

呼吸器感染症に対する Lenampicillin (KBT-1585) の使用経験

林 泉・阿部達也

いわき市立総合磐城共立病院呼吸器科

RTI 40 例に対する Lenampicillin (KBT-1585, LAPC) の臨床効果, 安全性および有用性を検討し, 次の結果を得た。

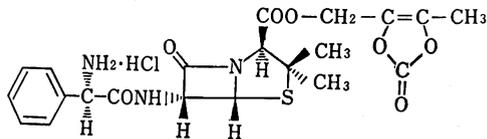
1. RTI 由来臨床分離菌 25 株のうち β -lactamase 産生 *H. influenzae* 4 株が除菌されなかったが, 21 株が除菌された (除菌率 84%)。
2. 臨床効果は著効 15 例, 有効 20 例, やや有効 1 例, 無効 4 例であった (有効率 87.5%)。
3. rash を来し 4 日間の投与で中止したものが 1 例, 食欲不振をきたしたものが 1 例, 実数 780 の好酸球増多を来したものが 1 例がみられたが, 重篤な副作用はみられず, 安全性も有用性も高いものであることがわかった。

Lenampicillin (KBT-1585) は鐘紡株式会社薬品研究所で開発されたアンピシリンのプロドラッグであり (Fig. 1), 吸収過程でアルデヒド体を形成することなく速やかに従来のアンピシリンとアセトインに代謝され, アセトインは続いてプタンジオールに代謝される。これら代謝物は生物界に広く存在する natural substance であり, 生体に無害である。吸収は従来のアンピシリンに比べ 3 倍程度良く, したがって血中濃度も 250 mg 内服により 60 分後に 4.86 μ g/ml と高値を示す¹⁾。

本剤の特徴は吸収の良さと高い血中濃度にあるといえよう。薬理作用, *in vitro* のデータは従来の ABPC と全く同じである。

我々は KBT-1585 を 40 例の呼吸器感染症に使用し, その薬効および副作用, 有用性などについて検討したので報告する。

Fig. 1 Chemical structure of KBT-1585



I. 対象 (Table 1)

20 歳から 76 歳までの成人男性 11 例, 女性 29 例で, 肺炎 11 例, 慢性気道感染症の急性増悪 18 例, 急性気管支炎 10 例, 汎細気管支炎 1 例である。基礎疾患を有するものは 30 例あり, 気管支拡張症 6 例, 気管支喘息 8 例, 慢性肺気腫 5 例, 肺結核 3 例, 陳旧性肺結核と肺気腫合併 1 例, 硅肺と肺気腫合併 1 例, 肺線維症 2 例, 中葉症候群 1 例, 肺気腫と気管支喘息合併 1 例, カルタゲナ症候群 1 例, 気管支喘息と肺結核合併 1 例である。

II. 投与方法, 投与量および投与期間 (Table 1)

KBT-1585 を 1 錠 (250 mg) 1 日 4 回, 食後 30 分に経口投与した。期間は 7 日間 25 例, 14 日間 9 例, 21 日間 1 例のほか, 3 日間 1 例, 3 日と 1 回 1 例, 4 日間 2 例, 6 日と 1 回 1 例であった。

III. 細菌学的効果 (Table 1, 2)

S. aureus 4 株, *H. influenzae* 12 株, *S. pneumoniae* 5 株, β -*Streptococcus* 2 株, *E. coli*, *Branhamella* が各 1 株, 計 25 株のうち *H. influenzae* の 4 株は除菌されなかった。これらは β -lactamase 産生株であり, ABPC 耐性株であった (除菌率 21/25=84%)。

IV. 臨床効果判定基準

起炎菌の動向および臨床症状の変化ならびに臨床検査値の動向を以下の基準に基づき本剤投与前, 3 日後, 7 日後, 14 日後に判定した。

著効: 起炎菌が 3 日以内に消失し, 発熱, 咳, 痰などの臨床症状が 3 日以内に著明改善し, CRP, WBC, ESR などの臨床検査値が 3 日以内に著明に改善したもの。

