

## 泌尿器科領域各種感染症に対する DL-8280 の使用経験

百瀬俊郎・吉峰一博

九州大学医学部泌尿器科学教室

熊澤浄一・中牟田誠一

佐賀医科大学泌尿器科学教室

石澤靖之・長田幸夫

宮崎医科大学泌尿器科学教室

坂本公孝・宮崎良春

福岡大学医学部泌尿器科学教室

平田耕造・森田一喜朗

国立福岡中央病院泌尿器科

江本侃一・相戸賢二

浜の町病院泌尿器科

原 三信

医療法人三信会原病院泌尿器科

中山 宏

中山泌尿器科

尾本徹男

九州厚生年金病院泌尿器科

安東 定

北九州市立小倉病院泌尿器科

佐藤伸一

済生会八幡病院泌尿器科

永芳弘之

新日鉄八幡病院泌尿器科

天野拓哉

北九州市立若松病院泌尿器科

平野 遙・松本哲朗

国立別府病院泌尿器科

養田国広

宮崎県立宮崎病院泌尿器科

平田 弘

広島赤十字病院泌尿器科

岩坪暎二

総合脊損センター泌尿器科

武居哲郎

国立中津病院泌尿器科

永山在明・飯田恭子

佐賀医科大学微生物教室

新合成オキサジン系抗菌剤 DL-8280 を、九州大学泌尿器科とその関連病院 18 施設において、慢性複雑性尿路感染症 96 例、急性単純性膀胱炎 17 例、急性単純性腎盂腎炎 4 例、前立腺炎 3 例、前立腺炎と副辜丸炎の合併症例 2 例、淋菌性尿道炎 9 例、非淋菌性尿道炎 2 例に使用した。

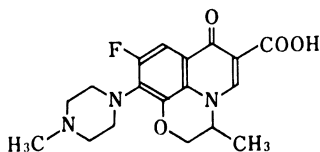
脱落および除外症例を除いた総合有効率は、慢性複雑性尿路感染症 76%、急性単純性膀胱炎 100% であった。また急性単純性腎盂腎炎は著効 3 例、有効 1 例、前立腺炎および副辜丸炎は全例著効、尿道炎では淋菌性において 9 例中 8 例著効、1 例有効、非淋菌性では 2 例著効であった。細菌学的効果は 156 株中 132 株、85% が消失した。

副作用は口渴および胃部不快感が 1 例に認められ、GOT, GPT の上昇が 4 例に、赤血球数、ヘモグロビン、ヘマトクリット値の減少が 2 例に認められたが本剤投与終了後、短期間で改善した。

以上の成績より、泌尿器科領域感染症に対して DL-8280 は有用性の高い薬剤と考えられた。

DL-8280 は第一製薬研究所において新規に合成されたオキサジン系の合成抗菌剤で、化学構造式は Fig. 1 に示すとおりである。本剤と近縁の抗菌剤には、既に市販されているナリジクス酸、ピロミド酸、ビベミド酸、シノキサシン、また現在開発中のミロキサシン、ノフロキサシンなどがある。現在までの基礎的研究の結果、本剤はグラム陰性のみならず陽性の好気性菌に対して強い殺菌力を有しており、また嫌気性菌に対しても優れた抗菌力を示すことが判明している<sup>1)</sup>。吸収、排泄については、経口投与後速やかに血中および組織内に移行し、大部分が未変化体のまま尿中に高濃度に排泄されることが示されている<sup>2)</sup>。安全性に関しても高い安全性が認められている<sup>3)</sup>。以上のような基礎的成績を踏まえ、我々は、九州大学医学部泌尿器科および関連施設において泌尿器科領域各種感染症患者に本剤を投与する機会を得たのでその臨床成績を報告する。

Fig. 1 Chemical Structure of DL-8280



### I. 投与対象・投与方法

1982年3月より8月までに九州大学泌尿器科およびその関連病院18施設の外来・入院患者のうち泌尿器科領域各種感染症を有する133例にDL-8280を投与した。年齢は17歳から86歳であり、男性88例、女性45例であった。投与方法は1日150mgを毎食後50mgずつ3回分服させたもの8例、1日200mgを毎食後と就寝前に50mgずつ4回分服させたもの2例、1日300mgを毎食後100mgずつ3回分服させたもの66例、1日

400mgを毎食後と就寝前に100mgずつ4回分服させたもの22例、朝・夕食後200mgずつ2回分服させたもの11例、1日600mgを毎食後200mgずつ3回分服させたもの27例であった。なお8症例に関しては投与途中で投与方法の変更が認められた。投与日数は最短3日間から最長35日間であったが、5日間投与例が49例、7日間投与例が40例と大部分をしめた。

### II. 観察項目・臨床効果判定・副作用の検討

原則として開始日と投与終了翌日に臨床症状の観察と検査を行った。自覚症状として頻尿・排尿痛・発熱の有無・程度を、尿所見として白血球数・尿中細菌の菌種同定と菌数測定を行った。なお尿道炎に関しては尿道分泌物の検査を行った。分離菌のMICは接種菌量 $10^6$  cells/ml について、日本化学療法学会標準法に準じて佐賀医科大学微生物学教室で測定した。

臨床効果判定は、UTI薬効評価基準(第二版)<sup>4)</sup>およびその補遺<sup>5)</sup>に準じて、尿中白血球数、細菌によって判定し、著効・有効・無効とした。別に主治医による効果判定を行った。副作用については、アレルギー反応などの自覚的臨床症状と臨床検査値(末梢血、肝機能、腎機能)に及ぼす影響を検討した。

### III. 成績

投与133例の詳細はTable 1-(1)~Table 1-(5)に示すとおりであり、慢性複雑性尿路感染症96例、急性単純性膀胱炎17例、急性単純性腎盂腎炎4例、前立腺炎3例、前立腺炎と副辜丸炎の合併症例2例、淋菌性および非淋菌性尿道炎各々9例、2例であった。U.T.I.薬効評価基準で臨床効果の判定ができた症例は慢性複雑性尿路感染症では38例、急性単純性膀胱炎では6例で、除

Table 1-(1) Clinical summary of complicated U.T.I. cases treated with DL-8280

Case No.	Age	Sex	Diagnosis	Underlying disease	U.T.I. group	Treatment		Pyuria	Isolated organism				Evaluation		Side effects	
						Dose (mg×/day)	Duration (days)		Before	After	U.T.I.	Dr.				
								Before → After	Species	Count	MIC* (μg/ml)	Species	Count	MIC* (μg/ml)		
1	76	M	C.C.C.	N.B. B.P.H.	G-1	100×3	5	± → ±	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>6</sup>	3.13	Fungi	10 <sup>4</sup>		Moderate	Poor
2	85	M	C.C.C.	B.P.H.	G-1	100×3	5	± → +	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>6</sup>	1.56	Fungi	10 <sup>4</sup>		Moderate	Poor
3	75	M	C.C.C.	Post ope. of B.P.H.	G-1	200×3	5	± → -	<i>E. cloacae</i>	10 <sup>6</sup>		<i>E. cloacae</i>	10 <sup>4</sup> ↓		Moderate	Excellent
4	60	M	C.C.C.	Post ope. of B.P.H.	G-1	100×3	6	± → ±	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>5</sup>	3.13	—	0		/	Moderate
5	33	M	C.C.P.	Hydronephrosis	G-1	100×3	6	± → ±	<i>P. putida</i>	10 <sup>8</sup>		<i>P. putida</i>	10 <sup>6</sup>		/	Poor
6	77	M	C.C.C.	N.B. B.P.H.	G-1	50×3	21	+ → +	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>7</sup>	12.5	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>6</sup>	100	/	Fair
7	76	M	C.C.C.	Post ope. of B.P.H.	G-2	100×3	5	± → ±	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.39	—	0		Moderate	Moderate
8	86	M	C.C.C.	Post ope. of prostatic cancer	G-2	200×2	7	+ → ±	<i>C. freundii</i>	10 <sup>6</sup>	0.10	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>4</sup>	12.5	/	Fair
9	76	M	C.C.C.	Post ope. of B.P.H.	G-2	100×3	14	± → ±	<i>S. epidermidis</i>	10 <sup>4</sup>	0.78	—	0		/	Excellent
10	75	M	C.C.C.	Post ope. of B.P.H.	G-2	50×3	21	+ → ±	<i>S. marcescens</i>	10 <sup>5</sup>	6.25	<i>S. marcescens</i>	10 <sup>3</sup> ↓	25	/	Excellent
11	72	M	C.C.P.	Rt. cutaneous ureterostomy	G-3	50×3	5	+ → ±	<i>P. rettgeri</i>	10 <sup>7</sup>	12.5	<i>P. rettgeri</i>	10 <sup>7</sup>	100	Poor	Poor
12	86	M	C.C.P.	Renal failure	G-3	100×3	5	± → -	<i>S. marcescens</i>	10 <sup>4</sup>	1.56	—	0		Excellent	Excellent
13	70	M	C.C.P.	Rt. renal stone	G-3	100×4	5	± → -	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.05	—	0		Excellent	Excellent
14	50	F	C.C.P.	N.B.	G-3	200×2	5	+ → -	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.39	—	0		Excellent	Excellent
15	38	M	C.C.P.	Bil. renal stone	G-3	200×2	7	± → +	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>7</sup>	3.13	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>7</sup>	25	/	Poor
16	68	F	C.C.P.	N.B. Hydronephrosis	G-3	100×4	7	± → -	<i>K. pneumoniae</i>	10 <sup>7</sup>	0.78	—	0		/	Excellent

Table 1-(1) (Continued)

