

Cefuroxime axetil (CXM-AX) の臨床的研究

青木 信樹・関 根 理・薄田 芳丸・湯浅 保子

信楽園病院内科

若林 伸人・林 静一・新田 功・田中富美子

信楽園病院薬剤科

渡辺 京子

信楽園病院検査科

呼吸器感染症 26 例, 尿路感染症 2 例, 計 28 例の感染症例に Cefuroxime axetil (CXM-AX) を使用した。対象は 18 歳から 80 歳 (平均 59.8 歳) までの男性 11 例, 女性 17 例で, 呼吸器感染症は 250 ないし 500 mg 1 日 3 回, 尿路感染症は 250 mg 1 日 3 回の内服とし, 期間は 3~14 日, 総使用量は 2.25~21.0 g であった。

臨床効果は著効 1, 有効 18, やや有効 2, 無効 3, 判定除外 4 であった。臨床的な副作用として下痢が 1 例にみられ, 検査成績上, 好中球減少を 1 例に認めたが, いずれも軽度で治療終了後まもなく改善した。

Cefuroxime axetil (CXM-AX) は英国 Glaxo 社で開発された経口用セファロsporin系抗生物質で, 経口使用によりほとんど吸収されなかった Cefuroxime (CXM) の 1-acetoxyethyl ester 誘導体である。本剤はそれ自体にほとんど抗菌作用はないが, 内服後腸管内で脱エステル化されて Cefuroxime として吸収され抗菌作用を発揮する。

Cefuroxime は β -lactamase に安定であるため, 第 1 世代 Cephem 剤で効果が期待できなかった *E. coli*, *Klebsiella* の Cephalosporin 耐性株や *Citrobacter*, *Enterobacter*, *Proteus* (Indole positive) にも抗菌活性を示し, 又, *H. influenzae* や *N. gonorrhoeae* に対しても第 1 世代 Cephem 剤に比して優れている^{1,2,3)}。抗菌スペクトルの拡大とともに, 内服した際の腸管からの吸収, 各組織への移行も比較的良好であることから^{4,5,6)}, 各科領域の感染症に対する有用性が期待される。

われわれは 28 例の感染症例に本剤を使用する機会を得たのでその成績を報告する。

I. 対象と方法

1. 対象

対象患者は昭和 59 年 9 月から昭和 60 年 5 月までの間に信楽園病院において外来あるいは入院治療を行なった 28 例で, 男性 11 例, 女性 17 例, 年齢は 18 歳から 80 歳までである。

呼吸器疾患の内訳は, 急性気管支炎, 肺炎各 2 例, 慢

性気管支炎の急性増悪, 肺気腫二次感染, 陳旧性肺結核に感染をきたしたものがそれぞれ 3 例, 気管支喘息混合感染 4 例, 気管支拡張症二次感染 7 例, 肺線維症に気道感染を伴ったもの, 肺癌二次感染各々 1 例である。尿路感染症 2 例は, 1 例が尿管結石症に伴う感染, 1 例は多発性脳梗塞発症後, 膿尿の出現をみたものであった。

起因菌は呼吸器感染症 26 例中 13 例で判明した。*S. pneumoniae* が気管支拡張症例 1 例から, *B. catarrhalis* が慢性気管支炎例 2 例より, *K. pneumoniae* が肺気腫例, 気管支拡張症例各 1 例から, *H. influenzae* が急性気管支炎例 1 例と慢性気道感染症例 5 例より, *P. aeruginosa* が陳旧性肺結核症例 1 例から分離された。複数菌感染例として肺気腫の 1 例から *H. influenzae* と *K. pneumoniae* が検出された。尿路感染症 2 例の起因菌はいずれも *K. pneumoniae* であった。

