

複雑性尿路感染症に対する Cefuroxime の基礎的・臨床的検討

鎌田日出男・高本 均・平野 学・近藤捷嘉

荒木 徹・大森弘之

岡山大学医学部泌尿器科学教室 (主任: 大森弘之教授)

松 村 陽 右

高知県立中央病院泌尿器科 (部長: 松村陽右博士)

Cefuroxime は英国で開発された新しい半合成 Cephalosporin 系抗生物質で、 β -lactamase に対し抵抗性の強い広領域 spectrum の新物質である。臨床分離各種グラム陰性桿菌の本剤に対する MIC を測定したが、Cafazolin に比較して良好な成績を得た。健康成人 1 名について体液濃度を測定したが、血中濃度は high level で 6 時間までにほとんどが尿中へ排泄された。臨床成績の検討では、緑膿菌感染症例が多いため、本剤に対する薬効評価が充分になされなかった。しかし、起炎菌の消失率は 66.7% であり、緑膿菌以外のグラム陰性桿菌症例では良い結果を得た。

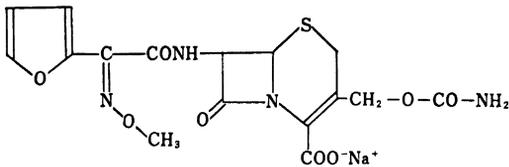
新しい半合成 Cephalosporin C 系の抗生物質である Cefuroxime を尿路感染症に使用したので、若干の基礎成績とともに臨床成績を報告する。

Cefuroxime は、化学名 (6R, 7R)-3-carbamoyloxy-methyl-7-[(2Z)-2-methoxyimino (fur-2-yl) aceta-mido]-ceph-3-em-4-carboxylic acid, 化学構造式は Fig. 1 に示すとおりで、分子式 $C_{16}H_{13}N_4NaO_8S$, 分子量 446.4, 水溶性の白色ないし淡黄色の結晶性粉末である¹⁾。

I. 抗 菌 力

当教室保存の尿路感染症から分離したグラム陽性球菌

Fig. 1 Chemical structure of cefuroxime



11 株, グラム陰性桿菌 114 株と標準株 *S. aureus* 209 P と *E. coli* NIH JC 2 に対する Cefuroxime の抗菌力を測定した。測定は日本化学療法学会標準法に準じて 10^8 , 10^7 接種について行なった (Table 1, 2)。培地は Heart infusion agar (ニッサン) を使用し、接種は点状接種法を用いた。また 10^8 接種において同時に Cefazolin (以下 CEZ と略す) の抗菌力を測定し、Cefuroxime との感受性相関を検討した。まず Cefuroxime の各種細菌に対する抗菌力をみると、 10^8 接種では、*S. aureus* 11 株中 7 株が $3.12 \mu\text{g/ml}$ 以下に分布し、標準株 *S. aureus* 209 P の MIC は $1.56 \mu\text{g/ml}$ であった。*E. coli* 26 株では $6.25 \mu\text{g/ml}$ に peak を有し、19 株は $6.25 \mu\text{g/ml}$ 以下に分布した。標準株 *E. coli* NIH JC 2 の MIC は $6.25 \mu\text{g/ml}$ であった。*Proteus mirabilis* 32 株では 19 株が $12.5 \mu\text{g/ml}$ 以下に分布し良い抗菌力を示したが、*Proteus vulgaris* では全株、*Klebsiella* 11 株では 9 株が $100 \mu\text{g/ml}$ 以上の耐性を示した。

10^7 接種についてみると、1~2 段階程度強い抗菌力

Table 1 MIC of cefuroxime ($\mu\text{g/ml}$)(Inoculum size: $10^8/\text{ml}$)