Case No.	Age	Sex	Diagnosis	Underlying disease	U.T.I. group	Treatment		Pyuria	Isolated organism						Evaluation		Side effects	
						Dose (mg X/day)	Duration (days)		Before	After	Species	Count	MIC* ( $\mu\text{g/ml}$ )	Species	Count	MIC* ( $\mu\text{g/ml}$ )		U.T.I.
17	59	F	C. C. P.	Lt. renal stone	G-3	100 X 3	7	## → +	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup>	0.39	—	0	—	0	—	Moderate	—
18	59	F	C. C. P.	Rt. renal stone	G-3	200 X 2	7	## → —	<i>C. freundii</i>	10 <sup>7</sup>	6.25	—	0	—	0	—	Excellent	—
19	54	F	C. C. P.	Rt. renal stone	G-3	100 X 3	14	## → ##	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.78	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup>	12.5	—	—	Poor	—
20	75	F	C. C. P.	Lt. renal stone	G-3	100 X 3	14	## → ##	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>5</sup>	3.13	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>5</sup>	6.25	—	—	Fair	—
21	71	F	C. C. P.	Rt. renal stone	G-3	100 X 3	14	## → ##	<i>C. freundii</i>	10 <sup>4</sup>	0.78	—	0	—	0	—	Poor	—
22	51	F	C. C. P.	Rt. renal stone	G-3	100 X 4	14	## → #	<i>E. cloacae</i>	10 <sup>10</sup>	0.20	—	0	—	0	—	Moderate	—
23	52	F	C. C. P.	Rt. renal stone	G-3	100 X 4	24	## → ##	<i>P. mirabilis</i>	10 <sup>4</sup>	—	<i>K. ozonae</i>	10 <sup>5</sup>	50	—	—	Fair	—
24	39	F	C. C. P.	Rt. renal stone	G-3	100 X 3	6	+ → —	<i>S. epidermidis</i>	10 <sup>3</sup>	0.20	—	0	—	0	—	Fair	—
25	54	M	C. C. P.	Lt. ureteral stone	G-3	200 X 3	7	— → —	<i>Streptococcus</i>	10 <sup>6</sup>	—	—	0	—	0	—	Excellent	—
26	74	M	C. C. C.	N.B.	G-4	100 X 3	5	## → —	$\alpha$ - <i>Streptococcus</i>	10 <sup>7</sup>	—	—	0	—	0	—	Excellent	Moderate
27	71	M	C. C. C.	B.P.H. Urethral stricture	G-4	100 X 3	5	## → ±	<i>E. coli</i>	10 <sup>6</sup>	0.05	—	0	—	0	—	Moderate	Moderate
28	68	M	C. C. C.	Post op. of B.T.	G-4	100 X 3	5	## → —	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>5</sup>	0.39	—	0	—	0	—	Excellent	Excellent
29	68	M	C. C. C.	Urethral stricture B.T.	G-4	100 X 3	5	## → #	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	—	—	0	—	0	—	Moderate	Moderate
30	74	M	C. C. C.	B.P.H.	G-4	100 X 3	5	## → —	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.05	—	0	—	0	—	Excellent	Excellent
31	67	F	C. C. C.	N.B. Rt. V.U.R.	G-4	100 X 4	5	## → —	<i>E. coli</i>	10 <sup>8</sup>	0.05	—	0	—	0	—	Excellent	Excellent
32	70	F	C. C. C.	N.B.	G-4	100 X 4	5	## → —	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.20	—	0	—	0	—	Excellent	Excellent

Table 1-(1) (Continued)

Case No.	Age	Sex	Diagnosis	Underlying disease	U.T.I. group	Treatment		Pyuria		Isolated organism				Evaluation		Side effects		
						Dose (mg X/day)	Duration (days)	Before	After	MIC* ( $\mu$ g/ml)	Species	Count	MIC* ( $\mu$ g/ml)	Species	Count		U. T. I.	Dr.
33	68	F	C. C. C.	Rt. renal cancer N. B.	G-4	100 X 4	5	+	→	+	<i>S. faecalis</i>	10 <sup>7</sup>		<i>S. faecalis</i>	10 <sup>3</sup> ↓	Moderate	Fair	—
34	69	F	C. C. C.	N. B.	G-4	100 X 4	5	##	→	##	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>6</sup>	6.25	<i>S. marcescens</i>	10 <sup>3</sup>	Poor	Poor	—
35	58	M	C. C. C.	B. T.	G-4	100 X 3	5	##	→	+	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.05	Fungi	10 <sup>3</sup> ↓	Moderate	Moderate	—
36	73	M	C. C. C.	Prostatic cancer	G-4	100 X 4	5	+	→	—	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>7</sup>	0.78	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>4</sup>	Poor	Fair	—
37	58	M	C. C. C.	N. B.	G-4	200 X 2	5	+	→	+	<i>E. coli</i>	10 <sup>6</sup>	0.39	—	0	Moderate	Poor	—
38	82	M	C. C. C.	N. B.	G-4	200 X 3 100 X 3 50 X 3	5 7 6	+	→	—	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>5</sup>		—	0	Excellent	Excellent	—
39	73	M	C. C. C.	N. B.	G-4	100 X 4	7	##	→	—	<i>S. epidermidis</i>	10 <sup>5</sup>		—	0	/	Excellent	—
40	66	M	C. C. C.	N. B.	G-4	100 X 4	7	##	→	—	<i>E. coli</i>	10 <sup>4</sup>		—	0	/	Excellent	—
41	79	M	C. C. C.	Post. op. of B. T. Urethral stricture	G-4	100 X 4	7	##	→	±	<i>S. marcescens</i>	10 <sup>6</sup>	25	—	0	/	Excellent	—
42	67	M	C. C. C.	N. B.	G-4	100 X 3	7	+	→	—	<i>E. cloacae</i>	10 <sup>10</sup>	0.05	—	0	/	Excellent	—
43	74	M	C. C. C.	P. H. Urethral stricture	G-4	200 X 3	7	##	→	+	<i>E. aerogenes</i>	10 <sup>6</sup>	12.5	—	0	/	Excellent	—
44	63	M	C. C. C.	Post. op. of bladder stone	G-4	100 X 3	8	##	→	+	<i>S. epidermidis</i>	10 <sup>5</sup>	0.78	—	0	/	Excellent	—
45	83	M	C. C. C.	Prostatic cancer	G-4	100 X 4	14	##	→	—	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.05	—	0	/	Excellent	—
46	17	F	C. C. C.	N. B.	G-4	200 X 2	5	—	→	—	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.05	—	0	/	Excellent	—

Table 1-(1) (Continued)

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	U.T.I. group	Treatment		Pyuria Before → After	Isolated organism				Evaluation		Side effects		
					Dose (mg × day)	Duration (days)		Before		After		U.T.I.	Dr.			
47	75 M	C. C. C.	B. P. H.	G-4	100 × 3	6	- → -	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>3</sup>	3.13	-	0	/	Fair	-	
48	34 M	C. C. C.	Post ope. of contracted bladder	G-4	100 × 3	7	# → ±	<i>S. epidermidis</i>	10 <sup>3</sup>	0.20	-	0	/	Excellent	-	
49	63 F	C. C. C.	N. B.	G-4	100 × 3	10	# → -	Enterococcus	10 <sup>4</sup>		-	0	/	Excellent	-	
50	56 F	C. C. C.	N. B.	G-4	100 × 3	10	# → -	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup>	1.56	10 <sup>7</sup>	1.56	/	Moderate	-	
51	66 M	C. C. C.	Urethral stricture	G-4	100 × 3	35	# → #	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>3</sup>	1.56	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>4</sup>	/	Poor	-	
52	83 M	C. C. C.	Urethral stricture Prostatic stone	G-4	100 × 3 50 × 3	14 14	# → -	<i>A. calcoaceticus</i> var. <i>anitralis</i>	10 <sup>5</sup>	0.78	-	0	/	Excellent	-	
53	74 M	C. C. C.	Urethral stricture	G-5	100 × 3	5	# → -	<i>P. pseudocaligenes</i> <i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>5</sup> 10 <sup>6</sup>	25 25	<i>P. pseudocaligenes</i> 10 <sup>6</sup> <i>P. aeruginosa</i>	12.5 25	Poor	Moderate	-	
54	56 F	C. C. P.	Contracted bladder	G-5	100 × 3	5	# → +	<i>K. oszanae</i> <i>P. aeruginosa</i> <i>S. faecalis</i>	10 <sup>7</sup>	3.13 >100 1.56	-	0	Moderate	Fair	-	
55	20 M	C. C. P.	Hydronephrosis	G-5	100 × 3	5	# → #	<i>C. freundii</i> <i>E. aerogenes</i> <i>S. marcescens</i>	10 <sup>7</sup>	3.13 0.20 0.78	<i>C. freundii</i>	10 <sup>7</sup>	12.5	Poor	Fair	-
56	59 F	C. C. C.	Lt. contracted kidney	G-5	100 × 4	5	# → #	<i>K. oszanae</i> <i>S. marcescens</i>	10 <sup>5</sup>	12.5 0.78	<i>P. cepacia</i> <i>S. marcescens</i>	10 <sup>5</sup> 50	50 50	Poor	Poor	-
57	75 M	C. C. C.	B. P. H.	G-5	100 × 4	7	# → -	<i>P. rettigeri</i> <i>S. pyogenes</i>	10 <sup>6</sup>	3.13 1.56	-	0	/	Excellent	-	
58	50 M	C. C. P.	N. B.	G-5	100 × 3	7	# → #	<i>S. marcescens</i> <i>P. rettigeri</i>	10 <sup>6</sup>	6.25 3.13	<i>S. marcescens</i>	10 <sup>6</sup>	12.5	/	Poor	-

Table 1-(1) (Continued)