2. 使用法, 使用量

全例原則として食後内服を行ない, 呼吸器感染症では 250 mg 1 日 3 回服用したもの 11 例, 500 mg 3 回使用したもの 15 例で, 尿路感染症 2 例には 250 mg を 1 日 3 回使用した。治療期間は症例 18 と 27 の 3 日が最短, 症例 14 と 19 の 14 日が最長で, 総使用量は症例 18, 27 の 2.25 g が最少, 症例 14 の 21.0 g が最多であった。

3. 効果判定基準

原因菌の判明している場合はその動向を加味し, 臨床経過と検査所見の経過から, 著効 (Excellent), 有効

Table 1-1 Clinical results of CXM-AX

Case	Age Sex	B.W. (kg)	Diagnosis Underlying disease & Complication	Isolated* organism	Administration			B.T.* (°C)	ESR* (mm/h)	CRP* (mm ³)	WBC* (mm ³)	Evaluation		Remarks
					Daily dose (mg)	Duration (days)	Total dose(g)					Bact.	Clinical	
1. K.K.	51 F	59	Act. bronchitis Hypertension	N.D. N.D.	500×3	7	10.5	<37.0 <37.0	8 7	- 7	5,600 5,800	Unknown	Undetermined	
2. M.H.	18 F	?	Act. bronchitis (-)	○ <i>H. influenzae</i> (-)	250×3	5	3.75	>37.0 <37.0	? ?	2+ ±	7,900 6,700	Eradicated	Excellent	
3. M.W.	25 F	63	Pneumonia (-)	N.D. N.D.	250×3	7	5.25	38.2 37.6	68 35	4+ 2+	7,100 11,500	Unknown	Undetermined	MPCF ↑ DOXY effective
4. N.S.	35 F	47	Pneumonia (-)	<i>S. aureus</i> N.F.	500×3	7	10.5	37.0 <37.0	51 11	3+ -	5,200 7,200	Unknown	Undetermined	MPCF ↑
5. S.H.	77 F	55	Chr. bronchitis Chr. hepatitis & Chr. nephritis	○ <i>H. influenzae</i> N.F.	500×3	7	10.5	>37.0 <37.0	37 35	1+ -	6,700 5,000	Eradicated	Good	
6. I.A.	80 F	42	Chr. bronchitis Chr. hepatitis & Cholelithiasis	○ <i>B. catarrhalis</i> N.F.	500×3	7	10.5	<37.0 <37.0	13 5	1+ -	3,900 3,100	Eradicated	Good	
7. I.A.	80 F	40	Chr. bronchitis Chr. hepatitis & Cholelithiasis	○ <i>B. catarrhalis</i> <i>B. catarrhalis</i>	250×3	7	5.25	37.3 <37.0	16 7	±(1+) -	4,800 3,400	Persisted	Good	Neutro. ↓
8. H.W.	62 M	48	Br. asthma + Inf. Pulm. emphysema	○ <i>H. influenzae</i> <i>H. influenzae</i>	250×3	7	5.25	<37.0 <37.0	7 5	± -	10,800 7,200	Persisted	Good	
9. K.K.	57 F	?	Br. asthma + Inf. Pulm. emphysema	N.F. N.F.	250×3	7	5.25	<37.0 <37.0	6 10	± -	7,200 5,900	Unknown	Good	
10. K.H.	75 M	?	Br. asthma + Inf. Old tbc. & Prostate hypertrophy	○ <i>H. influenzae</i> <i>H. influenzae</i> ↓	250×3	7	5.25	>37.0 <37.0	42 22	6+ 1+	13,900 9,000	Decreased	Good	
11. K.H.	75 M	?	Br. asthma + Inf. Old tbc. & Prostate hypertrophy	N.F. N.F.	500×3	7	10.5	>37.0 <37.0	55 26	3+ ±	8,200 5,900	Unknown	Good	

(○ : Causative organism, * : Before therapy, * : After therapy, N.F. : Normal flora, N.D. : Not done)