Organisms	No. of strains	MIC ($\mu\text{g/ml}$)									
		≤ 0.39	0.78	1.56	3.12	6.25	12.5	25	50	100	>100
<i>S. aureus</i>	11	1		4	2		1				3
<i>E. coli</i>	26		1	2	6	10	3	1	1		2
<i>Proteus mirabilis</i>	32			2	3	6	8	2	1		10
<i>Proteus vulgaris</i>	5										5
<i>Klebsiella</i>	11						1	1			9
<i>Serratia</i>	26										26
<i>Pseudomonas</i>	14										14
<i>S. aureus</i> 209 P	1			1							
<i>E. coli</i> NIH JC 2	1					1					

Table 2 MIC of cefuroxime ($\mu\text{g/ml}$) (Inoculum size : $10^7/\text{ml}$)

Organisms	No. of strains	≤ 0.39	0.78	1.56	3.12	6.25	12.5	25	50	100	> 100
<i>S. aureus</i>	11	1		4	2		1			1	2
<i>E. coli</i>	26			1	10	6	1	4	1	1	2
<i>Proteus mirabilis</i>	32	1		3	3	10	6	2	1		6
<i>Proteus vulgaris</i>	5					1					4
<i>Klebsiella</i>	11				1		1		1	2	6
<i>Serratia</i>	26										26
<i>Pseudomonas</i>	14										14
<i>S. aureus</i> 209 P	1			1							
<i>E. coli</i> NIH JC 2	1					1					

Fig. 2 Correlogram between cefuroxime and CEZ

Fig. 4 Correlogram between cefuroxime and CEZ

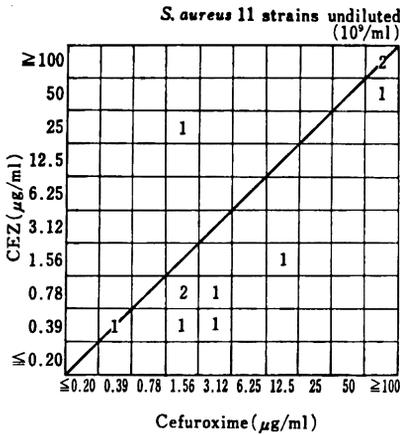


Fig. 3 Correlogram between cefuroxime and CEZ

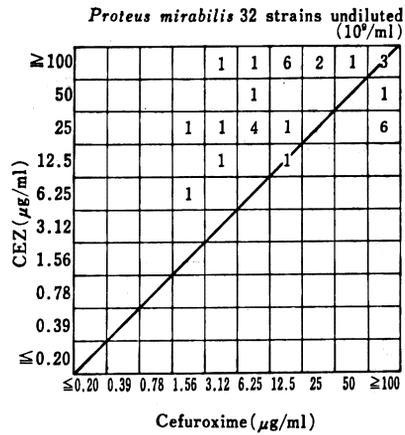
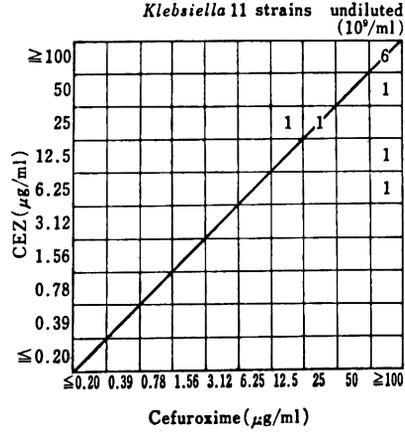
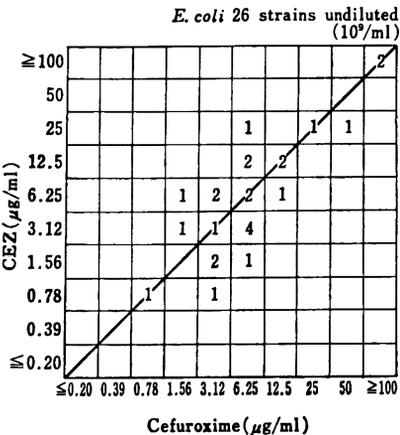