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	U.T.I. group	Treatment		Pyuria	Isolated organism				Evaluation		Side effects		
					Dose (mg X/day)	Duration (days)		Before	After	U. T. I.	Dr.					
59	46 F	C. C. P.	Post ope. of rt. renal stone	G-6	50 X 4	5	Before → After # → —	Species <i>C. freundii</i> <i>E. coli</i>	Count 10 <sup>6</sup>	MIC* (μg/ml) 0.10 0.05	Species <i>C. freundii</i> <i>E. coli</i>	Count 10 <sup>5</sup> ↓	MIC* (μg/ml)	Moderate	—	
60	74 M	C. C. C.	N.B.	G-6	100 X 3 50 X 3	5 28	Before → After # → ±	Species <i>P. aeruginosa</i> <i>S. epidermidis</i>	Count 10 <sup>5</sup>	MIC* (μg/ml) 3.13 0.39	Species <i>P. aeruginosa</i>	Count 10 <sup>6</sup>	MIC* (μg/ml) 3.13	Poor	—	
61	73 M	C. C. C.	Urethral stricture	G-6	100 X 3	5	Before → After # → #	Species <i>K. pneumoniae</i> <i>A. calcoaceticus</i> var. <i>anitratius</i>	Count 10 <sup>7</sup>	MIC* (μg/ml) 0.78 0.05	Species <i>A. calcoaceticus</i> var. <i>anitratius</i>	Count 10 <sup>7</sup>	MIC* (μg/ml) 0.05	Poor	Fair	—
62	51 M	C. C. P.	B. T.	G-6	100 X 3	5	Before → After # → —	Species <i>C. freundii</i> <i>E. coli</i>	Count 10 <sup>6</sup>	MIC* (μg/ml) 0.10 0.05	Species —	Count 0	MIC* (μg/ml)	Excellent	Excellent	—
63	52 M	C. C. C.	N.B.	G-6	100 X 3	5	Before → After # → —	Species <i>S. marcescens</i> <i>A. calcoaceticus</i> var. <i>anitratius</i>	Count 10 <sup>10</sup>	MIC* (μg/ml) 0.39 0.20	Species —	Count 0	MIC* (μg/ml)	Excellent	Excellent	—
64	75 M	C. C. C.	N.B. B. P. H.	G-6	100 X 3	5	Before → After + → —	Species <i>C. freundii</i> <i>K. osaeanae</i>	Count 10 <sup>7</sup>	MIC* (μg/ml) 6.25 0.78	Species —	Count 0	MIC* (μg/ml)	Excellent	Excellent	—
65	66 F	C. C. C.	N.B.	G-6	100 X 4	5	Before → After # → —	Species <i>E. aerogenes</i> <i>K. pneumoniae</i>	Count 10 <sup>7</sup>	MIC* (μg/ml) 0.10 6.25	Species —	Count 0	MIC* (μg/ml)	Excellent	Excellent	—
66	74 M	C. C. C.	Post ope. of prostatic cancer	G-6	100 X 4 100 X 3	5 14	Before → After # → —	Species <i>C. freundii</i> <i>P. aeruginosa</i>	Count 10 <sup>4</sup>	MIC* (μg/ml) 0.20 0.39	Species —	Count 0	MIC* (μg/ml)	Excellent	Excellent	—
67	61 M	C. C. C.	N.B.	G-6	200 X 2	5	Before → After # → —	Species <i>E. aerogenes</i> <i>C. freundii</i> <i>S. faecalis</i>	Count 10 <sup>4</sup>	MIC* (μg/ml) 0.10 0.05 1.56	Species —	Count 0	MIC* (μg/ml)	Excellent	Excellent	—
68	58 F	C. C. C.	N.B.	G-6	200 X 2	5	Before → After # → —	Species <i>K. pneumoniae</i> <i>E. coli</i> <i>S. faecalis</i>	Count 10 <sup>7</sup>	MIC* (μg/ml) 0.10 0.05 0.78	Species —	Count 0	MIC* (μg/ml)	Excellent	Excellent	—

Table 1-(1) (Continued)

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	U.T.I. group	Treatment		Pyuria Before → After	Isolated organism				Evaluation		Side effects		
					Dose (mg X/day)	Duration (days)		Before		After		U. T. I.	Dr.			
69	49 M	C. C. C. N. B.		G-6	200 X 2	5	+ → -	Species	Count	MIC* ( $\mu$ g/ml)	Species	Count	MIC* ( $\mu$ g/ml)	Poor	Moderate	
								<i>K. pneumoniae</i>		0.10						
								<i>P. inconstans</i> B	10 <sup>5</sup>	0.10	<i>P. inconstans</i> B	10 <sup>5</sup>	25			
								<i>S. aureus</i>		0.39						
			<i>S. faecalis</i>		1.56											
70	44 M	C. C. C. N. B.		G-6	200 X 3	5	# → +	<i>S. epidermidis</i>		1.56				Moderate	Excellent	
								<i>S. marcescens</i>	10 <sup>6</sup>	3.13	<i>P. maltophilia</i>	10 <sup>3</sup> ↓	3.13			
								<i>P. maltophilia</i>		6.25						
71	74 M	C. C. C.	B. P. H. Prostatic stone	G-6	50 X 3	3	+ → -	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>5</sup>	0.78			Excellent	Excellent		
								<i>E. aerogenes</i>		0.78		0				
72	75 M	C. C. C.	B. P. H.	G-6	100 X 3	7	# → #	<i>E. cloacae</i>	10 <sup>7</sup>	1.56			/	Fair		
								<i>S. epidermidis</i>		6.25	<i>E. cloacae</i>	10 <sup>6</sup>			100	
73	56 M	C. C. C.	Post. op. of B. P. H.	G-6	200 X 3	7	# → +	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.05			/	Moderate		
								<i>S. faecalis</i>		1.56		0				
74	29 M	C. C. C.	Urethral stricture	G-6	200 X 2	7	+ → +	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.10			/	Moderate		
								<i>K. pneumoniae</i>		0.10		0				
75	53 M	C. C. C.	B. P. H.	G-6	100 X 4	7	+ → -	<i>C. freundii</i>	10 <sup>6</sup>	0.05			/	Excellent		
								<i>S. epidermidis</i>				0				
76	80 M	C. C. C.	Urethral stricture	G-6	100 X 3	14	# → -	<i>P. rettigeri</i>	10 <sup>6</sup>	25			/	Excellent		
								<i>S. epidermidis</i>		0.39		0				
77	84 M	C. C. C.	Prostatic cancer	G-6	100 X 3	14	+ → ±	<i>P. inconstans</i> B	10 <sup>6</sup>	6.25			/	Excellent		
								<i>S. epidermidis</i>		0.10		0				



Table 1-(1) (Continued)

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	U. T. I. group	Treatment Dose (mg×/day)	Duration (days)	Pyuria Before→After	Isolated organism						Evaluation		Side effects
								Before			After			U. T. I.	Dr.	
								Species	Count	MIC* (μg/ml)	Species	Count	MIC* (μg/ml)			
78	64 M	C. C. C.	Urethral stricture	G-6	100×4	14	+ → -	<i>K. ozaenae</i> <i>C. freundii</i>	10 <sup>7</sup>	0.39 0.78	-	0	/	Excellent	-	
79	78 M	C. C. C.	B. P. H.	G-6	100×3	14	## → -	<i>S. marcescens</i> <i>S. epidermidis</i>	10 <sup>3</sup>	6.25 1.56	-	0	/	Excellent	-	
80	30 F	C. C. P.	Lt. renal stone	/	100×3	7	± → ±	Fungi	10 <sup>6</sup>		-	0	/	Excellent	-	
81	79 M	C. C. C.	B. P. H.	/	100×4	14	## → ##	Fungi	10 <sup>9</sup>		Fungi	10 <sup>7</sup>	/	Poor	-	
82	76 M	C. C. C.	Post ope. of B. P. H.	/	200×3	7	## → ##	Fungi	10 <sup>4</sup>		Fungi	10 <sup>3</sup> ↓	/	Fair	-	
83	84 F	C. C. C.	B. T.	/	100×4	5	## → +	Fungi	10 <sup>3</sup> ↓		-	0	/	Moderate	-	
84	72 M	C. C. C.	Lt. ureteral tumor B. T.	/	100×3	5	## → ±	Unknown	10 <sup>3</sup> ↓		-	0	/	Fair	-	
85	73 M	C. C. C.	Post ope. of B. P. H.	/	200×3	4	+ → -	-	0		-	0	/	Fair	-	
86	51 M	C. C. C.	Urethral stricture	/	100×3	5	- → -	-	0		-	0	/	Fair	-	
87	32 M	C. C. P.	Lt. renal stone	/	100×4	28	## → ##	-	0		-	0	/	N. E.	-	
88	60 F	C. C. C.	N. B.	/	100×3	7	## → +	-	0		-	0	/	Excellent	-	
89	68 M	C. C. C.	N. B.	/	200×2	7	- → -	<i>P. aeruginosa</i>	10 <sup>4</sup>	12.5	-	0	/	N. E.	-	
90	67 F	C. C. P.	N. B.	/	200×3 100×1	5 10	+ → ±	-	0		-	0	/	Moderate	-	

Table 1-1 (Continued)

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	U.T.I. group	Treatment		Pyuria	Isolated organism						Evaluation		Side effects
					Dose (mg X/day)	Duration (days)		Before	After	U. T. I.	Dr.					
							Before → After	Species	Count	MIC* (µg/ml)	Species	Count	MIC* (µg/ml)	U. T. I.	Dr.	
91	78 M	C. C. C.	Bladder neck sclerosis	/	100 X 3	5	- → -	-	0		-	0		/	N. E.	-
92	54 F	C. C. C.	Contracted bladder	/	100 X 3	18	# → #	-	0		Fungi	10 <sup>3</sup> ↓		/	N. E.	-
93	54 M	C. C. C.	B. P. H.	/	50 X 4	7	# → #	-	0		-	0		/	Poor	-
94	73 M	C. C. C.	Post ope. of B. P. H.	/	100 X 3	14	# → +	Fungi	10 <sup>4</sup>		-	0		/	Moderate	-
95	42 M	C. C. P.	Lt. hydronephrosis	/	100 X 3	7	# → ±	-	0		-	0		/	Moderate	-
96	61 M	C. C. P.	Rt. renal stone Rt. ureteral stone	/	100 X 4	7	+ → ±	<i>P. maltophilia</i> <i>S. epidermidis</i>	10 <sup>3</sup> ↓	0.39 0.39	-	0		/	N. E.	-

