

DL-8280 の臨床経験

齊藤 豊一

虎の門病院泌尿器科

新しく開発された benzoxazine 格を有する 新合成経口抗菌剤 DL-8280 を泌尿器科領域の各種感染症に使用して以下の結果を得た。

1) 急性単純性尿路感染症 38 例(膀胱炎 36 例, 腎盂腎炎 2 例)に対し本剤を使用した。急性単純性膀胱炎について UTI 薬効評価基準合致症例 29 例中, 著効 18 例, 有効 11 例で有効率は 100% であった。急性単純性腎盂腎炎 2 例も, 全例有効で有効率 100% であった。

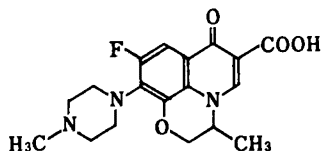
2) 複雑性尿路感染症 23 例中 UTI 薬効評価基準合致症例は 11 例であり, 著効 9 例, 有効 2 例で有効率 100% であった。

3) 淋菌性尿道炎 2 例, 非淋菌性尿道炎 12 例, 前立腺炎 1 例, 副睾丸炎 1 例に対する臨床効果は, 淋菌性尿道炎, 前立腺炎, 副睾丸炎がいずれも 100% であり, 非淋菌性尿道炎が 92% であった。

4) 副作用はいずれも軽度の嘔吐, 悪心, 食欲低下を各 1 例ずつ認めた以外はなく, 臨床検査値の異常も認めなかった。

DL-8280 は 1980 年に第一製薬(株)研究所において開発されたオキサジン系の合成経口抗菌剤であり, その構造式は Fig. 1 に示したとおりである。本剤は嫌気性菌を含むグラム陽性菌, グラム陰性菌に対して幅広い抗菌スペクトラムと強い抗菌力を有し, その作用は殺菌的であり, 特にグラム陽性菌には既存の同系統薬剤より抗菌力の優れている点が特長である。また, 一般薬理, 一般毒性などの前臨床試験および第一相臨床試験の結果から, 本剤の安全性の高いことが示唆された¹⁾。今回泌尿器科領域の感染症に対する本剤の臨床的評価を行う機会を得たので, その成績を報告する。

Fig. 1 Chemical structure of DL-8280



I. 対象と方法

当科を訪れた泌尿器科領域の各種感染症を有する患者を対象として本剤の投与を行った。

症例は急性単純性膀胱炎 36 例, 急性単純性腎盂腎炎 2 例, 複雑性尿路感染症 23 例, 淋菌性尿道炎 2 例, 非淋菌性尿道炎 12 例, 前立腺炎 1 例および副睾丸炎 1 例の合計 77 例であった。対象の年齢は 21~91 歳に分布し, 性別では男性 35 例, 女性 42 例であった。

本剤の投与量および投与期間は, 1 回 100~200 mg を 1 日 2~3 回投与し, 投与期間は 3~14 日間であった。

主治医による臨床効果の判定は 著効, 有効, やや有効, 無効の 4 段階で行い, 特に急性単純性膀胱炎, 複雑性尿路感染症のうち UTI 薬効評価基準²⁾に合致する症例については同基準による判定も実施した。

また, 尿から分離された菌に対する本剤の MIC の測定は日本化学療法学会標準法³⁾に準じて行った。

II. 臨床成績

1. 急性単純性膀胱炎

急性単純性膀胱炎 36 例の臨床成績を Table 1 に示した。うち UTI 薬効評価基準合致症例 29 例の総合臨床効果は Table 2 に示す通りである。有効率は 100% であり, 症状は消失 27 例 (94%), 膿尿は正常化 18 例 (62%), 改善 10 例 (35%), 不変 1 例 (3%), 細菌尿は 29 例全例陰性化した。起炎菌は Table 3 に示すように *E. coli* が 25 株と大半を占めているが, その他 *Staphylococcus* 1 株, *S. faecalis* 1 株, *Citrobacter* 1 株, *P. mirabilis* 2 株が認められた。起炎菌は全株消失し投与後出現菌は認めなかった。MIC は測定し得た全株が 1.56 $\mu\text{g/ml}$ 以下であった (Table 4)。