Table 1-2 Clinical results of CXM-AX

Case	Age Sex	B.W. (kg)	Diagnosis Underlying disease & Complication	Isolated* organism	Administration			R.T.* (°C)	ESR* (mm/h)	CRP*	WBC* (/mm ³)	Evaluation		Remarks.
					Daily dose (mg)	Duration (days)	Total dose(g)					Bact.	Clinical	
12. S.A.	64 M	?	Pulm. emphysema + Inf. DM	N.F. N.F.	500 × 3	7	10.5	>37.0 <37.0	16 5	2+ -	8,600 7,200	Unknown Good	Good	
13. M.A.	70 M	52	Pulm. emphysema + Inf. RA & Prostate hypertrophy	○ <i>H. influenzae</i> ○ <i>K. pneumoniae</i> <i>H. influenzae</i> <i>K. pneumoniae</i>	250 × 3	7	5.25	<37.0 <37.0	52 62	3+ 2+	9,000 9,800	Persisted Persisted	Poor	
14. M.A.	71 M	?	Pulm. emphysema + Inf. RA & Prostate hypertrophy	○ <i>K. pneumoniae</i> <i>K. pneumoniae</i>	500 × 3	14	21.0	<37.0 <37.0	58 37	2+ 1+	9,300 11,800	Persisted Persisted	Fair	
15. Y.H.	54 F	37	Bronchiectasis + Inf. (-)	<i>E. cloacae</i> N.F.	500 × 3	7	10.5	37.6 <37.0	59 17	3+ ±	8,400 4,200	Unknown Eradicated	Good	
16. H.H.	44 F	45	Bronchiectasis + Inf. (-)	○ <i>S. pneumoniae</i> (-)	500 × 3	7	10.5	38.5 <37.0	60 20	4+ ±	10,400 ?	Unknown Eradicated	Good	
17. T.M.	68 F	?	Bronchiectasis + Inf. Hypertension	N.F. N.F.	250 × 3	7	5.25	37.1 <37.0	10 4	± -	9,100 7,100	Unknown Persisted	Good	PIP effective
18. K.K.	62 F	45	Bronchiectasis + Inf. Heart failure	○ <i>H. influenzae</i> <i>H. influenzae</i>	250 × 3	3	2.25	38.5 37.2	80 ?	5+ 5+	8,700 8,800	Persisted Decreased	Poor	
19. T.K.	76 M	57	Bronchiectasis + Inf. Pulm. fibrosis & DM	○ <i>K. pneumoniae</i> <i>K. pneumoniae</i> ↓	250 × 3	14	10.5	<37.0 <37.0	59 41	1+ ±	6,800 7,100	Decreased Unknown	Fair	
20. M.H.	54 F	?	Bronchiectasis + Inf. (-)	<i>S. aureus</i> <i>S. aureus</i>	250 × 3	7	5.25	>38.0 <37.0	22 24	2+ ±	4,000 3,200	Unknown Unknown	Good	
21. K.K.	63 F	?	Bronchiectasis + Inf. Heart failure	○ <i>H. influenzae</i> N.D.	500 × 3	7	10.5	>37.0 <37.0	? ?	2+ ?	9,600 ?	Unknown Unknown	Good	
22. C.I.	69 F	45	Old tbc + Inf. Heart failure	○ <i>P. aeruginosa</i> <i>P. aeruginosa</i>	500 × 3	7	10.5	>37.0 >37.0	13 25	± ±	8,200 9,300	Persisted Persisted	Poor	

(○ : Causative organism, * : Before therapy, (-) : Normal flora, N.D. : Not done)
 (-) : After therapy