\* Inoculum size 10<sup>6</sup> cells/ml

C. C. C.: Chronic complicated cystitis, C. C. P.: Chronic complicated pyelonephritis, B. P. H.: Benign prostatic hypertrophy, N. R.: Neurogenic bladder, B. T.: Bladder tumor, N. E.: Not evaluated

Table 1-(2) Clinical summary of acute simple cystitis cases treated with DL-8280

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Treatment		Symptom		Pyuria		Isolated organism				Evaluation		Side effects				
			Dose, (mg×/day)	Duration (days)	Before→After	After→Before	Species	MIC* (μg/ml)	Count	Species	Count	MIC* (μg/ml)	U.T.I.	Dr.					
																Before	After		
97	39 F	A. S. C.	100×3	3	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup>	0.05	-	0	-	Excellent	Moderate	-
98	56 F	A. S. C.	100×3	3	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup>	0.05	-	0	-	Excellent	Excellent	-
99	61 F	A. S. C.	100×3	3	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup>	0.05	-	0	-	Excellent	Excellent	-
100	52 F	A. S. C.	100×3	3	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup>	0.05	-	0	-	Excellent	Excellent	-
101	43 F	A. S. C.	100×3	3	##	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>6</sup>	0.05	-	0	-	Excellent	Excellent	-
102	51 F	A. S. C.	100×2	3	+	→	-	+	→	-	G. N. B.	10 <sup>5</sup>		-	0	-	Excellent	Excellent	-
103	70 F	A. S. C.	100×3	3	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>6</sup>	0.05	-	0	-	/	Moderate	-
104	29 F	A. S. C.	100×3	4	+	→	+	##	→	+	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.05	-	0	-	/	Fair	-
105	38 F	A. S. C.	100×2	5	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>6</sup>	0.05	-	0	-	/	Excellent	+
106	34 F	A. S. C.	100×3	5	+	→	-	##	→	-	<i>K. pneumoniae</i> <i>E. cloacae</i> <i>K. ozonae</i> <i>S. epidermidis</i>	10 <sup>4</sup>	0.10 0.10 0.10 0.78	-	0	-	/	Excellent	-
107	76 F	A. S. C.	100×3	5	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>6</sup>	0.05	-	0	-	/	Moderate	-
108	75 F	A. S. C.	100×3	5	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.10	-	0	-	/	Excellent	-
109	45 F	A. S. C.	50×3	5	+	→	-	##	→	-	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.10	-	0	-	/	Excellent	-

Table 1-(2) (Continued)

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Treatment		Symptom		Pyuria		Isolated organism						Evaluation		Side effects
			Dose (mg X/day)	Duration (days)	Before	After	Before	After	Before		After		U. T. I.	Dr.			
									Species	Count	MIC* ( $\mu\text{g/ml}$ )	Species			Count	MIC* ( $\mu\text{g/ml}$ )	
110	26 F	A. S. C.	100 X 3	7	+	→ -	+	→ -	<i>E. coli</i>	10 <sup>7</sup>	0.05	-	0	/	Excellent	-	
111	37 F	A. S. C.	100 X 2	15	±	→ -	±	→ ±	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup>	0.05	-	0	/	Excellent	-	
112	19 F	A. S. C.	50 X 3	3	+	→ -	##	→ -	<i>E. coli</i>	10 <sup>5</sup> ↓	0.05	<i>P. maltophilia</i>	10 <sup>3</sup>	/	Excellent	-	
113	50 F	A. S. C.	100 X 3	4	+	→ -	##	→ -	<i>E. coli</i>	10 <sup>3</sup>	0.05	-	0	/	Moderate	-	

\* Inoculum size 10<sup>6</sup> cells/ml

A. S. C. : Acute simple cystitis

Table 1-(3) Clinical summary of acute simple pyelonephritis cases treated with DL-8280

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Treatment		Pyuria		Isolated organism						Evaluation		Side effects	
			Dose (mg X/day)	Duration (days)	Before	After	Before		After		U. T. I.	Dr.				
							Species	Count	MIC* ( $\mu\text{g/ml}$ )	Species			Count	MIC* ( $\mu\text{g/ml}$ )		
114	42 M	A. S. P.	100 X 3	7	+	→ -	+	→ -	<i>K. ozonae</i> <i>S. epidermidis</i>	10 <sup>7</sup>		-	0	/	Excellent	-
115	67 F	A. S. P.	200 X 2	5	-	→ -	-	→ -	<i>S. epidermidis</i> <i>E. coli</i> <i>K. pneumoniae</i>	10 <sup>10</sup>		Fungi	10 <sup>3</sup> ↓	/	Moderate	-
116	39 M	A. S. P.	200 X 3	14	+	→ -	+	→ -	<i>E. coli</i>	10 <sup>4</sup>	0.05	-	0	/	Excellent	-
117	57 M	A. S. P.	200 X 3	7	##	→ ±	##	→ ±	<i>E. coli</i>	10 <sup>6</sup>	0.05	-	0	/	Excellent	-

\* Inoculum size 10<sup>6</sup> cells/ml  
A. S. P. : Acute simple pyelonephritis

Table 1-(4) Clinical summary of genital infection cases treated with DL-8280

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Treatment		Pyuria		Isolated organism						Evaluation	Side effects	
			Dose (mg X /day)	Duration (days)	Before	After	Before		After		MIC* ( $\mu$ g/ml)				
118	40 M	Prostatitis	200 X 3	3	##	→	—	—	—	0		0.05	—	—	Excellent
			100 X 3	5	##	→	—	—	—	0	—	—	—	—	
119	44 M	Prostatitis	200 X 3	7	##	→	—	—	0	—	—	—	—	Excellent	—
120	42 M	Prostatitis	200 X 3	14	±	→	—	<i>K. pneumoniae</i> <i>E. cloacae</i>	10 <sup>5</sup>	0.20 0.20	—	Fungi	10 <sup>3</sup>	Excellent	—
121	30 M	Prostatitis Epididymitis	200 X 3	5	+	→	—	—	0	—	—	—	—	Excellent	—
			100 X 3	5	##	→	—	—	—	0	—	—	—		
122	70 M	Prostatitis Epididymitis	100 X 3	7	##	→	—	<i>S. marcescens</i>	10 <sup>7</sup>	6.25	—	—	0	Excellent	—

\* Inoculum size 10<sup>6</sup> cells/ml

Table 1-(5) Clinical summary of urethritis cases treated with DL-8280

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Treatment		Isolated organism		Evaluation	Side effects
			Dose (mg×/day)	Duration (days)	Before	After		
123	19 M	G. U.	200×3	7	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Excellent	—
124	40 M	G. U.	200×3	7	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Excellent	—
125	23 M	G. U.	200×3	7	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Excellent	—
126	30 M	G. U.	200×3	5	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Excellent	—
127	31 M	G. U.	200×3	7	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Excellent	—
128	28 M	G. U.	200×3	7	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Excellent	—
129	26 M	G. U.	200×3	7	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Excellent	—
130	47 M	G. U.	200×3	6	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Excellent	—
131	22 M	G. U.	200×3	7	<i>N. gonorrhoeae</i>	—	Moderate	—
132	30 M	N. G. U.	200×3	7	—	—	Excellent	—
133	25 M	N. G. U.	200×3 100×3	10 7	—	—	Excellent	—

G. U. : Gonococcal urethritis, N. G. U. : Non-gonococcal urethritis

Table 2 Overall clinical efficacy of DL-8280 in complicated U.T.I.

Pyuria Bacteriuria	Cleared	Decreased	Unchanged	Efficacy on bacteriuria
	Eliminated	17	1	5
Decreased	2	1	1	4(11%)
Replaced		2	1	3( 8%)
Unchanged	3	1	4	8(21%)
Efficacy on pyuria	22(58%)	5(13%)	11(29%)	Case total 38
<input type="checkbox"/> Excellent	17(45%)		Overall effectiveness rate 29/38 (76%)	
<input type="checkbox"/> Moderate	12			
<input type="checkbox"/> Poor (or Failed)	9			

Table 3 Overall clinical efficacy of DL-8280 classified by type of infection

Group		No. of (Percent) cases (of total)	Excellent	Moderate	Poor	Overall effectiveness rate
Single infection	1st group (Catheter indwelt)	3 ( 8%)		3		100%
	2nd group (Post prostatectomy)	1 ( 3%)		1		100%
	3rd group (Upper U. T. I.)	4 ( 11%)	3		1	75%
	4th group (Lower U. T. I.)	13 ( 34%)	6	5	2	85%
	Sub total	21 ( 55%)	9	9	3	86%
Mixed infection	5th group (Catheter indwelt)	4 ( 11%)		1	3	25%
	6th group (No catheter indwelt)	13 ( 34%)	8	2	3	77%
	Sub total	17 ( 45%)	8	3	6	65%
Total		38 (100%)	17	12	9	76%

Table 4 Overall clinical efficacy of DL-8280 judged by attending doctor  
classified by type of infection

Group		No. of (Percent) cases (of total)	Excellent	Moderate	Fair	Poor	Overall effectiveness rate
Single infection	1st group (Catheter indwelt)	6 ( 8%)	1	1	1	3	33%
	2nd group (Post prostatectomy)	4 ( 5%)	2	1	1		75%
	3rd group (Upper U. T. I.)	15 ( 19%)	6	2	3	4	53%
	4th group (Lower U. T. I.)	27 ( 34%)	15	6	3	3	78%
	Sub total	52 ( 66%)	24	10	8	10	65%
Mixed infection	5th group (Catheter indwelt)	6 ( 8%)	1	1	2	2	33%
	6th group (No catheter indwelt)	21 ( 27%)	13	5	2	1	86%
	Sub total	27 ( 34%)	14	6	4	3	74%
Total		79 (100%)	38	16	12	13	68%