2. 急性単純性腎盂腎炎

急性単純性腎盂腎炎 2 例の臨床成績を Table 5 に示した。1 例は 300 mg (100 mg $\times$ 3), 7 日間投与にて, 症状, 膿尿, 起炎菌全てが消失し有効であり, 他の 1 例は 300 mg (100 mg $\times$ 3), 7 日間投与にて, 症状消失, 膿尿改善, 起炎菌消失となり, 有効であった。

Table 1 Clinical summary of acute simple cystitis patients treated with DL-8280

Case No.	Age	Sex	Diagnosis	Treatment		Symptoms*	Pyuria*	Bacteriuria*			Evaluation		Side effect
				Dose (mg×/day)	Duration (day)			Species	Count	MIC [10/ml]	UTI	Dr	
1	50	F	A.S.C.	100×2	3	++ —	++ —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—
2	33	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	## ±	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Moderate	Good	—
3	48	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	+ —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—
4	21	F	A.S.C.	100×2	3	## —	++ —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—
5	53	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	++ —	<i>P.mirabilis</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—
6	62	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	## —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—
7	34	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	++ ±	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Moderate	Good	—
8	23	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	## —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—
9	24	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	++ —	<i>S.faecalis</i> <i>E.coli</i>	10 ⁵ 10 ⁵ /	1.56 0.05 /	Excellent	Good	Vomiting
10	30	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	++ ±	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Moderate	Good	—
11	50	F	A.S.C.	100×2	3	+ —	++ —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—
12	22	F	A.S.C.	100×2	3	++ —	++ ±	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Moderate	Good	Nausea

Table 1 (Continued)

Case No.	Age	Sex	Diagnosis	Treatment		Symptoms*	Pyuria*	Bacteriuria*				Evaluation		Side effect
				Dose (mg X / day)	Duration (day)			Species	Count	MIC [10 ⁵ /ml]	UTI	Dr		
13	31	F	A.S.C.	100 X 2	3	+ —	++ ±	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.20 /	Moderate	Good	—	
14	33	F	A.S.C.	100 X 3	3	++ —	++ +	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Moderate	Good	—	
15	28	F	A.S.C.	100 X 3	3	++ —	## —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—	
16	23	F	A.S.C.	100 X 2	3	++ —	++ ±	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Moderate	Good	—	
17	45	F	A.S.C.	100 X 2	3	++ +	## ±	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Moderate	Good	—	
18	27	F	A.S.C.	100 X 2	3	++ —	## —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—	
19	46	F	A.S.C.	100 X 2	3	++ —	+ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—	
20	25	F	A.S.C.	100 X 2	3	+ —	++ +	<i>Staphylococcus</i> —	10 ⁵ /	0.78 /	Moderate	Good	—	
21	24	F	A.S.C.	100 X 2	3	+ —	## —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—	
22	56	F	A.S.C.	100 X 2	3	+ +	++ —	<i>P. mirabilis</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Moderate	Good	—	
23	30	F	A.S.C.	100 X 2	3	+ —	+ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—	
24	53	F	A.S.C.	100 X 2	3	+ —	++ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁶ /	0.10 /	Excellent	Good	—	

Table 1 (Continued)

Case No.	Age	Sex	Diagnosis	Treatment		Symptoms*	Pyuria*	Bacteriuria*			Evaluation		Side effect
				Dose (mg × / day)	Duration (day)			Species	Count	MIC [10 ⁶ /ml]	UTI	Dr	
25	23	F	A.S.C.	100 × 2	3	+ —	## —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—
26	49	F	A.S.C.	100 × 2	3	+ —	## —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—
27	24	F	A.S.C.	100 × 2	3	+ —	## ±	<i>Citrobacter</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Moderate	Good	—
28	36	F	A.S.C.	100 × 2	3	+ —	+ —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—
29	55	F	A.S.C.	100 × 2	3	+ —	## —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	Anorexia
30	73	F	A.S.C.	100 × 3	3	+ —	## —	<i>Staphylococcus</i> —	10 ⁵ /	0.39 /	—	Good	—
31	73	F	A.S.C.	100 × 3	3	+ —	## +	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	—	Good	—
32	53	M	A.S.C.	100 × 3	3	+ —	## —	<i>Streptococcus</i> —	10 ⁵ /	— /	—	Good	—
33	20	F	A.S.C.	100 × 2	5	+ —	## —	<i>E.coli</i> GPR	10 ⁵ 10 ⁵	0.05 /	—	Good	—
34	53	F	A.S.C.	100 × 3	7	+ —	+ —	<i>E.coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	—	Good	—
35	20	M	A.S.C.	100 × 3	7	+ —	+ ±	<i>S.faecalis</i> —	10 ⁵ /	1.56 /	—	Good	—
36	20	M	A.S.C.	100 × 3	7	## —	## —	<i>P.mirabilis</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	—	Good	—