有効: 起炎菌が 7 日以内に消失するか, 著明に減少し, 臨床症状および臨床検査値が 7 日以内に改善するか, 14 日以内に正常に戻ったもの。

やや有効: 起炎菌の減少が認められても, 14 日たっても消失せず, 14 日以内に臨床症状の改善および臨床検査値の正常化の傾向がみられても正常化しないもの。

無効: 14 日たっても菌の減少がみられなかったり, 菌交代症を来したものの, または臨床症状および臨床検査値のまったく改善しないもの, あるいは悪化したもの。

V. 臨床効果 (Table 1, 3)

肺炎では 11 例のうち著効 2 例, 有効 7 例で無効は 2 例であった。慢性気道感染症の急性増悪では 18 例のう

Table 1-1 Clinical response of KBT-1585 against RTI

No.	Name	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	Daily dose and duration	Organism isolated		Clinical effect	Side effect
						Before	After		
1	T.K.	40 F	Pneumonia	Bronchiectasis	mg days 250 × 4 × 7	<i>S. aureus</i>	(-)	Good	(-)
2	M.M.	33 F	Pneumonia	Bronchiectasis	250 × 4 × 14	<i>H. influenzae</i> 3 × 10 ⁷	<i>H. influenzae</i> 2 × 10 ⁷	Good	(-)
3	K.K.	76 F	Pneumonia	(-)	250 × 4 × 14	N.F.	N.F.	Good	(-)
4	Y.S.	20 M	Pneumonia	Asthma bronch. Epilepsy	250 × 4 × 14	N.F.	N.F.	Good	Eosinophilia (780)
5	K.A.	57 M	Chr. bronchitis	Old tbc. Asthma bronch.	250 × 4 × 7	<i>H. influenzae</i>	(-)	Excellent	(-)
6	T.C.	38 F	Chr. bronchitis	Asthma bronch.	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Excellent	(-)
7	M.S.	50 F	Chr. bronchitis	C.P.E.	250 × 4 × 7	<i>H. influenzae</i> <i>S. pneumoniae</i>	(-) (-)	Excellent	(-)
8	S.S.	58 M	Chr. bronchitis	Silicosis C.P.E.	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Good	(-)
9	K.K.	64 M	Chr. bronchitis	C.P.E.	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Good	(-)
10	S.S.	32 M	Chr. bronchitis	Fibrosis	250 × 4 × 14	<i>H. influenzae</i>	(-)	Good	(-)

N.F.: Normal flora

Table 1-2 Clinical response of KBT-1585 against RTI

No.	Name	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	Daily dose and duration	Organism isolated		Clinical effect	Side effect
						Before	After		
11	M.O.	44 F	Chr. bronchitis	C.P.E. Asthma bronch.	mg 250 × 4 × 14 days	<i>S. pneumoniae</i>	(-)	Good	(-)
12	H.O.	59 F	Chr. bronchitis	Asthma bronch.	250 × 4 × 14	<i>H. influenzae</i>	(-)	Good	(-)
13	S.S.	65 M	Chr. bronchitis	Bronchiectasis	250 × 4 × 7	<i>S. pneumoniae</i>	(-)	Good	(-)
14	S.A.	34 F	Acute bronchitis	(-)	250 × 4 × 7	<i>H. influenzae</i>	(-)	Excellent	(-)
15	S.Y.	36 F	Acute bronchitis	(-)	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Excellent	(-)
16	F.Y.	34 F	Acute bronchitis	(-)	250 × 4 × 7	<i>S. aureus</i>	(-)	Excellent	(-)
17	T.I.	35 M	Acute bronchitis	(-)	250 × 4 × 7	<i>E. coli</i>	(-)	Good	(-)
18	T.F.	38 F	Acute bronchitis	(-)	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Good	(-)
19	M.S.	49 M	Acute bronchitis	Pulm. tbc.	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Good	(-)
20	F.S.	38 F	Acute bronchitis	(-)	250 × 4 × 7	<i>Branhamella</i>	(-)	Fair	Nausea