Fig. 5 Correlogram between cefuroxime and CEZ



を示しており、なかでも *Proteus mirabilis* では 32 株中 23 株が 12.5 $\mu\text{g/ml}$ 以下に分布した。

次に 10^8 接種において Cefuroxime と CEZ の感受性相関をみると、*S. aureus* では CEZ よりやや弱い成績を示した (Fig. 2)。*E. coli* では CEZ と同程度の成績

である (Fig. 3)。*Proteus mirabilis* では CEZ より良好な成績を示した (Fig. 4)。*Klebsiella* では CEZ よりやや弱い成績であった (Fig. 5)。

II. 血中濃度および尿中排泄

健康成人 1 名に Cefuroxime 750mg を one-shot 静

Table 3 Clinical cases of cefuroxime

No.	Age Sex	Diagnosis (underlying disease)	Dose (g × day)	Catheter	Clinical findings before treatment		Clinical findings after treatment		Clinical response	Side effect
					WBC in urine	Organisms & Colony count	WBC in urine	Organisms & Colony count		
1	68 M	Chronic cystitis (bladder tumor)	1.5 × 7 i. v.	—	##	<i>P. mirabilis</i> <i>S. faecalis</i> >10 ⁵	—	—	Excellent	—
2	63 M	Chronic cystitis (prostatic hypertrophy)	1.5 × 5 i. v.	—	+	<i>Pseudomonas</i> <i>Serratia</i> 9 × 10 ⁵	—	<i>Serratia</i> 3 × 10 ⁸	Good	—
3	70 M	Chronic cystitis (prostatic cancer)	1.5 × 5 i. v.	+	+	<i>Pseudomonas</i> 10 ⁵	—	<i>Pseudomonas</i> 5 × 10 ⁵	Poor	—
4	69 M	Chronic cystitis (post prostatectomy)	1.5 × 5 i. v.	+	##	<i>Serratia</i> >10 ⁵	++	<i>Pseudomonas</i> 10 ⁵	Poor	—
5	67 M	Chronic cystitis (bladder tumor)	1.5 × 5 i. v.	—	+	<i>Pseudomonas</i> 2 × 10 ⁵	±	<i>Pseudomonas</i> 10 ⁴	Poor	—
6	69 M	Chronic cystitis (bladder tumor)	1.5 × 5 i. v.	—	##	<i>Klebsiella</i> >10 ⁵	++	<i>Enterobacter</i> <i>aerogenes</i> 6 × 10 ⁴	Poor	—
7	74 M	Chronic cystitis (bladder tumor)	1.5 × 5 i. v.	+	+	<i>Pseudomonas</i> <i>Serratia</i> >10 ⁵	##	<i>Pseudomonas</i> >10 ⁵	Poor	—
8	63 M	Chronic cystitis (prostatic hypertrophy)	1.5 × 5 i. v.	—	##	<i>Serratia</i> 6 × 10 ⁵	##	<i>Pseudomonas</i> 10 ⁵	Poor	—
9	75 M	Chronic cystitis (prostatic hypertrophy, bladder stone)	2.0 × 5 i. v.	+	+	<i>Klebsiella</i> >10 ⁵	++	<i>Pseudomonas</i> >10 ⁵	Poor	—
10	76 M	Chronic cystitis (bladder tumor post ope.)	2.0 × 5 i. v.	—	+	<i>Serratia</i> >10 ⁵	—	<i>Pseudomonas</i> <10 ⁵	Good	—
11	76 M	Chronic cystitis (bladder tumor post ope.)	2.0 × 5 i. v.	—	+	<i>Pseudomonas</i> 10 ⁵	±	—	Good	—
12	49 M	Chronic cystitis (urethral stricture post ope.)	3.0 × 5 i. v.	+	+	<i>Serratia</i> >10 ⁵	++	<i>Serratia</i> >10 ⁵	Poor	—
13	72 M	Chronic cystitis (bladder tumor post ope.)	1.5 × 5 i. m.	—	+	<i>Pseudomonas</i> >10 ⁵	+	<i>Pseudomonas</i> >10 ⁵	Poor	—
14	42 M	Chronic pyelonephritis (PUJ-stenosis post ope.)	1.5 × 3 i. v.	+	+	<i>Serratia</i> >10 ⁵	++	<i>Pseudomonas</i> <i>Serratia</i> >10 ⁵	Poor	—
15	60 F	Chronic pyelonephritis (VUR)	2.0 × 5 i. v.	—	##	<i>Klebsiella</i> >10 ⁵	—	<i>Enterobacter</i> <i>Pseudomonas</i> 10 ⁴	Excellent	—
16	50 M	Chronic pyelonephritis (bil. renal stones)	2.0 × 5 i. v.	—	+	<i>P. mirabilis</i> 10 ⁵	++	<i>P. mirabilis</i> <10 ⁵	Poor	—
17	33 F	Chronic pyelonephritis (rt. renal stone post ope.)	3.0 × 5 i. v.	—	##	<i>Serratia</i> >10 ⁵	+	—	Good	—
18	14 M	Chronic pyelonephritis (PUJ-stenosis post ope.)	1.5 × 5 i. m.	+	+	<i>Serratia</i> >10 ⁵	±	<i>Serratia</i> >10 ⁵	Poor	—