Table 1-3 Clinical results of CXM-AX

Case	Age Sex	B.W. (kg)	Diagnosis Underlying disease & Complication	Isolated* organism	Administration			B.T.* (°C)	ESR* (mm/h)	CRP*	WBC* (/mm ³)	Evaluation		Remarks.
					Daily dose (mg)	Duration (days)	Total dose(g)					Bact.	Clinical	
23. Y. I.	58 M	58	Old tbc + Inf. (-)	N.F. N.D.	500 × 3	6	9.0	<37.0 <37.0	6 8	2+ -	11,400 5,200	Unknown Good	Good Diarthea	
24. R. I.	59 M	55	Old tbc + Inf. Hypertension & Prostate hypertrophy	<i>K. pneumoniae</i> <i>K. pneumoniae</i>	500 × 3	7	10.5	>37.0 <37.0	30 20	2+ ±	11,500 11,700	Unknown Good	Good	
25. S. H.	75 F	?	Pulm. fibrosis + Inf. OMI & Hypertension	N.D. N.D.	500 × 3	7	10.5	<37.0 <37.0	37 ?	± -	6,000 5,500	Unknown Undetermined		
26. K. N.	64 M	49	Lung cancer + Inf. Old tbc & Hypertension	N.F. <i>E. cloacae</i>	500 × 3	7	10.5	38.8 <37.0	27 30	2+ -	4,700 7,100	Unknown Good	Good	
27. U. I.	48 F	53	U.T.I. CVD & Chr. hepatitis	○ <i>K. pneumoniae</i> >10 ⁷ /ml <i>S. epidermidis</i> <10 ³ /ml	250 × 3	3	2.25	37.2 <37.0	11 11	± -	4,300 4,100	Eradicated Good	Good	
28. M. N.	41 M	56	U.T.I. Urolithiasis & Chr. hepatitis	○ <i>K. pneumoniae</i> 10 ⁷ /ml <i>S. epidermidis</i> <i>E. faecalis</i> <10 ³ /ml	250 × 3	5	3.75	>37.0 <37.0	? ?	± -	9,100 8,400	Eradicated Good	Good	

(○ : Causative organism, * : — Before therapy, * : — After therapy, N.F. : Normal flora, N.D. : Not done)

Table 2-1 Laboratory findings before and after CXM-AX therapy

Case	Total dose(g)	BUN (mg/dl)	Cr (mg/dl)	GOT (I.U.)	GPT (I.U.)	Al-P (I.U.)	T. Bil (mg/dl)	Ht (%)	Platelet (10 ⁴ /mm ³)	WBC (/mm ³)	Neutro. (%)	Eosino. (%)	Coombs
1. K.K.	10.5	B 10	0.7	26	23	161		45.0	14.2	5,600	44	7	
		A 16	0.6	16	17	134		42.5	13.2	5,800	42	5	
2. M.H.	3.75	B 12	0.7	13	3	182	0.3	39.5	20.1	7,900	71	1	(-)
		A 12						34.0	18.8	6,700	66	4	(-)
3. M.W.	5.25	B 9	0.4	42	65	151	0.3	40.0	13.8	7,100	80	0	(-)
		A 9						38.5	32.1	11,500	75	1	(-)
4. N.S.	10.5	B 9	0.5	14	12	128	0.1	42.5	23.9	5,200	58	7	(-)
		A 10	0.6	13	11	107	0.1	39.0	42.6	7,200	44	3	(-)
5. S.H.	10.5	B 10	0.7	75	83	201	0.6	47.0	11.1	6,700	61	1	(-)
		A 9	0.7	107	103	199	0.4	47.0	11.3	5,000	45	3	(-)
6. I.A.	10.5	B 23	0.6	29	17	155	0.5	42.0	19.4	3,900	49	2	(-)
		A 13	0.6	37	17	136	0.3	42.0	14.9	3,100	30	7	(-)
7. I.A.	5.25	B 18	0.6	33	12	148	0.2	40.5	12.0	4,800	51	0	(-)
		A 18						42.0	15.9	3,400	23	5	(-)
8. H.W.	5.25	B 16	1.0	17	12	184	0.4	47.0	22.2	10,800	80	5	(-)
		A 17	0.7	19	11	157	0.1	46.0	24.1	7,200	76	1	(-)
9. K.K.	5.25	B 16	0.6	25	11	243	0.2	44.5	25.7	7,200	66	1	(-)
		A 16						42.5	21.6	5,900	55	4	(-)
10. K.H.	5.25	B 18	1.0	17	12	144	0.8	46.5	19.2	13,900	84	0	(-)
		A 23	0.9	21	15	123	0.2	43.0	27.5	9,000	66	1	(-)
11. K.H.	10.5	B 16	0.7	26	13	146	0.2	44.0	23.0	8,200	70	0	(-)
		A 15	0.8	27	14	148	0.2	44.0	30.7	5,900	56	1	(-)
12. S.A.	10.5	B 9	0.6	21	24	208	0.4	44.0	27.0	8,600	66	2	(-)
		A 9	0.6	23	20	203	0.3	44.5	24.9	7,200	60	2	(-)
13. M.A.	5.25	B 16	0.4	13	8	182	0.3	40.0	26.5	9,000	76	5	(-)
		A 18	0.5	12	5	178	0.2	42.0	27.7	9,800	78	4	(-)
14. M.A.	21.0	B 9	0.5	13	5	180	0.4	41.5	43.5	9,300	78	0	(-)
		A 15	0.6	26	20	186	0.5	44.0	36.2	11,800	86	0	(-)