Table 5 Overall clinical efficacy of DL-8280 in acute simple cystitis

Symptom		Resolved			Improved			Persisted			Efficacy on bacteriuria
Pyuria		Cleared	De-creased	Un-changed	Cleared	De-creased	Un-changed	Cleared	De-creased	Un-changed	
Bacteriuria	Eliminated	6									6 (100%)
	Decreased (Replaced)										0
	Unchanged										0
Efficacy on pain on urination		6 (100%)			0			0			Case total
Efficacy on pyuria		6 (100%)			0			0			
<input type="checkbox"/> Excellent		6 (100%)			Overall effectiveness rate			6 / 6 (100%)			
<input type="checkbox"/> Moderate		0									
<input type="checkbox"/> Poor (or Failed)		0									

Table 6 Overall clinical efficacy of DL-8280 judged by attending doctor

Diagnosis	No. of cases (Percent of total)	Excellent	Moderate	Fair	Poor	Efficacy (%)
A. S. C.	17 ( 13%)	12	4	1		94
Complicated U.T.I.	91 ( 71%)	40	20	16	15	66
A. S. P.	4 ( 3%)	3	1			100
Prostatitis	3 ( 2%)	3				100
Prostatitis Epididymitis	2 ( 2%)	2				100
Sub total	117 ( 91%)	60	25	17	15	73
G. U.	9 ( 7%)	8	1			100
N. G. U.	2 ( 2%)	2				100
Sub total	11 ( 9%)	10	1			100
Total	128 (100%)	70	26	17	15	75

外の主な理由は、尿中細菌数や白血球数の不足であった。

慢性複雑性尿路感染症 38 例に対する総合臨床効果は著効 17 例 (45%)、有効 12 例、無効 9 例であり、総合有

効率は 76% であった (Table 2)。疾患病態群別の臨床効果を Table 3 に示した。単独感染群の有効率は 86% であり、混合感染群では 76% であった。カテーテル留



Table 7 Bacteriological response to DL-8280

	Isolates	No. of strains	Eradicated (%)	Persisted*	No. of strains appeared after treatment
G. P. B.	<i>S. aureus</i>	1	1 (100)		
	<i>S. epidermidis</i>	16	16 (100)		
	<i>S. pyogenes</i>	1	1 (100)		
	<i>S. faecalis</i>	6	5 ( 83)	1	
	<i>Streptococcus</i>	3	3 (100)		
	Sub total	27	26 ( 96)	1	
G. N. B.	<i>E. coli</i>	40	37 ( 93)	3	
	<i>C. freundii</i>	11	9 ( 82)	2	
	<i>Klebsiella</i> sp.	15	15 (100)		1
	<i>Enterobacter</i> sp.	11	9 ( 82)	2	
	<i>S. marcescens</i>	10	7 ( 70)	3	1
	<i>Proteus</i> sp.	7	5 ( 71)	2	
	<i>P. aeruginosa</i>	18	11 ( 61)	7	1
	<i>Pseudomonas</i> sp.	4	1 ( 25)	3	2
	<i>N. gonorrhoeae</i>	9	9 (100)		
	Others	4	3 ( 75)	1	
	Sub total	129	106 ( 82)	23	5
Total	156	132 ( 85)	24	5	
Fungi	5	3 ( 60)	2	6	

\* Regardless of bacterial count

置例 (1群, 5群) の有効率は 57.1% であり, 非置例は 80.6% であった。主治医による疾患病態群別の臨床効果を Table 4 に示した。単独感染群の有効率は 65% であり, 混合感染群では 68% であった。

急性単純性膀胱炎 6 例に対する総合臨床効果は著効 6 例で総合有効率は 100% であった (Table 5)。

主治医判定による臨床効果は, Table 6 に示すとおりであり, 総括すると著効 70 例, 有効 26 例, やや有効 17 例, 無効 15 例で有効率は 75% であった。尿道炎を除いた他の疾患 117 例と尿道炎 11 例とを別に小括してみると, 尿道炎を除いた疾患では著効 60 例, 有効 25 例, やや有効 17 例, 無効 15 例で有効率 73%, 尿道炎症例は著効 10 例, 有効 1 例で有効率 100% であった。各疾患別では, 急性単純性膀胱炎は著効 12 例, 有効 4 例, やや有効 1 例で有効率 94%, 複雑性尿路感染症では, 著効 40 例, 有効 20 例, やや有効 16 例, 無効 15 例で有効率

66%, 急性単純性腎盂腎炎は著効 3 例, 有効 1 例で有効率 100%, 前立腺炎は 3 例全例著効で有効率 100%, 前立腺炎と副睾丸炎の合併症例では, 2 例全例著効で有効率 100%, 淋菌性尿道炎では, 著効 8 例, 有効 1 例で有効率 100%, 非淋菌性尿道炎では, 2 例全例著効で, 有効率 100% であった。

細菌学的効果は, 起炎菌 156 株中 132 株消失し, 消失率は 85% であった。分離菌の推移の詳細は Table 7 にまとめた。グラム陽性菌では *S. epidermidis* は 16 株中 16 株, *S. faecalis* は 6 株中 5 株が消失した。グラム陰性菌では *E. coli* は 40 株中 37 株, *C. freundii* は 11 株中 9 株, *Klebsiella* sp. は 15 株中 15 株, *Enterobacter* sp. は 11 株中 9 株, *S. marcescens* は 10 株中 7 株, *Proteus* sp. 7 株中 5 株, *P. aeruginosa* は 18 株中 11 株, *N. gonorrhoeae* は 9 株中 9 株消失した。本剤投与後出現菌は *Klebsiella* sp. 1 株, *Serratia* 1 株, *P. aeruginosa* 1 株,

Table 8 Side effects and abnormal findings of laboratory tests

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	Symptom	Severity	Date of onset	Relation to DL-8280
24	39 F	C. C. P.	Rt. renal stone	RBC ↓ Hb ↓ Ht ↓ Pt ↓	363→301×10 <sup>6</sup> /mm <sup>3</sup> 11.0→9.4g/dl 32.7→29.9% 36.7→13.7×10 <sup>6</sup> /mm <sup>3</sup>	6 day	Definitely related
35	58 M	C. C. C.	Bladder tumor	GPT ↑	28→46 U/ml	5 day	Probably related
90	67 F	C. C. P.	Neurogenic bladder	GOT ↑ GPT ↑	22→72 U/ml 22→48 U/ml	15 day	Probably related
91	78 M	C. C. C.	Bladder neck sclerosis	RBC ↓ Hb ↓ Ht ↓ GOT ↑ GPT ↑	446→406×10 <sup>6</sup> /mm <sup>3</sup> 14.5→12.8g/dl 44.1→38.4% 29→50 U/ml 28→49 U/ml	5 day	Possibly related
104	29 F	A. S. C.	—	GOT ↑ GPT ↑	25.5→40.1 U/ml 29.7→66.1 U/ml	4 day	Possibly related
105	38 F	A. S. C.	—	Gastric disturbance Dry mouth	+ +	1 day	Probably related

*Pseudomonas* sp. 2株それに真菌類6株であった。

#### IV. 副作用

自覚的副作用としては、口渇および胃部不快感が1例認められたが、神経症状および過敏症状は認められなかった (Table 8)。臨床検査値の異常は5例に認められ、末梢血の赤血球数、ヘモグロビン、ヘマトクリット値の減少を2例に認め、その同症例のうち1例には血小板数の減少を認めた。また、GOT、GPTの上昇を3例に認め、GPTのみの上昇を1例に認めた (Table 8, Table 9, Fig. 2)。

#### V. 考 按

DL-8280はbenzoxazine 骨を有するオキサジン系の新合成経口抗菌剤で、近縁の抗菌剤には、既に市販されているナリジクス酸、ピロミド酸、ピペミド酸、シノキサシン、また現在開発中のノルフロキサシンなどがある。

DL-8280は基礎研究にて *Staphylococcus*, *S. faecalis*, *E. coli*, *Klebsiella*, *Proteus*, *Serratia*, *P. aeruginosa*, *H. influenzae*, *N. gonorrhoeae*, *B. fragilis* など、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、とくにグラム陽性菌には既存の同系統薬剤より抗菌力が優れている点が特長とされている<sup>1)</sup>。また、DL-8280はヒトに経口投与した場合、従来の同系統薬剤に比べ、投与量に相関したより高い血中濃度が得られ、また

各種組織への移行も良好であり、血中半減期は4~6時間で、尿中には約80%以上が24時間以内に未変化体のまま排泄されるといわれている<sup>1)</sup>。以上の諸成績より泌尿器科領域の各種感染症に対して本剤は有用であると思われるので、投与を試みた。その臨床効果をみると本剤の慢性複雑性尿路感染症に対する総合有効率は76%であり、この結果は、以前に百瀬らが施行したシノキサシンとナリジクス酸の複雑性尿路感染症に対する二重盲検比較試験<sup>4)</sup>の結果、すなわちシノキサシンおよびナリジクス酸の総合有効率各々38%、28%と比較すると、本剤はこれらの同系統薬剤に比し優れており、本剤の有効性を示していると思われた。また疾患病態群別の臨床効果においても、本剤は単独感染群では有効率86%、混合感染群では有効率76%であり、この結果も、前述のシノキサシンとナリジクス酸の二重盲検比較試験<sup>4)</sup>の結果、すなわちシノキサシンの単独感染群に対する有効率50%、混合感染群の有効率40%、ナリジクス酸の単独感染群に対する有効率43%、混合感染群の有効率28%と比較しても、本剤はこれら同系統薬剤に比し優れていると思われた。また本剤のカテーテル留置例に対する有効率は57.1%、非留置例の有効率は80.6%であり、この結果も前述のシノキサシンとナリジクス酸の二重盲検比較試験<sup>4)</sup>の結果、すなわちシノキサシンのカテーテル留置例に対する有効率30%、非留置例の有効率58%、ナリ