Fig. 6 Serum levels of cefuroxime

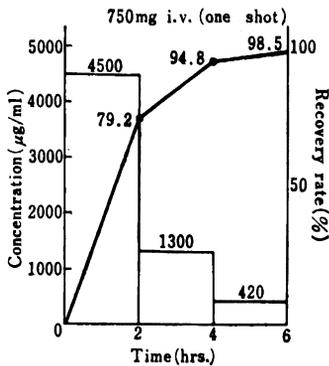
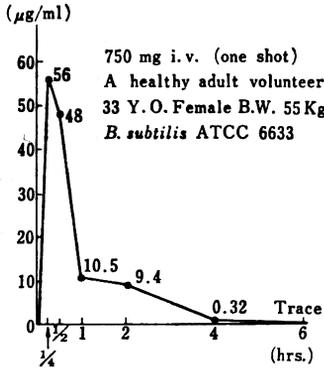


Fig. 7 Urinary excretion of cefuroxime



注し静注後6時間までの血中濃度の推移および尿中排泄を検討した。測定は *Bacillus subtilis* ATCC 6633 を検定菌とした cup plate method で行なった。標準曲線は pH 6.0 phosphate buffer により作製し、検体の希釈も同一の buffer で施行した。

血中濃度の peak は静注後15分にあり、56 µg/ml であった。その後、血中濃度は速やかに低下し、静注後6時間では血中から検出しえなかった (Fig. 6)。

尿中濃度は0~2時間では、4,500 µg/ml、2~4時間では、1,300 µg/ml と高い濃度を示した。

尿中排泄量をみると、静注後2時間までで594mg、6時間までで739mgであり、それぞれの尿中回収率は79.2%、98.5%であった (Fig. 7)。

III. 臨床成績

1. 投与対象および投与方法

Cefuroxime を投与した対象は岡山大学泌尿器科入院患者28名で、除外脱落症例は10名で残り18名について検討した。この除外脱落症例10例は、投与前の菌数不足例3例、投与前後の検査が不足している例5例、性器感染症2例である。男16名、女2名、年齢は14歳

から76歳、平均60.6歳である。いずれも基礎疾患を有する複雑性尿路感染症であり、その内訳は慢性複雑性腎盂腎炎5例および慢性複雑性膀胱炎13例である (Table 3)。なお尿路にカテーテルを留置している例は7例である。

Cefuroxime の投与は原則として one-shot 静注で、1日1.5~3.0g を5日間連続投与した。なお筋注例は2例で、1日1.5g を投与した。

2. 臨床効果

臨床効果の判定は U. T. I. 薬効評価基準に準じて行ない、以下の結果を得た。

慢性複雑性腎盂腎炎5例では著効1例、有効1例、無効3例であり、慢性複雑性膀胱炎13例では著効1例、有効3例、無効9例である。全体では18例中著効2例、有効4例、無効12例である。なお尿路カテーテル留置中の7例についてみると、全例無効であった。