B : Before therapy

A : After therapy

Table 2-2 Laboratory findings before and after CXM-AX therapy

Case	Total dose(g)	BUN (mg/dl)	Cr (mg/dl)	GOT (I.U.)	GPT (I.U.)	Al-P (I.U.)	T. Bil (mg/dl)	Ht (%)	Platelet ($10^4/mm^3$)	WBC ($/mm^3$)	Neutro. (%)	Eosino. (%)	Coombs
15. Y.H.	10.5	29	0.3	19	13	191	0.2	35.5	35.6	8,400	82	0	(-)
	A	22	0.3	20	13	189	0.1	37.5	35.8	4,200	44	3	(-)
16. H.H.	10.5							34.5		10,400	89	0	
	A												
17. T.M.	5.25	17	0.4	14	8	224	0.5	43.5	25.5	9,100	62	3	
	A	13	0.4	22	6	187	0.4	37.5	21.8	7,100	68	7	(-)
18. K.K.	2.25	13	0.3	15	3	159	0.3	39.0	24.3	8,700	76	0	(-)
	A							41.5	24.4	8,800	77	1	(-)
19. T.K.	10.5	14	0.7	14	9	163	0.2	41.0	20.3	6,800	55	0	(-)
	A	14	0.8	16	10	161	0.2	39.0	20.0	7,100	69	2	(-)
20. M.H.	5.25	14	0.4	17	14	176	0.5	39.0	10.8	4,000	54	2	(-)
	A							40.5	12.5	3,200	37	2	(-)
21. K.K.	10.5	10	0.4	13	2	184	0.2	40.0	36.3	9,600	79	1	(-)
	A												
22. C.I.	10.5	21	0.7	22	21	130	0.3	43.0	18.3	8,200	75	0	(-)
	A	17	0.4	22	15	130	0.1	42.0	18.1	9,300	80	0	(-)
23. Y.I.	9.0	10	0.9	27	21	130		46.0		11,400	85	0	(-)
	A	13	0.8	35	28	142		44.5	22.4	5,200	63	0	(-)
24. R.I.	10.5	12	0.5	18	13	169	0.3	41.0	19.7	11,500	66	1	(-)
	A	9	0.5	22	16	167	0.1	43.0	35.4	11,700	60	1	(-)
25. S.H.	10.5	16	0.6	11	6	144		36.0	28.7	6,000	68	1	
	A	17	0.6	17	9	134	0.3	35.0	28.0	5,500	72	2	
26. K.N.	10.5	14	0.7	18	4	174	0.3	41.0	14.9	4,700	81	0	(-)
	A	14	0.6	14	6	165	0.1	44.5	28.6	7,100	73	2	(-)
27. U.I.	2.25	16	0.3	63	24	163	0.3	34.0		4,300	65	5	(-)
	A	14	0.4	31	14	149	0.4	37.0	16.0	4,100	60	4	(-)
28. M.N.	3.75	14	0.6	50	47	172	0.6	45.0	33.7	9,100	50	2	(-)
	A	19	0.7	179	166	277	0.4	46.0	27.5	8,400	41	5	(-)