Table 9 Laboratory findings before and after administration of DL-8280

Case No.	Before or after treatment	RBC (10 <sup>4</sup> /mm <sup>3</sup> )	WBC (10 <sup>2</sup> /mm <sup>3</sup> )	Hb (g/dl)	GOT (U/ml)	GPT (U/ml)	S-Cr. (mg/dl)	BUN (mg/dl)
1	Before	332	52	11.3	13	9	0.7	17.4
	After	331	47	11.8	14	9	0.7	17.4
2	Before	332	168	11.0	50	27	2.0	41.6
	After	346	141	10.9	17	14	1.8	30.6
3	Before	340	125	10.7	23	7	0.9	16.0
	After	372	95	11.7	22	19	1.0	19.0
4	Before	331	120	9.1	26	43	1.28	19.0
	After	364	122	10.0	13	27	1.49	19.0
5	Before	434	91	11.7	14	6	1.0	16.0
	After	394	74	10.4	9	13	1.2	20.0
6	Before	415	92	12.7	24.1	18.2	1.14	8.3
	After	372	62	10.7	25.6	20.1	0.96	10.5
7	Before	321	117	10.3	19	24	2.0	32.3
	After	318	61	10.3	11	11	2.2	33.1
8	Before	381	70	12.1	10	7	1.4	19.0
	After	403	67	12.4	15	8	1.1	21.0
9	Before	434	60	12.9	16	12	0.93	16.4
	After	424	69	12.5	17	7	0.93	16.4
10	Before	336	64	10.9			1.31	27.6
	After	330	65	12.6	23.8	13.4	1.44	26.0
11	Before	402	57	12.0	25	20	1.8	31.5
	After	384	56	11.4	20	15	1.3	28.7
12	Before	446	56	13.2	30	24	1.28	31.6
	After	456	46	13.8	30	16	1.24	24.7
13	Before	485	78	13.9	17	8	1.3	20.2
	After	480	61	13.8	14	10	1.3	19.6
14	Before	283	53	9.8	27	16	0.8	20.0
	After	302	60	9.3	16	15	0.8	19.0
15	Before	499	99	14.2	28	20	1.70	17.4
	After	450	69	12.6	28	33	1.41	21.2
16	Before	440	73	13.4	15	7	1.12	15.3
	After	513	75	16.0	19	10	1.07	22.8
17	Before	430	45	13.0	14	13	1.1	16.0
	After	434	56	12.9	14	10	1.2	17.0
18	Before							
	After	441	65	13.5	20	22	0.7	14.0
19	Before	332	47	10.2	21	10	1.72	25.4
	After	325	51	11.0	16	10	1.80	37.2

Table 9 (Continued)

Case No.	Before or after treatment	RBC (10 <sup>4</sup> /mm <sup>3</sup> )	WBC (10 <sup>2</sup> /mm <sup>3</sup> )	Hb (g/dl)	GOT (U/ml)	GPT (U/ml)	S-Cr. (mg/dl)	BUN (mg/dl)
20	Before	343	50	9.9	26	15	2.17	30.6
	After	359	46	10.2	29	22	2.12	34.9
21	Before	414	55	13.0	21	16	0.90	22.1
	After	430	57	13.1	20	14	0.94	23.9
22	Before	441	60	13.9	33	45	0.8	16.0
	After	427	55	13.8	28	34	1.0	25.0
23	Before	458	88	13.6	15	12	1.01	17.1
	After	495	96	14.1	16	14	0.96	18.4
24	Before	363	57	11.0		15	1.14	15.7
	After	301	184	9.4	15		1.11	16.6
25	Before	450	107	14.3	56	68	3.0	33.4
	After	459	52	13.7	53	64	1.7	24.7
26	Before	441	62	13.4	19	14	0.8	19.0
	After	433	55	13.3	20	15	0.9	20.0
27	Before	494	100	16.5	22	14	0.7	18.3
	After	484	40	15.8	22	15	0.8	16.2
28	Before	357	50	12.0	13	12	0.9	12.6
	After	386	63	13.1	14	18	1.0	17.1
29	Before	424	79	14.1	22	19	1.0	12.0
	After	427	96	14.7	18	17		
30	Before	406	183	13.6	28	18		
	After	415	68	13.7				
31	Before	413	78	13.4	15	9	1.1	15.5
	After	389	43	12.0	14	7	1.2	19.1
32	Before	447	49	12.9	13	6	0.1	17.6
	After	430	52	12.6	12	8	1.0	18.0
33	Before	331	61	9.7	9	20		17.9
	After	374	50	10.9	10	22		16.8
34	Before	345	34	9.1	25	8	1.3	28.4
	After	333	40	10.1	25	10	1.3	28.6
35	Before	340	107	12.4	13	28	0.8	13.5
	After	330	117	12.3	31	46	0.8	18.3
36	Before	398	53	12.6	28	27	1.2	18.4
	After	413	69	13.6	27	36	1.4	22.5
37	Before	418	68	13.5	23	19	0.8	11.0
	After	477	85	14.4	24	20	0.7	14.0
38	Before	380	78	11.8	20	11	1.16	19.2
	After	399	53	11.9	15	6	1.13	23.1

Table 9 (Continued)

Case No.	Before or after treatment	RBC ( $10^4/\text{mm}^3$ )	WBC ( $10^2/\text{mm}^3$ )	Hb (g/dl)	GOT (U/ml)	GPT (U/ml)	S-Cr. (mg/dl)	BUN (mg/dl)
39	Before	413	118	13.0	22	9	1.5	14.0
	After	413	167	12.7	26	10	1.4	15.0
40	Before	502	56	14.5	25	19	1.5	18.0
	After	468	50	15.5	20	6	1.5	18.0
41	Before	472	37	14.7	18	12	1.1	17.0
	After	463	37	14.8	25	9	1.1	14.0
42	Before	492	70	15.8	55	56	0.9	19.0
	After	480	48	15.1	36	33	1.1	23.0
43	Before	517	80	14.8	14	8	1.6	22.0
	After	517	74	14.1	12	7	1.3	26.0
44	Before	361	66	11.7	7	7	1.5	17.0
	After	559	72	11.4	9	8	1.6	16.0
45	Before	331	79	11.4	18	6	1.0	8.7
	After	392	109	11.7	18	5	0.9	11.5
46	Before	403	50	12.7	15	10	0.7	12.0
	After	379	41	12.6	24	17	0.7	10.0
47	Before	467	80	14.3	33	40	1.29	16.5
	After	455	78	13.7	31	46	1.40	15.3
48	Before	588	57	16.6	18	30	1.6	17.0
	After	564	54	16.7	24	33	1.5	20.0
49	Before	366	44	11.4	20	11	0.94	21.7
	After	365	40	11.4	19	13	0.89	19.3
50	Before	402	56	11.0	12	12	0.93	20.1
	After	404	60	13.2	21	15	0.70	17.8
51	Before	393	29	12.0	30	22	0.70	16.7
	After	418	45	13.0	23	16	1.03	19.9
52	Before	431	41	13.6	25	10	0.85	19.2
	After	486	58	14.8	28	10	0.82	21.5
53	Before	360	73	11.1	12	5	0.7	13.0
	After	360	71	11.0	19	6	0.8	12.0
54	Before	432	53	13.0	13	6	1.9	24.0
	After	392	39	11.7	16	7	1.6	21.0
55	Before	550	82	15.1	25	38	0.8	13.4
	After	504	78	14.2	18	29	0.9	11.0
56	Before	408	78	9.8	12	8	0.8	22.2
	After	441	93	13.7	14	8	0.7	23.7
57	Before	422	51	12.0	25	10	1.4	20.0
	After				27	5	1.4	22.0

Table 9 (Continued)

Case No.	Before or after treatment	RBC ( $10^4/\text{mm}^3$ )	WBC ( $10^2/\text{mm}^3$ )	Hb (g/dl)	GOT (U/ml)	GPT (U/ml)	S-Cr. (mg/dl)	BUN (mg/dl)
58	Before	333	69	9.9	18	14	2.49	36.0
	After	303	53	9.6	25	16	2.29	31.4
59	Before	491	81	13.7	17	21	0.7	10.9
	After	457	69	12.9	19	22	0.8	12.1
60	Before	444	58	14.4	22	22	1.4	25.8
	After	442	63	13.9	20	19	1.3	22.2
61	Before	362	68	11.7	16	7	1.4	18.0
	After	413	80	13.6	12	6	1.0	15.0
62	Before	429	81	14.0	15	16	1.3	16.0
	After	426	78	13.0	18	15	1.3	18.0
63	Before	387	67	14.5	85	75	1.5	20.0
	After	387	71	14.8	72	84	1.5	18.0
64	Before	478	42	13.6	28	18	0.6	16.6
	After	438	34	12.4	23	13	0.7	19.8
65	Before	417	66	13.7	17	9	1.2	18.9
	After	408	62	12.0	16	12	1.1	17.0
66	Before	361	84	10.8	18	10	1.07	22.9
	After	343	77	10.9	18	7	1.14	24.4
67	Before	364	74	10.9	19	16	0.9	13.0
	After	421	63	12.8	11	10	0.8	9.0
68	Before	354	57	11.8	15	11	0.8	11.0
	After	366	48	12.8	19	16	0.9	13.0
69	Before	467	91	13.7	13	9	1.0	25.0
	After	441	66	12.7	13	11	1.2	26.0
70	Before	481	51	14.4	17	24	0.91	13.5
	After	460	53	14.1	21	24	0.78	23.6
71	Before	461	42	16.0	19	12	1.3	12.0
	After	467	42	16.3	17	5	1.1	15.0
72	Before	401	55	12.9	19	12	1.14	30.7
	After				24	9	1.02	28.9
73	Before	415	80	11.4	18	12	0.7	14.0
	After	370	74	11.0	17	12	1.0	14.0
74	Before	462	72	15.5	58	53	0.8	16.0
	After	464	57	15.0	39	62	1.1	14.0
75	Before	446	65	14.6	13	8	0.9	15.0
	After							
76	Before	483	58	14.8	25	15	1.32	25.3
	After	497	43	15.3	32	18	1.17	22.2