• Before treatment
• After treatment

Table 2 Overall clinical efficacy of DL-8280 in acute simple cystitis

Symptom		Resolved			Improved			Persisted			Effect on bacteriuria
Pyuria		Cleared	Decreased	Unchanged	Cleared	Decreased	Unchanged	Cleared	Decreased	Unchanged	
Bacteriuria	Eliminated	18	9			1		1			29 (100%)
	Decreased (Replaced)										
	Unchanged										
Effect on pain on micturition		27 (94%)			1 (3%)			1 (3%).			Patient total 29
Effect on pyuria		18 (62%)			10 (35%)			1 (3%)			
	Excellent	18 (62%)						Overall effectiveness rate 29/29 (100%)			
	Moderate	11 (38%)									
	Poor (including Failure)										

Table 3 Bacteriological response to DL-8280 in acute simple cystitis

Isolates	No. of strains	Eradicated	Persisted*
<i>Staphylococcus</i>	1	1 (100%)	
<i>S. faecalis</i>	1	1 (100%)	
<i>E. coli</i>	25	25 (100%)	
<i>Citrobacter</i>	1	1 (100%)	
<i>P. mirabilis</i>	2	2 (100%)	
Total	30	30 (100%)	

* Regardless of bacterial count

3. 複雑性尿路感染症

複雑性尿路感染症 23 例の臨床成績を示したものが Table 6 である。4 例が複雑性腎盂腎炎、残り 19 例が膀胱炎であった。基礎疾患としては前立腺肥大症、膀胱腫瘍、結石、膀胱憩室尿道狭窄等が主なものであった。

うち UTI 薬効評価基準合致症例 11 例の総合臨床効果をまとめたものが Table 7 である。膿尿に関しては正常化 9 例 (82%)、改善 2 例 (18%)、細菌尿に関しては陰性化 11 例 (100%) であり、著効 9 例 (82%)、有効 2 例 (18%) で有効率 100% となった。UTI 薬効評価基準の群別に従って分類し、総合臨床効果をまとめたものが Table 8 である。すべて単独感染であり、その内訳

は上部尿路感染症 (第 3 群) 3 例、下部尿路感染症 (第 4 群) 8 例であった。第 3 群は 3 例すべて著効であり、第 4 群では著効 6 例、有効 2 例であった。

菌種別に細菌学的効果を検討すると、Table 9 に示すように *S. faecalis* 1 株、*E. coli* 9 株、*E. cloacae* 1 株が起炎菌であり、分離された 11 株すべてが消失した。MIC は測定し得た全株が 0.78 $\mu\text{g/ml}$ 以下であった (Table 10)。

4. 尿性器感染症

明確に感染機会があり、それ以後に典型的な黄色粘稠の排膿をみ、その検鏡所見で膿球の内外にグラム陰性双球菌多数を証明できたものを淋菌性尿道炎と診断した。

Table 4 Relation between MIC and bacteriological response in DL-8280 treatment (A.S.C.)

Isolates	MIC ($\mu\text{g/ml}$) [$10^6/\text{ml}$]							Total
	≤ 0.05	0.10	0.20	0.39	0.78	1.56	$3.13 \leq$	
<i>Staphylococcus</i>					1 / 1			1 / 1
<i>S. faecalis</i>						1 / 1		1 / 1
<i>E. coli</i>	10/10	14/14	1 / 1					25/25
<i>Citrobacter</i>		1 / 1						1 / 1
<i>P. mirabilis</i>		2 / 2						2 / 2
Total	10/10 (100%)	17/17 (100%)	1 / 1 (100%)		1 / 1 (100%)	1 / 1 (100%)		30/30 (100%)

No. of strains eradicated/No. of strains isolated

Table 5 Clinical summary of acute simple pyelonephritis patients treated with DL-8280