N.F. : Normal flora

Table 1-3 Clinical response of KBT-1585 against RTI

No.	Name	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	Daily dose and duration	Organism isolated		Clinical effect	Side effect
						Before	After		
21	M.H.	69 F	Pneumonia	Asthma bronch.	mg 250 × 4 × 7 days	N.F.	N.F.	Excellent	(-)
22	N.S.	64 F	Pneumonia	Bronchiectasis	250 × 4 × 7	<i>H. influenzae</i>	(-)	Excellent	(-)
23	F.S.	65 F	Pneumonia	Bronchiectasis	250 × 4 × 21	<i>H. influenzae</i>	(-)	Good	(-)
24	K.Y.	63 M	Pneumonia	Middle lobe syndrome	250 × 4 × 14	<i>S. pneumoniae</i>	(-)	Good	(-)
25	K.H.	76 M	Pneumonia	(-)	250 × 4 × 14	<i>S. aureus</i>	(-)	Good	(-)
26	C.H.	72 F	Pneumonia	C.P.E.	250 × 4 × 3 ½	<i>H. influenzae</i>	<i>H. influenzae</i>	Poor	(-)
27	M.K.	68 M	Pneumonia	Bronchiectasis	500 × 4 × 6 ½	<i>H. influenzae</i>	<i>H. influenzae</i>	Poor	(-)
28	H.H.	70 F	Chr. bronchitis	Asthma bronch.	250 × 4 × 7	<i>β-Streptococcus</i>	(-)	Excellent	(-)
29	T.T.	73 F	Chr. bronchitis	C.P.E.	250 × 4 × 7	<i>S. aureus</i>	(-)	Excellent	(-)
30	T.K.	54 F	Chr. bronchitis	Asthma bronch.	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Excellent	(-)

N.F.: Normal flora

Table 1-4 Clinical response of KBT-1585 against RTI

No.	Name	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease	Daily dose and duration	Organism isolated		Clinical effect	Side effect
						Before	After		
31	T.I.	58 F	Chr. bronchitis	Asthma bronch.	mg days 250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Good	(-)
32	M.S.	63 F	Chr. bronchitis	Old tbc. C.P.E.	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Excellent	(-)
33	T.A.	36 F	Chr. bronchitis	Kartagener syndrome	250 × 4 × 7	<i>H. influenzae</i>	(-)	Excellent	(-)
34	S.T.	58 F	Chr. bronchitis	Asthma bronch. Hypertension	250 × 4 × 7	N.F.	N.F.	Good	(-)
35	K.E.	66 F	Panbronchiolitis	C.P.E.	250 × 4 × 14	N.F.	N.F.	Good	(-)
36	F.N.	37 F	Chr. bronchitis	Lung fibrosis	250 × 4 × 4	<i>H. influenzae</i>	<i>H. influenzae</i>	Poor	(-)
37	M.T.	52 F	Chr. bronchitis	Old tbc.	250 × 4 × 3	N.F.	N.F.	Poor	(-)
38	I.E.	58 F	Bronchitis	Tbc.	250 × 4 × 4	N.F.	N.F.	Excellent	Rash
39	R.A.	20 F	Bronchitis	(-)	250 × 4 × 7	<i>β-Streptococcus</i>	(-)	Excellent	(-)
40	T.W.	44 F	Bronchitis	(-)	250 × 4 × 7	<i>S. pneumoniae</i>	(-)	Good	(-)

N.F.: Normal flora

Table 2 Bacteriological effects of KBT-1585

Isolates	No. of strains	Eradication No.
<i>S. aureus</i>	4	4
<i>H. influenzae</i>	12	8
<i>S. pneumoniae</i>	5	5
β - <i>Streptococcus</i>	2	2
<i>E. coli</i>	1	1
<i>Branhamella</i>	1	1

$$\text{Eradication ratio} = \frac{21}{25} = 84\%$$

ち著効8例, 有効8例で, 無効は2例であった。急性気管支炎の10例では著効5例, 有効4例, やや有効1例であった。汎細気管支炎の1例は有効であった。合計すると著効15例, 有効20例, やや有効1例, 無効4例であった(有効率 $35/40=87.5\%$)。

VI. 副作用 (Table 1, 4)

rashを来したものが1例あった。本剤250 mgを1日4回投与し, 4日目に前胸部を中心に粟粒大の発疹が出現し, 掻痒感を伴った。発疹そのものは軽度であったので強ミノ C 20 mlを1回静注し, 5日目に中止とした。アロプリノールとの併用はなかったし, ウィルス感染はなかった。臨床効果は著効であった。

また, 本剤投与7日後に好酸球増多(実数780)を認めたが, 継続投与で14日後には正常であった。本剤との関係ありと考える。

その他に軽度の嘔気を覚えたものがあり, 7日間の投与で中止したものが1例あった。

VII. 考察

RTIは院内感染や, 慢性気道感染症急性増悪の一部を除き, その大半にカゼ症状が先行する。このような経過をたどるいわゆる市中感染の場合は, 起炎菌に重篤なものは多くなく, *H. influenzae*, *S. pneumoniae*の両者で70~80%を占め, その他に*S. aureus*, *S. epidermidis*, *S. pyogenes*などがかかってくる。したがってこれらすべてをカバーするABPCが現在でも重要な抗生剤であることは疑う余地がない。更に第3世代cephemsやmonobactamなどでクローズアップされている*S. aureus*の増加でもABPCの必要性が再認識されている。