Table 9 (Continued)

Case No.	Before or after treatment	RBC ( $10^4/\text{mm}^3$ )	WBC ( $10^3/\text{mm}^3$ )	Hb (g/dl)	GOT (U/ml)	GPT (U/ml)	S-Cr. (mg/dl)	BUN (mg/dl)
77	Before	344	39	11.8	26	12	1.11	23.1
	After	364	48	11.3	33	13	1.21	21.0
78	Before	532	67	15.5	15	10	1.2	12.9
	After							
79	Before	445	58	14.6	44	31	1.85	27.7
	After	446	90	12.9	39	29	1.41	30.2
80	Before	447	51	14.0	31	49	0.9	12.0
	After	387	61	13.2	21	26	0.9	12.0
81	Before	508	98	15.3	15	12	1.3	21.0
	After	467	126	14.0	18	23	1.1	26.0
82	Before	371	55	11.3	19	16 <sup>b6</sup>	1.4	23.2
	After	430	40	12.1	20	9	1.3	21.0
83	Before	404	76	11.3	12	4	0.7	17.3
	After	391	63	11.0	14	1	0.7	13.3
84	Before	359	73	11.3	17	27	1.6	19.0
	After	350	55	11.0	19	23	1.3	16.0
85	Before	475	90	14.0	22	17	1.4	14.6
	After	460	80	12.8	35	25	1.4	25.0
86	Before	355	54	11.8	31	16	1.1	15.7
	After	382	78	12.7	27	25	0.9	14.1
87	Before	566	125	15.5	16	15	1.3	14.9
	After							
88	Before	430	64	14.1	18	12	0.88	20.1
	After	418	66	13.1	18	14	1.15	18.2
90	Before	442	88	12.1	22	22	0.7	21.4
	After	405	75	11.2	22	22	0.6	20.8
91	Before	466	53	14.5	29	28	1.02	12.0
	After	406	60	12.8	50	49	1.28	13.0
92	Before	353	47	11.7	42	17	0.9	19.5
	After	337	49	11.4	28	12	0.8	17.0
93	Before	399	46	13.3	31	26	1.0	11.5
	After	390	48	12.9	39	29	1.3	13.2
94	Before	385	72	11.7	28	21	0.87	23.8
	After	437	51	13.1	19	13	0.90	20.6
95	Before	546	92	18.5	33	29	1.4	15.0
	After	493	55	17.6	28	22		
96	Before	499	65	15.6	19	3	0.86	16.4
	After	471	84	14.6	21	11	0.66	18.1

Table 9 (Continued)

Case No.	Before or after treatment	RBC ( $10^4/\text{mm}^3$ )	WBC ( $10^2/\text{mm}^3$ )	Hb (g/dl)	GOT (U/ml)	GPT (U/ml)	S-Cr. (mg/dl)	BUN (mg/dl)
97	Before	437	117	12.2	19	8	0.7	14.0
	After	418	141	11.7	15	8	0.7	15.0
98	Before	431	68	13.4	14	7	0.8	19.0
	After	439	70	13.8	16	8	0.9	18.0
99	Before	403	101	12.3	26	16	0.8	14.0
	After	372	47	11.6	20	10	0.8	14.0
100	Before	434	78	12.3	14	7	0.7	15.0
	After	424	58	12.4	19	9	0.8	12.0
102	Before	414	86	13.2	22	19	0.6	15.0
	After	400	62	12.4	23	22	0.8	12.0
103	Before	464	54	13.9	19	8	1.3	20.0
	After	440	40	13.0			1.3	20.9
104	Before	415	62	12.2	25.5	29.7	0.72	12.4
	After	447	45	12.9	40.1	66.1	0.78	11.8
105	Before	403	61	12.4	10	5	1.1	14.0
	After	374	55	11.5	12	7	1.1	13.0
106	Before	440	57	10.3	13	8	0.6	18.0
	After	430	58	11.1	15	13	0.8	15.0
108	Before	388	101	12.1	22.3	13.1	0.83	20.0
	After	424	46	13.4	21.4	11.2	0.84	16.6
109	Before	434	125	12.7	15	9	0.44	12.7
	After	424	56	12.8	8	6	0.41	11.9
110	Before	423	46	13.8	15	9	0.8	13.0
	After	434	50	13.9	14	11	0.7	12.0
111	Before	395	135	9.6	15.0	5.5	0.74	13.2
	After	366	63	9.8	12.4	6.3	0.71	12.1
113	Before	381	85	12.0	19	11	0.65	14.0
	After	404	46	11.8	18	9	0.50	14.0
114	Before	428	72	15.0	34	60	1.4	16.0
	After	408	77	14.0	29	34	1.2	17.0
115	Before							
	After	458	61	13.8	29	20	1.1	18.0
116	Before	503	157	15.2	30.0	39.0	1.0	10.0
	After	527	169	15.3	22.7	50.7	0.96	13.3
117	Before	470	128	14.2	11	16	1.7	32.0
	After	425	154	13.2	22	23	1.5	25.0
118	Before	480	164	16.4	23	38	1.4	11.0
	After	467	66	14.5	20	28	1.1	12.0



Table 9 (Continued)

Case No.	Before or after treatment	RBC (10 <sup>4</sup> /mm <sup>3</sup> )	WBC (10 <sup>2</sup> /mm <sup>3</sup> )	Hb (g/dl)	GOT (U/ml)	GPT (U/ml)	S-Cr. (mg/dl)	BUN (mg/dl)
119	Before	519	132	16.8	28	33	1.14	16.9
	After	480	117	15.8	21	29	0.90	13.4
120	Before	482	45	15.0	37	51	1.29	17.2
	After	471	41	14.3	39	47	1.30	11.1
121	Before	471	91	14.2	17	11	1.17	16.5
	After	487	55	14.6	21	16	1.02	15.1
122	Before	411	69	13.2	25	18	0.93	20.1
	After	434	65	13.3	30	22	0.93	15.5
123	Before	461	91	15.3	16	13	1.08	14.8
	After	471	50	15.6	16	15	1.04	13.4
124	Before	462	107	15.0	18	16	0.78	13.6
	After	435	69	14.3	22	16	0.94	15.4
127	Before	463	60	14.5	20	13	1.10	23.9
	After	487	65	15.1	17	13	1.13	17.4
132	Before	490	91	15.3	20	33	1.05	13.2
	After							

ジクス酸のカテーテル留置例に対する有効率7%, 非留置例の有効率49%と比較しても、本剤は優れていると思われた。

急性単純性膀胱炎に対して本剤は有効率100%であり、この結果は、前述の複雑性尿路感染症に対する本剤の有用性から考えて当然の結果と思われる。

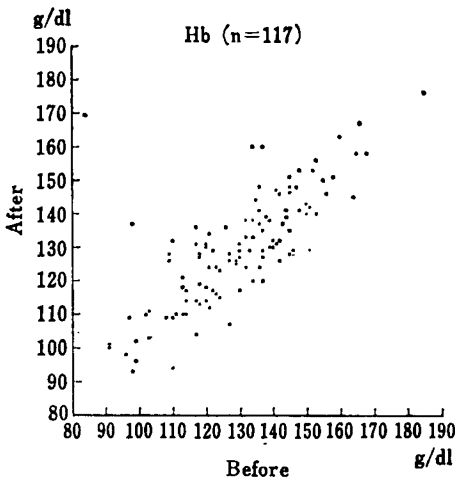
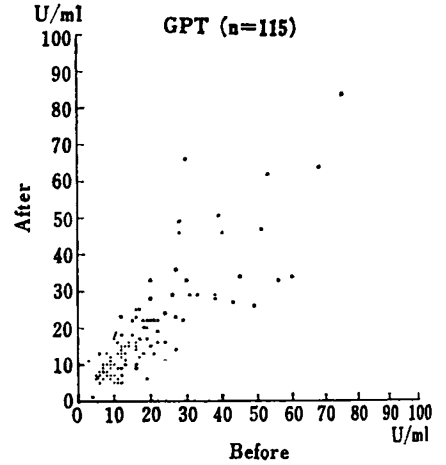
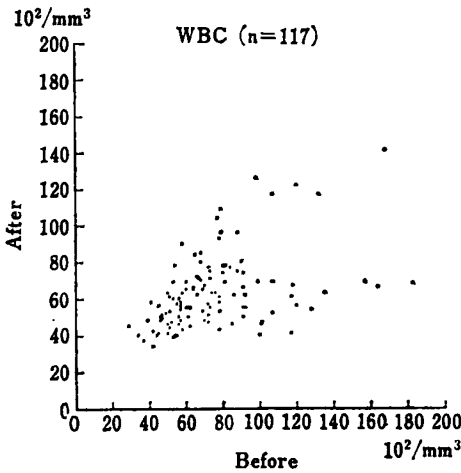
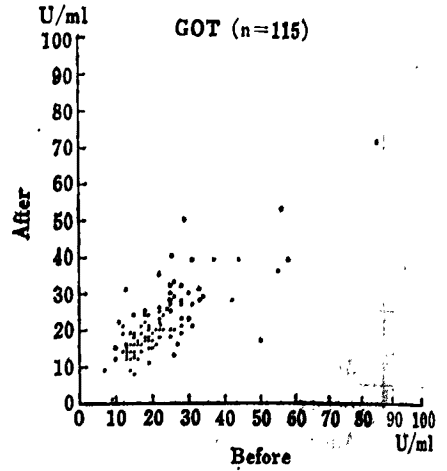
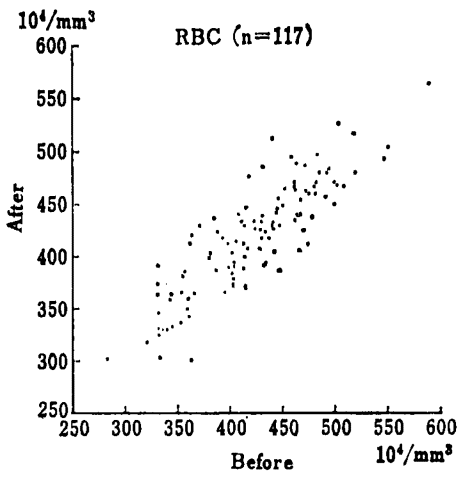
主治医判定による臨床効果を見ると、著効70例、有効26例、やや有効17例、無効15例で有効率は75%であった。これを各疾患別にみると急性単純性膀胱炎は有効率94%、複雑性尿路感染症では有効率66%、急性単純性腎盂腎炎は有効率100%、前立腺炎は有効率100%、前立腺炎と副睾丸炎の合併症例では有効率100%であり、淋菌性尿道炎では著効8例、有効1例で有効率100%、非淋菌性尿道炎でも2例著効で有効率100%であった。これらの結果は、本剤の基礎成績および複雑性尿路感染症に対する優れた結果よりみて当然の結果と思われる。なお本剤はヒトに経口投与した場合の吸収・排泄に関する研究<sup>1)</sup>において、従来の同系統薬剤に比べて投与量に相関したより高い血中濃度が得られ、また各種組織への移行も良好であることより、臨床的に副睾丸炎、前立腺炎に対して優れた効果を示したものと思われる。また細菌学的効果に関する基礎研究において、本剤は *N. gonorrhoeae* に対して強い抗菌力を有している<sup>1)</sup>ことより、淋