Case No.	Age	Sex	Diagnosis	Treatment		Symptoms*	Pyuria*	Bacteriuria*			Evaluation [Dr]	Side effect
				Dose (mg $\times$ /day)	Duration (day)			Species	Count	MIC [$10^6/\text{ml}$]		
37	59	M	A.S.P.	100 $\times$ 3	7	+	++	<i>E. coli</i>	10^5	0.10	Good	—
						—	—	—	/	/		
38	29	F	A.S.P.	100 $\times$ 3	7	++	+	<i>E. coli</i>	10^5	0.10	Good	—
						—	±	—	/	/		

* Before treatment
After treatment

また、定型的な淋菌性尿道炎以外の尿道炎を非淋菌性尿道炎とした。症例は Table 11 に一括した。淋菌性尿道炎は2例とも膿培養で *N. gonorrhoeae* が証明されたが、いずれも有効であった。非淋菌性尿道炎は12例中有効11例、無効1例で有効率92%であった。無効例は1日量400mgを分2とし、14日間投与したが、膿尿は不変であり、一時消失していた排尿痛も14日後に再発している。前立腺炎、副睾丸炎各1例はいずれも有効であった。

5. 副作用

副作用は77例について検討した。自覚的副作用としては、嘔吐 (No. 9, A.S.C.), 悪心 (No. 12, A.S.C.), 食欲低下 (No. 29, A.S.C.) 各1例を認めたが、いずれも軽度であったため、無処置で投与継続した。しかし、この系統の薬剤に懸念される中枢神経系症状は1例も認められなかった。また臨床検査値の異常を認めた例はなか

った。

III. 考 按

急性単純性尿路感染症に対する本剤の投与方法は1日200mg分2の症例が28例、1日300mg分3の症例が10例である。いずれも主治医判定で100%の有効率であったことから考えて、本症には1日200mgの投与で十分であると思われる。投与期間は膀胱炎の場合には3日間投与が32例あり、他に5日、7日の例もあるが、3日で十分であると思われる。腎盂腎炎の場合は2例しかないので結論めいたことは述べられない。

複雑性尿路感染症にもUTI薬効評価基準合致症例では100%、非合致症例を入れても主治医判定で23例中22例に有効という結果を得た。カテーテル留置症例はなく、全身状態の良好な症例を対象としたためとも思われるが、予想外に良い成績であった。投与方法は300mg分3が20例、600mg分3が1例、200mg分2が2

Table 6 Clinical summary of complicated UTI patients treated with DL-8280

Case No.	Age	Sex	Diagnosis Underlying condition	UTI group	Treatment		Pyuria*	Bacteriuria*			Evaluation		Side effect
					Dose (mg × /day)	Duration (day)		Species	Count	MIC [10 ⁶ /ml]	UTI	Dr	
39	58	F	C.C.P. Renal stone	G-3	100×3	5	## —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—
40	66	F	C.C.P. Pyelolithotomy	G-3	100×3	5	+ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	≤0.025 /	Excellent	Good	—
41	66	F	C.C.P. Contracted kidney	G-3	100×3	5	+ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	≤0.025 /	Excellent	Good	—
42	70	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100×3	5	## —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—
43	71	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100×3	5	+ ±	<i>S. faecalis</i> —	10 ⁵ /	0.78 /	Moderate	Good	—
44	62	M	C.C.C. Urethral stricture	G-4	100×3	5	## ±	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Moderate	Good	—
45	33	F	C.C.P. Wandering kidney	G-4	100 × 3	5	## —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—
46	70	F	C.C.C. Urethral caruncles	G-4	100×3	5	## —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	Excellent	Good	—
47	50	F	C.C.C. Cystocele	G-4	100×3	5	+ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	≤0.025 /	Excellent	Good	—
48	82	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100×3	5	+ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	≤0.025 /	Excellent	Good	—
49	70	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	200×3	5	## —	<i>E. cloacae</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	Excellent	Good	—
50	25	F	Pyelonephritis Hydronephrosis	G-3	100×3	7	## —	<i>S. faecalis</i> —	10 ⁵ /	3.13 /	—	Good	—

Table 6 (Continued)