B : Before therapy
A : After therapy

Table 3 Overall clinical efficacy of CXM-AX

	No. of cases	Global judgement					Overall effectiveness (%)
		Excellent	Good	Fair	Poor	Undetermined	
RTI	26	1	16	2	3	4	17/22(77.3)
Act. bronchitis	2	1				1	1/1
Pneumonia	2					2	
COPD with infection	20		15	2	3		15/20(75.0)
Others	2		1			1	1/1
UTI	2		2				2/2 (100.0)
Total	28	1	18	2	3	4	19/24(79.2)

(Good), やや有効 (Fair), 無効 (Poor) と判定した。本剤による治療の適応でなかったと考えられるもの, 他の抗菌剤, 消炎剤などの併用が行なわれたものは, 判定不能 (Undetermined) とした。

4. 副作用の検討

服用による悪心, 嘔吐, 下痢, 発熱, 発疹など臨床的な副作用の発現に留意した。治療前後の検査成績から, 腎, 肝, 骨髄機能への影響をみた。腎機能については血清尿素窒素 (BUN) およびクレアチニン (Cr), 肝機能に関してはアルカリフォスファターゼ (Al-P), トランスアミナーゼ (GOT, GPT) および総ビリルビン, 骨髄機能については末梢血ヘマトクリット (Ht), 血小板数 (Platelet), 白血球数 (WBC), 好中球百分比 (Neutro), それに全身の過敏症状に関しては末梢血好酸球百分比 (Eosino) を指標とし, 直接タームス試験も可能な限り行なった。

II. 成績

1. 臨床効果 (Table 1, 3)

全体で著効 1 例, 有効 18 例, やや有効 2 例, 無効 3 例, 判定不能 4 例の結果で有効率は 79.2% であった。

呼吸器感染症では著効 1, 有効 16, やや有効 2, 無効 3, 判定不能 4 例であった。

著効の症例 2 は *H. influenzae* が分離された急性気管支炎例で, 本剤使用 1 日後には平熱となり 3 日後には咳嗽, 膿性痰は全く消失し, 起原因菌の消失もみた。症例 5, 6 は慢性気管支炎の急性増悪例で, それぞれ喀痰より *H. influenzae*, *B. catarrhalis* が検出され, 本剤 500 mg 1 日 3 回の内服により臨床症状の改善, 菌消失を得, 有効とした。症例 7 は症例 6 と同一症例で, やはり *B. catarrhalis* が分離され, 250 mg 1 日 3 回と症例 6 の半量を使用したところ, 臨床症状の改善はみたまもの, 菌の消失は得られなかった。症例 8~11 は気管支喘息に気道

感染を合併したもので, いずれも有効であった。症例 8 と 10 で *H. influenzae* が検出されたが, 前者では不変, 後者では減少にとどまった。いずれも 250 mg 1 日 3 回の使用であった。症例 16 は *S. pneumoniae* による気管支拡張症二次感染例で, 本剤内服後直ちに平熱となり, 喀痰も 7 日後には全く消失した。治療終了時の臨床検査がなされていないが著効とも言い得る症例であった。症例 21 も気管支拡張症例で, 喀痰から *H. influenzae* が分離され 500 mg 1 日 3 回の内服で有効であった。