今までのABPCは腸管からの吸収があまり良くなく, 血中濃度上昇も不十分であり, 筋肉内投与や血管内投与

Table 3 Therapeutic effects of KBT-1585

Diagnosis	Excellent	Good	Fair	Poor	Total
Pneumonia	2	7	0	2	11
Chronic bronchitis	8	8	0	2	18
Acute bronchitis	5	4	1	0	10
Panbronchiolitis	0	1	0	0	1
Total	15	20	1	4	40

$$\text{Efficacy rate} = \frac{35}{40} = 87.5\%$$

に頼るのが有用であった。そこで最近BAPCをはじめとしてABPCをmodifyしたプロドラッグの形で経口投与し, 吸収を良くするように改善されたものが登場するようになった。PVPC, TAPC, BAPCなどのプロドラッグは3位のカルボキシル基に隣接する炭素原子に酸素原子が直接結合した形のダブルエステルであるが, KBT-1585はその位置に炭素原子が結合するという新構造をとっている(Fig. 1)。したがってKBT-1585は従来のABPCのプロドラッグのようにアルデヒド体を形成することなく, 吸収過程において速やかにABPCとアセトインに加水分解される。本剤は*in vitro*ではABPCと全く同じであるため抗菌力においては特に変わったことはないが, 吸収が3~5倍程度良くなったため, 臨床効果の上昇が見込まれている。

我々の成績でも細菌学的効果で84%と好成績が得られているし, 本剤のopen試験での呼吸器感染症での成績でもグラム陽性菌で83.0%, グラム陰性菌で71.4%という成績が得られている。全体での成績では1,209株に対し79.5%の消失でありABPCの有用性が確認された。ただし, 注目すべきは最近 β -lactamase産生*H. influenzae*の分離率上昇である。我々の施設でも*H. influenzae*の約10%がABPC耐性であり, 非消失の4株はいずれも β -lactamaseを産生する株であった。全国的レベルでもこの傾向にあることは注目すべきことである。

臨床効果では我々は有効率90%を得ることができ良かったが, 無効の4例のうち3例は β -lactamase産生*H. influenzae*による感染症であり, 他剤に変更した。

呼吸器感染症は基礎疾患の有無によって起炎菌にやや差があるが, 市中感染における初期段階ではABPCの

Table 4-1 Clinical results of KBT-1585 on respiratory tract infection

Case No.	RBC ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	WBC	Hb	Eo. (%)	Platelet ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	ESR (60 min.)	CRP	GOT	GPT	Al-P	BUN	Cr.
1	409*	9,800	12.8	0	26.4	44	+3	14	10	4.6	9.4	0.5
	412**	5,600	13.0	2	37.3	7	-	12	10	3.5	9.0	0.5
2	528	14,600	14.8	1	38.6	20	+2	15	7	4.6	8.5	0.6
	534	9,400	15.1	0	29.3	6	-	18	12	3.5	11.5	0.5
3	401	14,500	12.8	1	18.4	42	+3	12	8	5.8	18.0	0.8
	398	5,500	12.8	0	18.7	25	-	17	9	9.9	18.8	0.8
4	480	5,600	15.2	6	28.3	21	+1	15	16	7.3	11.6	0.5
	466	5,300	14.8	5	30.5	4	-	16	13	7.3	11.8	0.5
5	482	7,400	16.2	0	22.5	12	+2	22	12	6.5	20.0	0.8
	469	4,600	15.7	4	19.8	11	-	20	8	6.6	19.3	0.8
6	448	9,200	13.5	3	23.7	21	+1	21	10	4.2	10.0	0.6
	438	4,700	13.6	3	26.4	13	-	14	11	4.6	9.5	0.6
7	363	14,200	11.6	1	18.9	24	+2	19	16	6.9	8.1	0.6
	454	5,600	14.3	1	24.8	5	-	28	15	6.2	9.2	0.6
8	588	5,100	16.3	2	24.4	24	+1	26	14	7.4	9.2	0.8
	524	6,800	15.2	4	34.5	4	-	23	22	7.8	8.8	0.7
9	448	8,500	14.6	0	18.5	16	+2	26	10	5.8	11.1	0.7
	465	7,000	15.1	0	19.8	13	-	27	11	5.5	10.8	0.7
10	473	14,500	15.2	0	38.8	45	+3	24	21	6.9	8.8	0.8
	470	5,600	15.0	0	32.1	7	-	23	20	5.5	6.6	0.6

