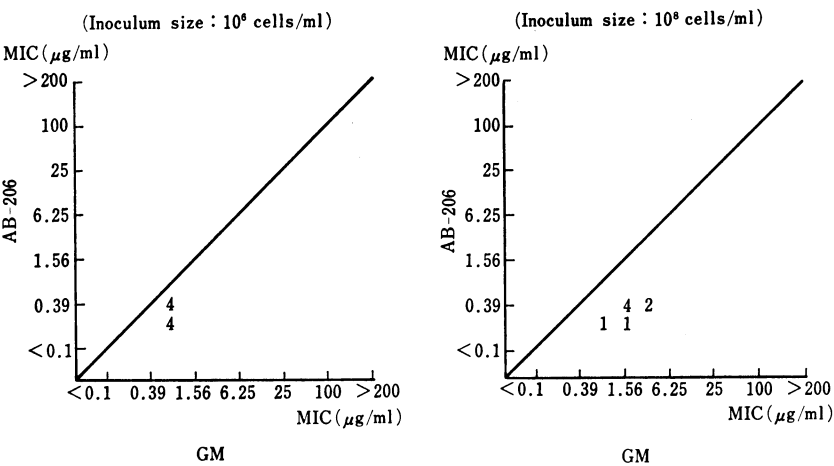


Fig.6 Sensitivity correlogram of *Enterococcus* (3 strains)

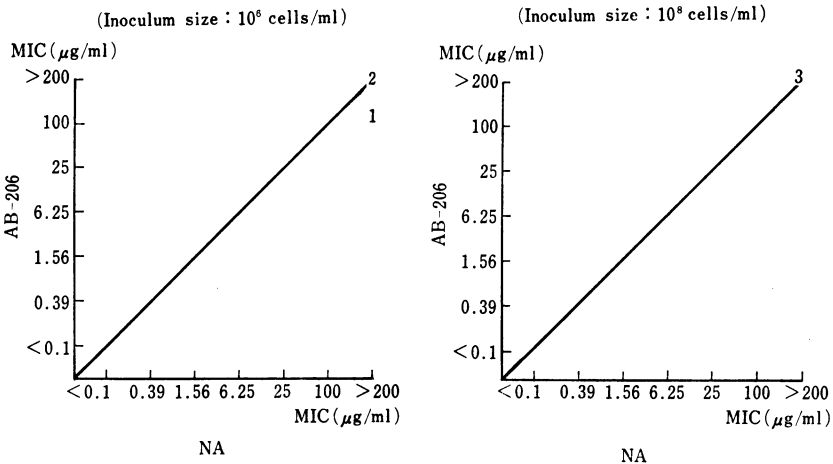


Fig.7 Sensitivity correlogram of *Enterococcus* (3 strains)