3. 細菌学的効果

Cefuroxime 投与前分離菌株は21株で、*Serratia* 9株、*Pseudomonas* 6株、*Klebsiella* 3株、*Proteus mirabilis* 2株、*Streptococcus faecalis* 1株である。これら分離菌と臨床効果との関係を見ると (Table 4)、*Serratia* 9株中有効3株、無効6株、*Pseudomonas* 6株中有効2株、無効4株、*Klebsiella* 3株中著効1株、無効2株、*Proteus mirabilis* 2株中著効1株、無効1株、*Streptococcus faecalis* 1株は著効だった。

Table 4 Isolates and clinical results

Isolates	No. of strains	Excellent	Good	Poor
<i>Serratia</i>	9		3	6
<i>Pseudomonas</i>	6		2	4
<i>Klebsiella</i>	3	1		2
<i>Proteus mirabilis</i>	2	1		1
<i>S. faecalis</i>	1	1		
Total	21	3	5	13

Table 5 Bacteriological response

Isolates	No. of strains	Eradicated	Persisted	No. of strains appeared after treatment
<i>Serratia</i>	9	6	3	
<i>Pseudomonas</i>	6	2	4	4
<i>Klebsiella</i>	3	3		
<i>Proteus mirabilis</i>	2	2		
<i>S. faecalis</i>	1	1		
<i>Enterobacter</i>				1
Total	21	14	7	5

分離菌の消長をみると (Table 5), *Serratia* 9 株中消失 6 株, 存続 3 株, *Pseudomonas* 6 株中消失 2 株, 存続 4 株, *Klebsiella* 3 株および *Proteus mirabilis* 2 株全て消失, *S. faecalis* 1 株は消失した。また原因菌の消失率は 21 株中 14 株, 66.7% であった。投与後出現細菌は *Pseudomonas* 4 株, *Enterobacter* 1 株の計 5 株であった。

4. 副作用

Cefuroxime 投与前後に血液像, BUN, Creatinine, S-GOT, S-GPT, Al-P を検討した (Table 6)。この検討には除外脱落症例 10 例も含めており, 症例 No. 19 から No. 28 がそれに該当する。血液像では著しい変化はなく, また BUN, Creatinine でも特に変化は認められなかった。肝機能検査では, 症例 No. 7 で投与前 GOT 47u., GPT 61u., Al-P 5.3B.L.u. と軽度上昇してお

り, 本剤投与後 GOT 60u., GPT 70u., Al-P 6.2B.L.u. と投与前より軽度高値を示した。これは本剤投与前すでに高値を示しており, また輸血を 3,600ml 行なっており, その影響とも考えられる。症例 No. 14 は全麻手術後 CEZ 27g 投与して, 術後 11 日目より Cefuroxime 1.5g/日を 3 日間投与した。投与前より既に GOT 96u., GPT 70u., Al-P 2.7B.L.u. と高値で, 投与後に GOT 48u., GPT 92u., Al-P 4.3B.L.u. と Al-P の軽度上昇を認めるも, 本剤の影響とは考えられない。なお投与終了後 17 日目では GOT 17u., GPT 28u., Al-P 2.2B.L.u. であった。症例 No. 19 では投与前 GOT 20u., GPT 27u. であるが, Cefuroxime 1.5g/日, 7 日間投与後に GOT 41u., GPT 65u. と軽度上昇を認めた。なお投与終了約 1 か月後の GOT 29u., GPT 73u. であった。症例 No. 20 は全麻手術後, 輸血 1,000ml, CET