* Before **After

Table 4-2 Clinical results of KBT-1585 on respiratory tract infection

Case No.	RBC ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	WBC	Hb	Eo. (%)	Platelet ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	ESR (60min.)	CRP	GOT	GPT	Al-P	BUN	Cr.
11	522*	8,600	15.9	0	25.4	28	+1	17	11	5.8	11.2	0.6
	466**	5,300	13.8	1	27.3	4	-	18	10	5.7	12.0	0.6
12	449	8,200	12.9	0	26.2	110	+4	20	10	8.3	12.1	0.4
	449	7,300	13.2	0	33.0	43	-	15	10	8.0	14.3	0.5
13	457	12,400	13.5	0	48.2	53	+1	25	25	4.8	10.0	1.1
	424	8,400	13.2	0	25.1	13	-	20	8	4.1	11.2	1.0
14	470	7,300	14.2	0	30.1	13	+2	12	10	4.3	11.3	0.4
	483	4,100	14.5	1	31.3	2	-	13	11	4.1	11.2	0.4
15	507	16,800	14.4	3	23.3	22	+3	17	9	4.1	7.1	0.4
	444	4,800	13.6	2	23.5	5	-	18	11	4.1	7.3	0.4
16	484	6,700	14.0	0	16.2	4	+1	52	43	6.3	18.3	1.0
	453	4,600	13.8	0	18.3	2	-	21	24	6.6	16.6	0.9
17	524	9,300	16.0	2	28.5	2	+2	23	32	3.8	18.2	0.7
	508	5,300	15.8	1	27.0	4	-	16	25	4.2	17.7	0.7
18	401	9,300	12.5	2	28.3	42	+2	22	7	3.9	6.8	0.5
	411	3,600	12.8	0	27.7	4	-	21	11	4.1	7.0	0.6
19	482	8,300	14.8	0	14.2	7	+2	20	12	6.3	14.3	1.0
	519	6,400	16.0	1	21.9	2	-	21	11	6.4	14.1	1.0
20	399	3,500	12.3	4	17.4	46	+2	20	15	3.9	12.1	0.4
	362	3,500	11.8	6	15.1	65	+2	22	18	4.1	13.3	0.5

* Before **After

Table 4-3 Clinical results of KBT-1585 on respiratory tract infection

Case No.	RBC ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	WBC	Hb	Eo. (%)	Platelet ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	ESR (60min.)	CRP	GOT	GPT	Al-P	BUN	Cr.
21	500*	7,300	15.2	0	22.2	58	+3	43	38	7.4	15.6	0.9
	607**	7,000	15.3	0	33.7	14	+1	25	28	5.4	16.1	0.8
22	415	7,600	12.9	1	46.1	23	+1	20	14	7.1	14.3	0.7
	411	5,600	12.6	0	37.7	17	-	18	12	6.5	12.6	0.7
23	420	5,800	12.8	1	28.3	27	+1	16	12	7.5	13.5	0.6
	410	4,000	12.8	3	23.2	15	-	12	10	7.5	12.8	0.6
24	599	20,700	18.5	0	21.9	81	+4	29	27	8.7	28.6	1.1
	563	8,800	16.7	1	27.2	4	-	29	28	7.5	14.1	0.7
25	480	5,000	14.2	0	20.7	17	+1	20	10	8.8	23.1	0.7
	496	5,500	14.7	2	24.9	3	-	32	23	9.9	21.6	0.8
26	538	14,800	16.2	0	37.0	43	+3	36	31	6.0	13.5	0.7
	448	6,500	13.6	2	34.4	80	+4	28	29	6.5	11.1	0.6
27	448	8,700	13.6	3	32.5	62	+5	14	13	12.2	17.6	1.0
	484	6,500	15.0	1	31.7	43	+2	14	14	7.0	15.1	1.0
28	419	7,500	12.5	8	27.0	20	+3	19	13	7.4	19.9	0.8
	393	5,400	12.3	3	25.0	5	-	19	16	8.4	18.0	0.7
29	452	5,500	13.9	1	29.0	15	+1	23	7	5.7	14.2	0.7
	411	5,200	13.2	1	28.1	6	-	20	11	6.6	12.8	0.7
30	445	9,800	11.1	5	26.6	51	+1	21	13	7.5	11.0	0.7
	435	3,300	10.9	2	27.5	17	-	15	20	8.7	10.3	0.7