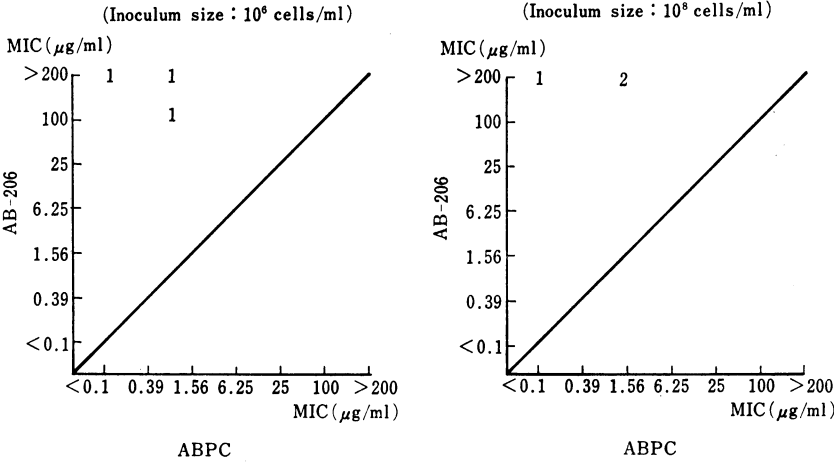


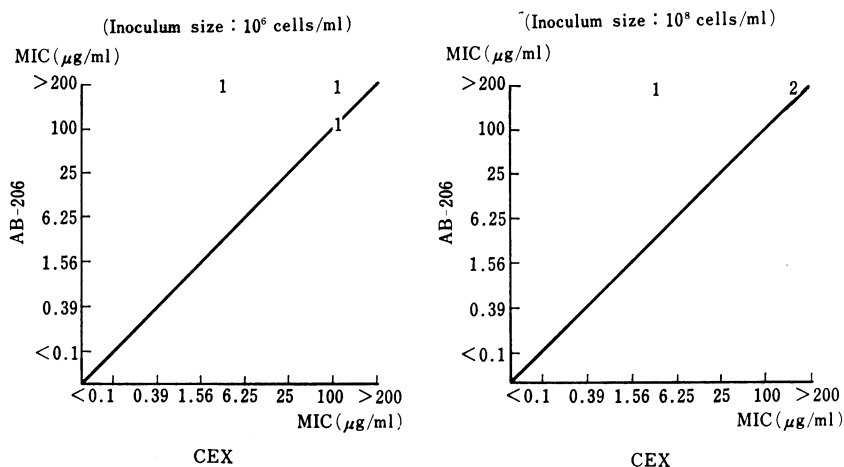
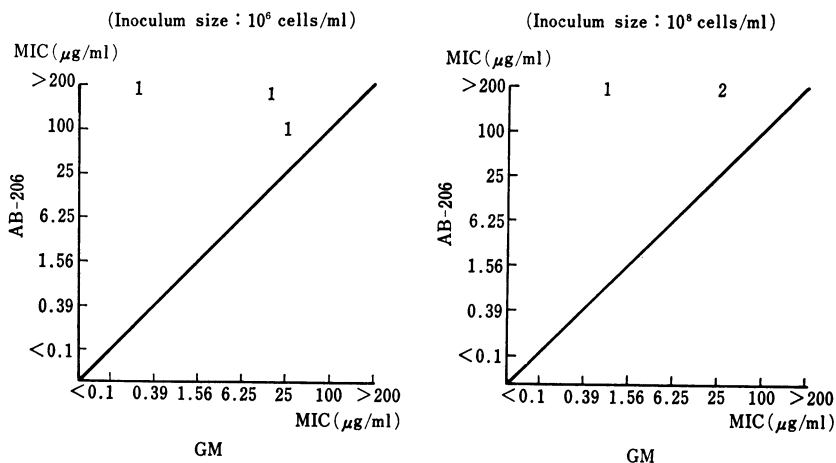
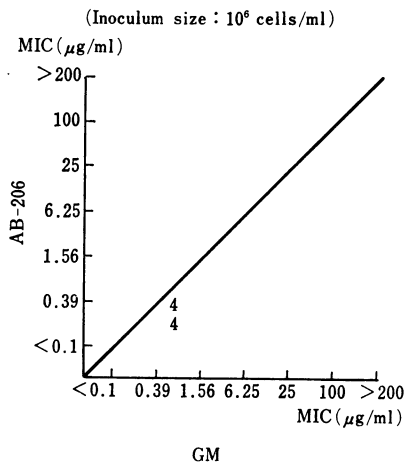
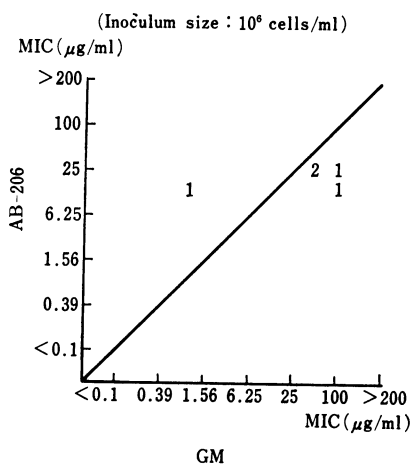
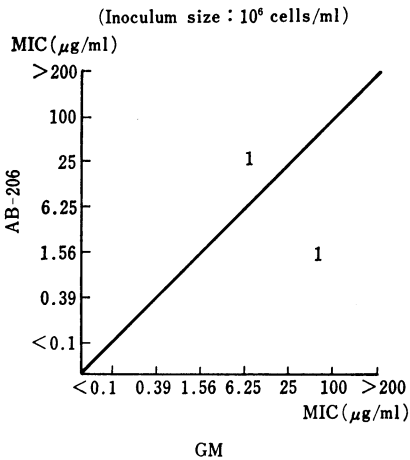
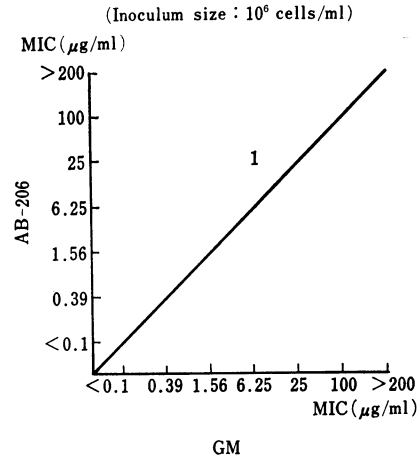
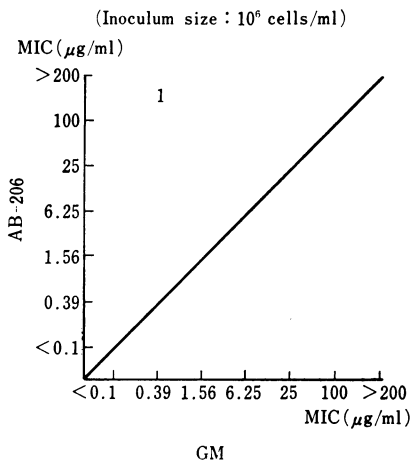
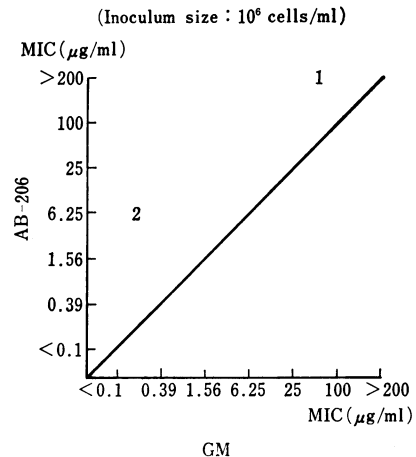
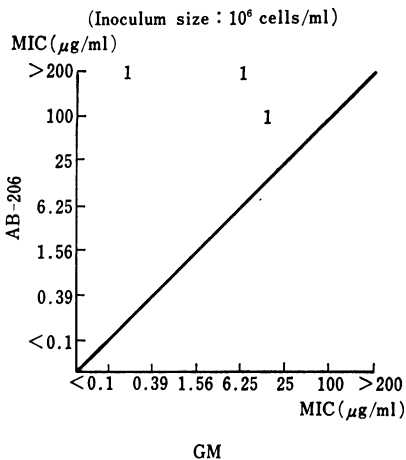
Fig.8 Sensitivity correlogram of *Enterococcus* (3 strains)Fig.9 Sensitivity correlogram of *Enterococcus* (3 strains)Fig.10 Sensitivity correlogram of *E. coli*Fig.11 Sensitivity correlogram of *Serratia marcescens*