Table 6 Laboratory findings before and after cefuroxime administration

No.	Hb (g/dl)		RBC ($\times 10^4$)		WBC		Platelet ($\times 10^4$)		BUN (mg/dl)		Creatinine (mg/dl)		S-GOP (u.)		S-GPT (u.)		Al-P (B.L.u.)	
	B*	A*	B	A	B	A	B	A	B	A	B	A	B	A	B	A	B	A
1	15.6	12.6	469	387	5,200	4,800			11	7	0.71	0.69	15	25	14	22	1.9	2.3
2	10.8	10.4	356	347	6,500	9,400	59.1	52.1	13	15	1.26	1.09	11	19	7	4	1.5	1.4
3	9.3	10.1	302	324	9,900	10,100	67.6	66.7	15	13	1.24	1.14	15	13	5	6	2.2	2.1
4	12.2	12.6	393	407	9,400	8,500	47.6	71.6	17	16	0.88	0.89	15	18	14	23	1.4	2.7
5	11.8	11.9	375	373	7,100	11,200	39.0	29.8	22	22	1.49	1.63	25	25	17	12	2.5	2.4
6	13.5	12.0	431	383	6,000	4,600	25.0	16.5	11	7	0.65	0.61	21	15	27	15	2.8	2.7
7	11.2	11.7	375	398	8,100	9,200	28.5	40.6	14	16	1.59	0.88	47	60	61	70	5.3	6.2
8	13.0	12.3	430	404	11,300	6,900			18	13	0.93	0.74	20	22	19	25	1.1	1.2
9	13.8	14.2	426	434	9,700	7,300	46.0		16	13	0.95	0.97	24	29	9	17	1.7	1.7
10	9.1	10.5	285	319	6,600	5,900	36.9	34.5	13	17	1.38	1.38	24	23	13	15	1.3	1.4
11	12.0	11.4	363	342	4,700	3,900	29.0	19.8	16	15	0.93	0.97	21	15	12	6	2.1	2.1
12	13.2	13.0	403	405	10,900	6,900		58.3	11	14	0.68	0.75	27	32	27	37	2.0	1.9
13	10.7	10.5	353	343	7,100	6,400	29.7	37.0	12	12	0.62		13	20	5	8	2.0	2.1
14	12.6	14.1	402	455	11,000	10,400	51.5	47.3	20	19	0.76	0.95	96	48	70	92	2.7	4.3
15	11.1	11.3	380	382	6,000	5,600	27.5	27.5	19	20	1.31	1.31	21	20	8	12	2.1	2.1
16	12.5	12.8	386	407	7,700	6,000	33.2	30.1	31	1	1.26	1.42	16	22	12	11	1.9	1.9
17	11.9	11.4	380	368	13,100	6,300		28.7	15			1.02	36	31	35	47	1.3	1.8
18	11.7	11.1	428	407	13,400	9,400	57.4	79.8	11			0.72	21	20	18	27	3.5	3.4
19	13.6	14.6	431	464	9,800	6,400	54.3	54.8	11	10	0.85	0.86	20	41	27	65	1.6	2.1
20	10.9	13.9	340	438	6,500	8,600			11	14	0.69	0.66	13	17	13	16	2.3	3.6
21	13.2	12.7	429	418	7,500	6,600			17	16	0.78	0.75	21	25	16	20	1.8	1.7
22	14.3	14.7	513	523	6,000	5,700	50.3	36.6	14	14	1.03	1.01	17	22	18	16	1.8	1.7
23	11.2	10.4	375	353	12,300	7,200	51.8	57.9	22	10	0.83	0.92	17	14	18	10	2.2	2.0
24	14.4	11.9	449	376	27,900	12,400	22.8	59.4	19	13	1.31	0.98	33	22	40	26	2.3	2.3
25	13.8	12.2	452	410	7,900	6,500	20.3	33.6	14	10	1.03		37	20	14	10	1.1	1.0
26	10.2	10.6	331	355	9,600	7,200	35.1	59.6	10		1.01	0.85	25	22	8	18	1.1	1.9
27	11.1	13.4	375	446	12,700	9,700	55.5	55.3	9	12			32	32	27	16	1.8	2.1
28	13.6	13.2	424	409	13,000	7,200	20.8	45.0	9	10	1.01	0.81	20	48	11	50	1.4	1.4