Case No.	Age	Sex	Diagnosis Underlying condition	UTI group	Treatment		Pyuria*	Bacteriuria*			Evaluation		Side effect
					Dose (mg × /day)	Duration (day)		Species	Count	MIC [10 ⁶ /ml]	UTI	Dr	
51	79	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100 × 3	7	++ —	<i>Enterococcus</i> —	10 ⁵ /	3.13 /	—	Good	—
52	69	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100 × 3	7	++ ±	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	— /	—	Good	—
53	60	M	C.C.C. Tumor of the bladder	G-4	100 × 3	14	++ ±	<i>S. faecalis</i> —	10 ⁵ /	0.78 /	—	Good	—
54	28	F	Pyelocystitis Wandering kidney	G-4	100 × 2	7	++ +	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	— /	—	Good	—
55	66	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100 × 3	7	++ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.05 /	—	Good	—
56	52	M	C.C.C. Epididymitis	G-4	100 × 3	7	++ ++	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	0.10 /	—	Good	—
57	69	M	C.C.C. Urethral stricture	G-4	100 × 3	7	++ ±	<i>Staphylococcus</i> —	10 ⁵ /	0.20 /	—	Good	—
58	67	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100 × 2	7	+ —	<i>γ-Streptococcus</i> —	10 ⁵ /	— /	—	Good	—
59	59	M	C.C.C. Neurogenic bladder	G-4	100 × 3	7	++ —	<i>E. coli</i> —	10 ⁵ /	— /	—	Good	—
60	72	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100 × 3	14	++ ++	GPR —	10 ⁵ /	— /	—	Good	—
61	91	M	C.C.C. B.P.H.	G-4	100 × 3	5	++ +	<i>P. mirabilis</i> <i>P. mirabilis</i>	10 ⁵ 10 ⁵	— /	—	Poor	—

* Before treatment
After treatment

Table 7 Overall clinical efficacy of DL-8280 in complicated UTI

Pyuria Bacteriuria	Cleared	Decreased	Unchanged	Effect on bacteriuria
Eliminated	9	2		11 (100%)
Decreased				
Replaced				
Unchanged				
Effect on pyuria	9 (82%)	2 (18%)		Patient total 11
Excellent	9 (82%)		Overall effectiveness rate 11/11 (100%)	
Moderate	2 (18%)			
Poor(including Failure)				

Table 8 Overall clinical efficacy of DL-8280 classified by the type of infection

Group		No. of (Shared patients (rate)	Excellent	Moderate	Poor	Overall effectiveness rate
Monomicrobial infection	1st group (Catheter indwelt)					
	2nd group (Post prostatectomy)					
	3rd group (Upper UTI)	3 (27%)	3			100%
	4th group (Lower UTI)	8 (73%)	6	2		100%
	Sub total	11 (100%)	9	2		100%
Polymicrobial infection	5th group (Catheter indwelt)					
	6th group (Catheter not indwelt)					
	Sub total					
Total		11 (100%)	9	2		100%

Table 9 Bacteriological response to DL-8280 in complicated UTI

Isolates	No. of strains	Eradicated	Persisted*
<i>S.faecalis</i>	1	1 (100%)	
<i>E.coli</i>	9	9 (100%)	
<i>E.cloacae</i>	1	1 (100%)	
Total	11	11 (100%)	

• Regardless of bacterial count

Table 10 Relation between MIC and bacteriological response in DL-8280 treatment (complicated UTI)

Isolates	MIC ($\mu\text{g/ml}$) [$10^6/\text{ml}$]						Total
	≤ 0.05	0.10	0.20	0.39	0.78	$1.56 \leq$	
<i>S. faecalis</i>					1 / 1		1 / 1
<i>E. coli</i>	7 / 7	2 / 2					9 / 9
<i>E. cloacae</i>		1 / 1					1 / 1
Total	7 / 7 (100%)	3 / 3 (100%)			1 / 1 (100%)		11/11 (100%)

No. of strains eradicated/No. of strains isolated.