Fig.12 Sensitivity correlogram of *Citrobacter freundii*Fig.13 Sensitivity correlogram of *Enterobacter cloacae*Fig.14 Sensitivity correlogram of *Pseudomonas*Fig.15 Sensitivity correlogram of *Flavobacterium*Fig.16 Sensitivity correlogram of *Enterococcus*

する GM の相関を各菌種について検討し, Fig.10~16 に示した。

E. coli については AB-206 の方が優れ, *Serratia marcescens* も AB-206 の方がやや優れていたが, 他の菌種は GM の方が優れていた。

VII. 副作用

本剤投与症例のうち 6 例について投与前後の採血により末梢血, 肝機能, 腎機能の推移を検査した。

Table 6, Table 7 に示したように本剤 500~1,500mg を 3~7 日間投与した場合, 本剤によると思われる異常所見は認められなかった。Table 6 の No.12 と No.21 の 2 症例において, 本剤投与後の白血球数の異常がみられたのは, 腹部腫瘍に対する放射線照射による影響と腎盂腎炎の併発によるものと思われた。

自覚症状は本剤投与によると思われる“めまい” 1 例 (No.3) と“嘔気” 1 例 (No.17) および“めまい, 嘔

気” 1 例 (No. 18) の 3 例に認められたが、軽度で一過性のものであった。3 例とも本剤投与の中止により速やかにこれらの症状は消失した。

以上の結果からみて、尿流障害などの基礎疾患を有しない単純性の急性および慢性尿路感染症に対して AB-206 は充分効果を期待できる有用な化学療法剤であると考えられた。

VIII. 結 語

われわれは、諸種尿路感染症 22 例に対して、AB-206 (5,8-Dihydro-5-methoxy-8-oxo-2H-1,3-dioxolo-[4,5-g] quinoline-7-carboxylic acid) を 1 日量 500~1,500mg, 3~10 日間にわたり経口投与し、次のような結果を得た。