* B: Before, A: After

24g を投与され、術後6日目より Cefuroxime 3.0g/日を5日間投与された。本剤投与後に AI-P 3.6B. L. u. と軽度上昇したが、投与終了後20日目には AI-P 2.8B. L. u. と正常に復した。症例 No. 28 では投与前 GOT 20 u., GPT 11 u. で Cefuroxime 3g/日、5日間投与後 GOT 48 u., GPT 50 u. と軽度上昇を認めた。なお投与終了後9日目には GOT 24 u., GPT 28 u. であった。

全28名中、3名に筋注投与したが、1名に注射部疼痛の強い訴えがあり、静注に変更した。投与中に、発疹、発熱、ショックなどのアレルギー症状を認めたものはなかった。

IV. 考 査

Cefuroxime は英国の Glaxo 社研究所で開発された broad spectrum の新しい注射用 Cephalosporin C 系の抗生物質で、1) β -lactamase に対して安定性が高められていること、2) penicillinase 産生 *Staphylococcus* を含むグラム陽性球菌および *Enterobacter* や indol 陽性 *Proteus* 属を含むグラム陰性桿菌にも抗菌力を有すること、3) *Haemophilus influenzae* と *Neisseria gonorrhoeae* に対して強い抗菌力を示すことが特徴とされている¹⁾。

JONES ら²⁾は、 5×10^5 inoculum size で MIC を測定し、*S. aureus* の50%が0.82 μ g/ml、*E. coli* の50%が1.9 μ g/ml、*Proteus mirabilis* の50%が0.6 μ g/ml、*Klebsiella* の50%が1.9 μ g/ml、*Serratia marcescens* の50%が25 μ g/ml で発育阻止されたと報告している。われわれの 10^7 inoculum size の検討では、*S. aureus* の63.6%が3.1 μ g/ml、*E. coli* の65.4%が6.3 μ g/ml、*Proteus mirabilis* の53.1%が6.3 μ g/ml で発育阻止された。一方、*Klebsiella* では72.7%が、*Serratia* では全26株が100 μ g/ml 以上の耐性を示し、JONES らの成績に比べてやや悪い結果であった。CEZ との感受性相関をみると、*S. aureus* に対しては CEZ よりやや弱い抗菌力を示しているが、*E. coli* と *Klebsiella* ではほぼ同等、*Proteus mirabilis* では本剤の方が強い抗菌力を示した。

本剤は筋注および静注投与により高い血中濃度が得られ、代謝されず活性型のまま尿中に速やかに排泄され、また血清蛋白との結合率も、CET の15%、CER の67%、CEZ の85%に比べ33%と低い成績である¹⁾。FOORD³⁾は500mg 静注の場合、血中濃度は3分後に66.3 μ g/ml に達し、6時間後に0.9 μ g/ml に下降し、尿中回収率は24時間で95.1%であったと報告している。われわれの750mg 静注の成績では、15分後の血中濃度は56 μ g/ml で、以後急速に低下し、6時間後は trace であった。またその尿中回収率は6時間で98.5%

で、尿中濃度も高く最高4,500 μ g/ml であり、尿路感染症に対して有力な薬剤と思われた。

臨床評価を行ない得た複雑性尿路感染症18例中、著効2例、有効4例、無効12例であった。このうちカテーテル留置7例は全例無効であるが、非カテーテル留置11例中緑膿菌症例4例を除いた7例では、著効2例、有効2例、無効3例であった。今回の臨床的検討では、カテーテル留置例が7症例あり、また投与前分離菌に *Pseudomonas* が6症例に検出されているため、無効例が多かったものと思われる。

本剤による自覚的副作用は、筋注時の痛みを1例に認めたのみである。本邦での全国集計⁴⁾では、635例中60例(9.4%)に副作用が認められており、筋注時の痛みは44例(6.9%)であった。臨床検査上の異常は、GOT および GPT の軽度上昇例各1例、AI-P の軽度上昇1例を認めたのみである。全国集計では、肝胆系への影響は8例(1.3%)と報告されている。