菌性尿道炎に対して優れた効果を示し、さらに非淋菌性尿道炎に対しても有用であった。

細菌学的効果を見ると、起炎菌の消失率は85%であり、分離菌の推移では *S. epidermidis* が16株全株消失し、*S. faecalis* は6株中5株消失し、グラム陽性菌に対するこの薬剤の有用性を認めた。また *E. coli*, *C. freundii*, *Klebsiella* sp., *Enterobacter* sp., *S. marcescens*, *Proteus* sp., *P. aeruginosa*, *N. gonorrhoeae* などのグラム陰性菌に対しても優れた効果を示し、特に *C. freundii*, *Klebsiella* sp., *Enterobacter* sp., *S. marcescens*, *Proteus* sp., *P. aeruginosa* に対して優れた効果を示したことが臨床的に他の同系統薬剤に比し、本剤の効果がより優れている一つの理由であると考えられる。なお *P. aeruginosa* 以外の *Pseudomonas* sp. に対しては4株中1株しか消失せず、本剤投与後の出現菌としても *P. aeruginosa* 以外の *Pseudomonas* sp. 2株、それに真菌類6株が認められたことは投与症例の選択、投薬薬剤の変更などの際に留意しておくべきであろう。

自覚的副作用としては口渇および胃部不快感が1例認められたが、同系統薬剤でときどき認められるめまい、羞明などは認められず、過敏症状も認められなかった。臨床検査値の異常は5例に認められ、末梢血の赤血球数、ヘモグロビン、ヘマトクリット値の減少を2例に、血小

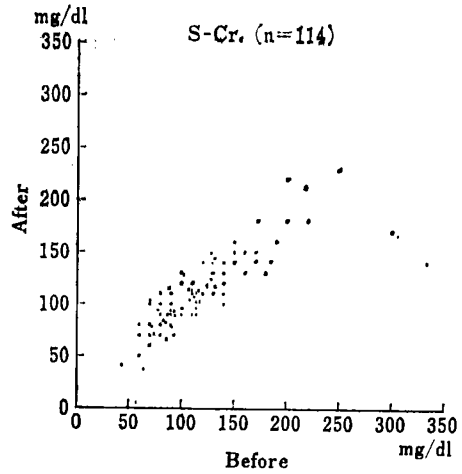
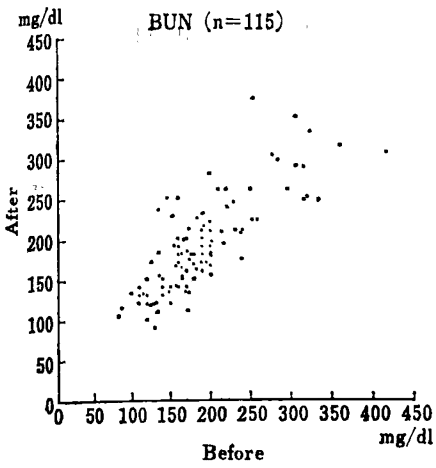
Fig. 2 Laboratory findings before and after administration of DL-8280



板数の減少を1例に認め、主治医が投与薬剤と関係ありとしたが、本剤の基礎実験でも、また他の施設の経口投与研究でもこのことは認められず、また異常値は薬剤投与終了後に何ら処置もせず、速やかに改善した。またGOT, GPTの一過性の上昇が3例に、GPTの上昇が1例に認められた。

泌尿器科領域の感染症の中で、臨床医がもっとも困惑しているのは、尿路に何らかの基礎疾患を有する複雑性尿路感染症であり、とくに経口抗菌剤の選択には悩むことが多い<sup>4)</sup>。以上の結果より、DL-8280はこの複雑性尿路感染症に対しても、経口用薬としてはかなり優れた有用性を有する薬剤であることが判明した。また本剤は、その特徴より、副睾丸炎、前立腺炎などにも有用であり、淋菌性および非淋菌性尿道炎にも有用であることが判明した。

Fig. 2 (Continued)



## 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) UTI 研究会: UTI (尿路感染症) 薬効評価基準補遺。

Chemotherapy 28: 1351~1358, 1980

- 4) 百瀬俊郎, 他 (8施設 および 関連施設): 複雑性尿路感染症に対する Cinoxacin の臨床効果 - Nalidixic acid との二重盲検比較試験 -。Chemotherapy 28 (S-4): 377~399, 1980

## CLINICAL EXPERIENCE OF DL-8280 IN UROLOGICAL INFECTIONS

SHUNRO MOMOSE and KAZUHIRO YOSHIMINE

Department of Urology, Faculty of Medicine, Kyushu University

JOICHI KUMAZAWA and SEIICHI NAKAMUTA

Division of Urology, Department of Surgery, Saga Medical School

NOBUYUKI ISHISAWA and YUKIO OSADA

Department of Urology, Miyazaki Medical College

KIMITAKA SAKAMOTO and YOSHIHARU MIYAZAKI

Department of Urology, School of Medicine, Fukuoka University

KOZO HIRATA and ICHIKIRO MORITA

Department of Urology, National Fukuoka Central Hospital

KANICHI EMOTO and KENJI AITO

Department of Urology, Hamanomachi Hospital

SANSHIN HARA

Department of Urology, Sanshinkai Hara Hospital

HIROSHI NAKAYAMA

Nakaya Urologist Clinic

TETSUO OMOTO

Department of Urology, Kyushu Koseinenkin Hospital

SADAMU ANDO

Department of Urology, Kitakyushu City Kokura Hospital

SHINICHI SATO

Department of Urology, Saiseikai Yahata Hospital

HIROYUKI NAGAYOSHI

Department of Urology, Shin-Nittetsu Yahata Hospital

TAKUYA AMANO

Department of Urology, Kitakyushu City Wakamatsu Hospital

HARUKA HIRANO and TETSURO MATSUMOTO

Department of Urology, National Beppu Hospital

KUNIHIRO MINODA

Department of Urology, Miyazaki Prefectural Miyazaki Hospital

HIRIOSHI HIRATA

Department of Urology, Hiroshima Red Cross Hospital

EJI IWATSUBO

Department of Urology, Spinal Injuries Center

## TETSURO TAKESUE

Department of Urology, National Nakatsu Hospital

ARIAKI NAGAYAMA and KYOKO IIDA

Department of Microbiology, Saga Medical School

DL-8280, a new synthetic oxazine derivative, was administered orally to 133 patients with urological infections at 18 departments of Urology of Kyushu University Hospital and its relevant hospitals.

The effectiveness of this drug was estimated in 38 cases of chronic complicated urinary tract infection and 6 cases of acute simple cystitis by the 2nd edition of judgement of UTI criteria. In the chronic complicated urinary tract infection group, the clinical effect proved excellent in 17 cases, moderate in 12 cases and poor in 9 cases (effective rate 76%) and in the acute simple cystitis group, excellent in 6 cases (effective rate 100%).

In the global judgement made by the attending physicians in the acute simple pyelonephritis group, the clinical efficacy proved excellent in 3 cases, moderate in one case (effective rate 100%), in the prostatitis group, the clinical efficacy proved excellent in 3 cases (effective rate 100%), in the prostatitis and epididymitis group, the clinical efficacy proved excellent in 2 cases (effective rate 100%), in the gonococcal urethritis group, the clinical efficacy proved excellent in 8 cases, moderate in one case (effective rate 100%) and in the non-gonococcal urethritis group, the clinical efficacy proved excellent in 2 cases (effective rate 100%).

Bacteriologically, 132 strains out of 156 strains isolated from all cases were disappeared after treatment with DL-8280. Eradicated were 16/16 of *S. epidermidis*, 5/6 of *S. faecalis*, 37/40 of *E. coli*, 9/11 of *C. freundii*, 15/15 of *Klebsiella* sp., 9/11 of *Enterobacter* sp., 7/10 of *S. marcescens*, 5/7 of *Proteus* sp., 11/18 of *P. aeruginosa* and 9/9 of *N. gonorrhoeae*.

Six of 133 patients exhibited side effect: one patient with thirst and epigastric discomfort, one with anemia and thrombocytopenia, one with anemia and elevated serum GOT and GPT, two with elevated serum GOT and GPT, one with elevated serum GPT. Anyway, those abnormal changes disappeared immediately after discontinuation of the administration.