無効の症例 13 は安静時でも常時呼吸困難が存在する高度の肺気腫例で, *H. influenzae* と *K. pneumoniae* が検出されたため本剤 250 mg を 1 日 3 回使用したが効果がみられなかった。症例 14 は 13 と同一症例で, およそ 2 ヶ月後に *K. pneumoniae* による再度の気道感染をきたし, 500 mg 3 回と増量して 14 日間使用してみたが, 臨床症状の軽度改善が得られたにとどまり, *K. pneumoniae* は存続した。症例 18 は心不全を伴う極めて高度の気管支拡張症例で, *H. influenzae* が分離され, Amoxicillin が無効で, 本剤 250 mg 1 日 3 回に変更したが無効であった。症例 22 は高度の胸膜癒着と気管支の拡張化を伴う陳旧性肺結核症例で, 微熱, 膿性痰が持続し本剤を使用した効果が得られなかった。後に起原因菌が *P. aeruginosa* と判明し, 本剤の適応ではなく効果判定を除外すべき症例であった。

判定不能例は 4 例である。症例 3 と 4 はマイコプラズマ肺炎と考えられた。症例 1, 25 は感染を思わせる症状, 所見, 検査成績が乏しく, 判定を除外した。

使用量別に臨床効果をみると 250 mg 1 日 3 回使用例は 11 例で, 判定不能の 1 例を除くと 70.0% の有効率であった。一方 500 mg 1 日 3 回使用の 15 例では評価可能 12 例の有効率は, 83.3% であった。

尿路感染症の 2 例はいずれも *K. pneumoniae* が起因

菌で本剤 250 mg 1日3回の内服で臨床症状の改善、菌消失をみ、有効であった。

疾患別の効果をみると Table 3 のごとく、有効以上の有効率は呼吸器感染症 77.3%、尿路感染症 100%、全体で 79.2% と高いもので、慢性気道感染症においても 20 例中 15 例有効で 75.0% の有効率であった。

起因菌判明 15 例の細菌学的効果は消失 6、減少 2、存続 6、不明 1 で、除菌率は 42.9% であった。*S. pneumoniae* 1 株は消失、*P. aeruginosa* 1 株は存続した。*H. influenzae* 7 株は消失 2、減少 1、存続 3、不明 1、*B. catarrhalis* 2 株は消失、存続各 1、*K. pneumoniae* 5 株は消失 2、減少 1、存続 2 という結果であった。

呼吸器感染症の使用量別の細菌学的効果をみると、起因菌判明例のうち 250 mg 1日3回内服例は 7 例で、消失 1、減少 2、存続 4 と除菌率は 14.3% と低く、500 mg 3回内服 6 例では不変の *P. aeruginosa* を含めても消失 3、存続 2、不明 1 と 60.0% の除菌率であった。

2. 副作用 (Table 1, 2)

臨床的には 1 例 (症例 23) で本剤使用 4 日目より下痢の出現をみたが、治療中止 2 日後には改善した。検査成績上は好中球減少が 1 例 (症例 7) でみられたが軽度なものであった。症例 3, 5, 28 で GOT, GPT の上昇をみているが、症例 5, 28 は基礎疾患 (慢性肝炎) によるものと考えられ、症例 3 は治療前の検査がなされておらず、マイコプラズマ感染による可能性もあり、本剤との因果関係は不明である。

III. 考 考

呼吸器感染症 26 例、尿路感染症 2 例に使用した結果は著効 1、有効 18、やや有効 2、無効 3、判定除外 4 で、判定除外例を除くと有効率は 79.2% であり、呼吸器感染症では 77.3%、尿路感染症 100% と比較的高いものであり、慢性気道感染症においても 75.0% であった。

本剤は腸管からの吸収が良好で、比較的高い血中濃度の維持が可能であり、喀痰中移行も同系薬剤としては優れている^{4,5,6)}。又、第 1 世代 Cephem 剤に比し Gram 陰性菌に対する抗菌スペクトルが拡大されているが、これらの特徴と、比較的軽症な症例を選択したこともあって、高い有効率が得られたものと考えられる。とはいつても本来 Cephem 剤の喀痰中移行はそれ程優れているのではなく、本剤も 500 mg 内服でも最高 0.46 $\mu\text{g}/\text{ml}$ 程度と報告されている⁶⁾。加うるに Gram 陰性菌に対