V. 結 語

新しい Cephalosporin 系抗生物質 Cefuroxime について、基礎的・臨床的検討を加えた結果、次のような結論を得た。

1. 臨床分離菌125株に対して Cefuroxime の MIC を測定した。本剤は *S. aureus*、*E. coli*、*Proteus mirabilis* に対してすぐれた抗菌力を示したが、*Serratia*、*Pseudomonas* に対して抗菌力を示さなかった。CEZ との比較では、*Proteus mirabilis* に対して良好な抗菌力を示したが、*E. coli*、*Klebsiella* ではほぼ同等の成績であった。

2. 健康成人1名に Cefuroxime 750mg を静注し血中濃度を測定した。静注15分後に56 μ g/ml に達し、以後急速に低下した。同時に測定した尿中回収率は6時間までで98.5%であった。

3. 複雑性尿路感染症18例に Cefuroxime を投与した。18例中著効2例、有効4例、無効12例であった。細菌の消失率は21株中14株、66.7%であった。

4. 副作用としては筋注部の疼痛1例、臨床検査で投与後に GOT と GPT の軽度上昇を2例、AI-P の軽度上昇を1例に認めた。

文 献

- 1) O'CALLAGHAN, C. H. ; R. B. SYKES, D. M. RYAN, R. D. FOORD & P. W. MUGGLETON : Cefuroxime—a new cephalosporin antibiotic. J. Antibiot. 29 : 29~37, 1976
- 2) JONES, R. N. ; P. C. FUCHS, T. L. GAVAN, E. H. GERLACH, A. L. BARRY & C. THORNSBERRY : Cefuroxime, a new parenteral cephalosporin: collaborative *in vitro* susceptibility comparison with cephalothin against 5,887 clinical

- bacterial isolates. Antimicrob. Agents Chemother. 12 : 47~50, 1977
- 3) FOORD, R. D. : Cefuroxime : human pharmacokinetics. Antimicrob. Agents Chemother. 9 :

741~747, 1976

- 4) 第 26 回日本化学療法学会総会 新薬シンポジウム III, Cefuroxime, 東京, 1978

FUNDAMENTAL AND CLINICAL STUDIES ON CEFUROXIME IN URINARY TRACT INFECTIONS

HIDEO KAMATA, HITOSHI TAKAMOTO, MANABU HIRANO,
KATSUYOSHI KONDO, TOHRU ARAKI
and HIROYUKI OHMORI

Department of Urology, Okayama University, Medical School
(Director : Prof. H. OHMORI)

YOSUKE MATSUMURA

Department of Urology, Kohchi Prefectural Center Hospital, Kohchi
(Chief : Dr. Y. MATSUMURA)

A new parenteral cephalosporin, cefuroxime, was studied both fundamentally and clinically in the urological field, and the following conclusions were obtained :

1. Minimum inhibitory concentrations of cefuroxime were measured against 125 strains isolated from urinary tract infections. Cefuroxime exhibited excellent activity against *S. aureus*, *E. coli* and *Proteus mirabilis*, but no activity against *Serratia* and *Pseudomonas*. When compared with CEZ, cefuroxime showed superior antimicrobial activity against *Proteus mirabilis*, and equal activity against *E. coli* and *Klebsiella*.

2. Single intravenous dose of 750mg was administered to a female volunteer. The blood level of 56 $\mu\text{g/ml}$ was assayed at 15 minutes, and then decreased rapidly. The urinary recovery rate within 6 hours was 98.5%.

3. Cefuroxime was administered to eighteen patients with complicated urinary tract infections, and the following response was obtained : excellent in two, good in four and poor in twelve cases.

Fourteen of 21 organisms isolated before administration of cefuroxime were eradicated after treatment.

4. Side effects were observed in four cases of this series, pain at the site of intramuscular injection in one case, mild elevation of both S-GOT and S-GPT in two cases and mild elevation of Al-P in one case.