Table 11 Clinical summary of uro-genital infection patients treated with DL-8280

Case No.	Age	Sex	Diagnosis	Treatment		Pyuria*	Isolated organism*	Evaluation [Dr]	Side effect
				Dose (mg $\times$ /day)	Duration (day)				
62	24	M	Gonococcal urethritis	200 $\times$ 2	1	##	<i>N. gonorrhoeae</i>	Good	—
				200 $\times$ 1	5	$\pm$	—		
63	26	M	Gonococcal urethritis	200 $\times$ 2	7	## +	<i>N. gonorrhoeae</i> —	Good	—
64	34	M	Non-gonococcal urethritis	100 $\times$ 3	7	## $\pm$	— —	Good	—
65	34	M	Non-gonococcal urethritis	100 $\times$ 3	7	+ $\pm$	<i>Micrococcus</i> —	Good	—
66	40	M	Non-gonococcal urethritis	100 $\times$ 3	7	## —	— —	Good	—
67	50	M	Non-gonococcal urethritis	100 $\times$ 3	7	+ +	— —	Good	—
68	46	M	Non-gonococcal urethritis	100 $\times$ 3	7	+ —	— —	Good	—
69	30	M	Non-gonococcal urethritis	100 $\times$ 3	7	## $\pm$	— —	Good	—
70	37	M	Non-gonococcal urethritis	100 $\times$ 3	7	+ —	— —	Good	—
71	34	M	Non-gonococcal urethritis	100 $\times$ 3	7	## —	<i>α-Streptococcus</i> —	Good	—
72	31	M	Non-gonococcal urethritis	200 $\times$ 2	7	+ —	— —	Good	—
73	25	M	Non-gonococcal urethritis	200 $\times$ 2	7	+ —	— —	Good	—
74	27	M	Non-gonococcal urethritis	200 $\times$ 2	14	+ $\pm$	— —	Good	—
75	24	M	Non-gonococcal urethritis	200 $\times$ 2	14	## ##	— —	Poor	—
76	34	M	Prostatitis	100 $\times$ 3	14	+ —	— —	Good	—
77	61	M	Epididymitis	100 $\times$ 3	14	— —	— —	Good	—

* Before treatment
After treatment

例というようにまちまちで、投与期間も5日から14日まで幅があったが、傾向からみて1日量300mg 5日間で十分であると思われる。

淋菌性尿道炎に対しては、第1回200mgの投与後数時間で排膿量の減少と排膿の漿液化が見られ、1日400mg投与後の翌日には排膿はほとんど停止している。非淋菌性尿道炎に対しては、効果は速効性でなく、排膿の減少、症状の寛解には数日を要するようである。尿道炎に対する本剤の治療に関しては症例を増して、後日に改めて論じたいと思っている。

起炎菌と本剤のMICとの関係はすでに諸家の発表された結果と同様で、測定し得た41菌株について、1.56 $\mu\text{g/ml}$ のものが1株、0.78 $\mu\text{g/ml}$ のものが2株、その

他は全株0.20 $\mu\text{g/ml}$ 以下で、強い抗菌力を示している。耐性と考えられる菌株はなかった。

むすび

尿路感染症に対して、単純性、複雑性ともに100%の有効性を示し、尿道炎に対しても92%の有効性を示したことから、副作用も少なかったことより、DL-8280はすぐれた抗菌剤といえることができる。

文 献

- 1) 第30回日本化学療法学会 西日本支部総会、新薬シンポジウム、DL-8280, 1982
- 2) UTI 研究会: UTI (尿路感染症) 薬効評価基準, *Chemotherapy* 28: 321~341, 1980
- 3) MIC 測定法改訂委員会: 最小発育阻止濃度 (MIC) 測定法再改訂について, *Chemotherapy* 29: 76~79, 1981

CLINICAL EXPERIENCE OF DL-8280

TOYOKAZU SAITO

Department of Urology, Toranomon Hospital

DL-8280 was administered at a daily dose of 200 to 600 mg for 3 to 14 days to a total number of 77 patients.

They consist of 38 with acute simple urinary tract infections, 23 with complicated urinary tract infections, 2 with gonococcal urethritis, 12 with non-gonococcal urethritis, one with prostatitis and one with epididymitis.

(1) The efficacy rate of the drug was 100% for acute simple urinary tract infections, complicated urinary tract infections and gonococcal urethritis, and 92% for non-gonococcal urethritis.

(2) None of the 41 strains of bacteria isolated were resistant to the drug. The MIC of the drug against them was 1.56 $\mu\text{g/ml}$ or lower, providing evidence for the excellent antibacterial effect of DL-8280.

(3) The incidence of side effects was 3.9%. Vomiting, nausea and anorexia were seen in each case, but these symptoms were not significant.