する抗菌力も際だったものではない。したがって明確な臨床効果、細菌学的効果を期待するには使用量が充分であることが必要であろう。われわれの症例においては 250 mg 1日3回の使用の際の除菌率は 14.3% と低く、500 mg 3回のそれが 60.0% で、明らかな差を認めた。とくに、慢性気道感染症においては 250 mg 1日3回の使用では有効喀痰中濃度の維持は困難である可能性があり、500 mg 3回あるいはそれ以上の使用が無難と考えられる。

副作用としては下痢が 1 例に、検査成績上は好中球減少が 1 例にみられたが、いずれも軽度なもので本剤中止後まもなく改善をみた。内服剤としては副作用が少なく、臨床検査値の異常も重大なものがみられなかったりことから、比較的 안전한 使用が可能 な 薬剤 とい う こと が できる。抗菌スペクトルの拡大と併せ、対象に応じて使用量を配慮すれば、内服剤としてかなりの有用性が期待できよう。又、本剤の腸管からの吸収が、空腹時よりも食後がむしろ優れている点^{4,6)}も、食後服用の習慣のある本邦においては、有用性を高めることになろう。

文 献

- 1) 五島瑛智子：第 33 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。Cefuroxime axetil (SN 407)、大阪、1985
- 2) 中川圭一：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
- 3) GREENWOOD, D.; N. J. PEARSON & F. O'GRADY: Cefuroxime: A new cephalosporin antibiotics with enhanced stability to enterobacterial β -lactamases. *J. Antimicrob. Chemother.* 2: 337~343, 1976
- 4) WILLIAMS, P. E. O. & S. M. HARDING: The absolute bioavailability of oral cefuroxime axetil in male and female volunteers after fasting and after food. *J. Antimicrob. Chemother* 13: 191~196, 1984
- 5) HARDING, S. M.; P. E. O. WILLIAMS & J. AYRTON: Pharmacology of cefuroxime as the 1-acetoxyethyl ester in volunteers. *Antimicrob. Agents & Chemother.* 25: 78~82, 1984
- 6) 大泉耕太郎：第 33 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。Cefuroxime axetil (SN 407)、大阪、1985
- 7) 渡辺 彰：第 33 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。Cefuroxime axetil (SN 407)、大阪、1985

CLINICAL STUDY ON CEFUROXIME AXETIL (CXM-AX)

NOBUKI AOKI, OSAMU SEKINE, YOSHIMARU USUDA and YASUKO YUASA
Department of Internal Medicine, Shinrakuen Hospital

NOBUTO WAKABAYASHI, SEIICHI HAYASHI, ISAO NITTA and FUMIKO TANAKA
Department of Pharmacy, Shinrakuen Hospital

KYOKO WATANABE
Department of Clinical Laboratory, Shinrakuen Hospital

A new oral cephem antibiotic, cefuroxime axetil (CXM-AX) was administered to total 28 patients consisting of 26 with respiratory tract infections and 2 with urinary tract infections, and its efficacy and safety were studied. The study was carried out from September, 1984 to May, 1985. The patients consisted of 11 adult males and 17 adult females in this study. The mean age of the total patients was 57.5 years (range : 18-80).

CXM-AX was given three times a day at a dose of 250 mg or 500 mg in the patients with respiratory tract infections and at a dose of 250 mg in the patients with urinary tract infections. The duration of therapy ranged from 3 to 14 days, the total dose ranged from 2.25 to 21.0 g.

The therapeutic effect was "Excellent" in 1 patient, "Good" in 18, "Fair" in 2, "Poor" in 3, "undetermined" in 4, with a high effectiveness rate of 79.2%. As an adverse event, diarrhea was observed in one patient. Laboratory tests revealed decrease in neutrophil in one case. however, these symptom and finding were mild and no severe side effects caused by the drug were observed.