* Before **After

Table 4-4 Clinical results of KBT-1585 on respiratory tract infection

Case No.	RBC ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	WBC	Hb	Eo. (%)	Platelet ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	ESR (60min.)	CRP	GOT	GPT	Al-P	BUN	Cr.
31	422*	9,400	13.1	1	19.3	32	+2	31	22	6.7	18.0	0.7
	416**	5,100	12.8	4	19.4	7	-	28	16	6.8	18.3	0.7
32	434	9,100	13.9	0	21.7	61	+3	15	14	5.5	8.5	0.6
	387	4,600	12.3	3	22.0	11	-	18	12	6.1	8.6	0.6
33	466	6,700	13.7	0	30.9	32	+2	20	19	7.6	14.3	0.6
	422	6,700	12.9	1	31.3	7	-	19	18	7.7	16.5	0.6
34	385	7,500	12.3	0	35.4	35	+2	33	28	8.3	15.2	0.7
	358	6,800	11.6	1	26.2	8	\pm	29	17	6.0	14.8	0.7
35	427	13,000	12.8	0	29.9	17	+1	15	10	7.1	9.4	0.6
	417	8,700	12.6	2	35.4	13	-	13	8	7.1	10.2	0.6
36	541	7,100	16.3	8	27.6	16	+3	22	13	7.3	12.0	0.7
	514	7,300	15.7	5	21.9	23	+3	12	10	6.4	4.8	0.6
37	553	5,100	16.6	0	19.0	38	+3	17	18	11.4	19.8	1.0
	548	8,800	16.3	0	23.5	68	+5	16	12	9.8	14.8	1.0
38	432	15,600	13.3	1	29.0	13	+1	16	15	9.1	15.2	0.8
	412	5,700	13.7	2	30.4	7	-	17	23	5.8	14.8	0.7
39	465	14,800	13.0	0	21.3	52	+4	12	8	6.0	12.1	0.6
	453	4,800	13.3	0	23.1	7	-	12	7	6.0	10.8	0.5
40	464	7,300	13.9	1	34.3	5	+3	20	14	5.5	9.3	0.6
	471	6,600	13.8	1	32.0	6	-	18	11	6.2	9.5	0.6

* Before **After

経口剤で90%の成績を上げ得るわけで、外来治療で充分であるといえる。KBT-1585のように吸収が改良されたものは血中濃度も5 $\mu\text{g/ml}$ 近くに上昇することから更に有用性を増したものと評価する。同様に喀痰内移行は従来のABPCと同様、血中濃度の5%程度であるが、血中濃度が高い分だけ喀痰内へも高濃度移行すると思われる。

副作用についても充分な検討が行なわれたが、我々の40例の中でrashを来したものが1例と軽度の消化器症

状を来したものが1例あったが重篤なものはない。1,780例のopen試験でも発疹が14例(0.8%)、消化器症状35例(2.0%)と低く、drug feverを来したものは1例もなかった。安全性の高いことが証明されたものと考えられる。

文 献

- 1) 第31回日本化学療法学会西日本支部総会, 新薬シンポジウムI, KBT-1585. 佐賀, 1983

CLINICAL STUDIES ON LENAMPICILLIN (KBT-1585) IN THE TREATMENT OF RESPIRATORY TRACT INFECTIONS

IZUMI HAYASHI and TATSUYA ABE

Department of Respiratory Diseases, Iwaki Kyoritsu General Hospital

Lenampicillin (KBT-1585) was administered to a total of 40 patients with respiratory tract infections including 11 cases of pneumonia, 18 cases of acute exacerbation of chronic bronchitis, 10 cases of acute bronchitis and one case of diffuse panbronchiolitis.

The drug was administered orally at a daily dose of one gram for 7 days (25 cases), 14 days (9 cases), 21 days (one case) and three days (one case), three days and one dose (one case), 4 days (two cases), 6 days and one dose (one case).

The following 25 potential pathogens were recovered from the sputum at a start of the treatment with KBT-1585 and four pathogens of *H. influenzae* which had β -lactamase were not eradicated during the treatment (eradication ratio=84%).

The clinical response to the treatment with KBT-1585 was excellent in 15 cases, good in 20 cases, fair in one case and poor in four cases (efficacy rate=87.5%).

A rash was observed in one case after four days of administration but it was so slight and eosinophilia and feeling of nausea were observed in one case each.

From the above results, it is concluded that KBT-1585 is one of effective and useful prodrug of ampicillin.