1) 急性単純性膀胱炎 6 例においては著効 3 例、有効 3 例で、その有効率は 100% であった。慢性尿路感染症 9 例では、著効 1 例、有効 2 例、無効 6 例で、その有効率は 33.3% であった。なお、無効の 6 例は、複雑性の慢性尿路感染症であった。以上を合計すると、15 例中著効 4 例、有効 5 例、無効 6 例でその有効率は 60.0% であった。

2) 検出菌種別による本剤の治療効果は、*E. coli* に優れており、また *Serratia marcescens*, *Acinetobacter anitratum*, *Proteus mirabilis* に対しても効果を認めた。

3) 22 例中 16 例から分離した 26 菌株について、それぞれ AB-206, NA, ABPC の MIC を測定し、比較検討した。その結果、*E. coli* および *Serratia marcescens* においては AB-206 の抗菌力は NA, ABPC よりもはるかに優れ、他の菌種においても概して同等または AB-206 の方がやや優れていた。しかし、*Enterococcus* においては、ABPC が AB-206, NA よりも優れていた。

4) 副作用は嘔気、めまい、嘔気とめまいをそれぞれ 1 例ずつ認めたが、いずれも軽度、一過性のものであった。また、本剤投与後、末梢血、肝機能、腎機能には異常所見を認めなかった。

文 献

- 1) AGUI, H.; T. MITANI, A. IZAWA, T. KOMATSU & T. NAKAGOME: Studies on quinoline derivatives and related compounds. 5. Synthesis and antimicrobial activity of novel 1-alkoxy-1,4-dihydro-4-oxo-3-quinolinecarboxylic acids. J. Med. Chem. 20: 791~796, 1977
- 2) 石神襄次: 第 24 回日本化学療法学会東日本支部総会 新薬シンポジウム AB-206, 札幌, 1977
- 3) 大越正秋, 西浦常雄, 熊本悦明, 西村洋司, 斉藤豊一, 生亀芳雄, 河村信夫, 名出頼男, 河田幸道, 石神襄次, 新島端夫, 黒川一男, 百瀬俊郎: UTI 薬効評価基準 (第 1 版)。第 25 回日本化学療法学会総会, 岐阜, 1977

CLINICAL EXPERIENCE WITH AB-206 IN THE TREATMENT OF URINARY TRACT INFECTIONS

SAKIZO TAKAHASHI, NOBUYUKI SUZUKI, MITSURU OHINATA
and TSUTOMU OHORI

Department of Urology, School of Medicine, Iwate Medical University,
Morioka, Japan
(Prof. T. OHORI)

SUSUMU NUMASATO

Department of Urology, Morioka Red Cross Hospital, Morioka, Japan

AB-206 (5,8-dihydro-5-methoxy-8-oxo-2H-1,3-dioxolo-[4,5-g] quinoline-7-carboxylic acid) was administered orally to a total of 22 cases of various urinary tract infections in dosages of 500 to 1,500 mg/day for a period of 3 to 10 days. The following results were obtained.

1) Among 6 cases of acute simple cystitis, the therapeutic results were rated as excellent in 3 cases, and as good in 3 cases, with an efficacy rate of 100%. Regarding 9 cases of chronic urinary tract infections, the results were rated as excellent in 1 case, as good 2 cases and poor in 6 cases. Thus, the efficacy rate in these cases became 33.3%. Six cases which failed to respond to AB-206 were all diagnosed as having chronic urinary tract infections. In all, the results of treatment were rated as excellent in 4 cases, as good in 5 cases and as poor in 6 cases. The efficacy rate was 60.0%.

2) An inspection of the results as classified by the causative organisms revealed that AB-206 is highly active against *E. coli* and that it is also active against *Serratia marcescens*, *Acinetobacter anitratum* and *Proteus mirabilis*.

3) MIC of AB-206 for 26 strains of organisms isolated from 16 out of 22 cases was determined and compared to that of NA and ABPC. It was shown that AB-206 was much more active than NA and ABPC against *Serratia marcescens* and that in general it was equally or slightly more active against other species of organisms. However, against *Enterococcus* ABPC was superior to AB-206 and NA.

4) The adverse reactions observed were nausea, dizziness and nausea associated with dizziness in one case each, all of which were mild and transient in nature. With respect to peripheral blood and liver and renal functions, no abnormal findings which could be related to treatment with AB-206 were observed.