

## 尿路・性器感染症に対する Cefuroxime axetil (CXM-AX) の基礎的・臨床的検討

小野寺昭一・町田豊平・清田 浩・後藤博一

東京慈恵会医科大学泌尿器科学教室

斎藤賢一

国立大蔵病院泌尿器科

岡崎武二郎

都立台東病院泌尿器科

Cefuroxime の 1-acetoxyethyl ester 誘導体である Cefuroxime axetil (CXM-AX, SN 407) について基礎的・臨床的検討を行った。

基礎的検討では、臨床分離淋菌 50 株に対する Cefuroxime (CXM) の抗菌力を Penicillin G (PCG), Tetracycline (TC), Norfloxacin (NFLX) と比較検討した。その結果、CXM の non-PPNG に対する抗菌力は、NFLX より劣ったが PCG, TC より 1 管～2 管程度優れていた。PPNG に対しては、PCG, TC が高い MIC 値を示したのに対し、NFLX, CXM は、non-PPNG に対する MIC 値と同程度で優れた抗菌力を示した。

臨床的検討は、21 例の尿路感染症と 21 例の淋菌性尿道炎、それに 1 例の急性前立腺炎を対象として行った。

尿路感染症に対する CXM-AX の有効率は急性単純性膀胱炎 16 例で 100%、慢性複雑性膀胱炎 5 例で 25% であった。このうち UTI 薬効評価可能な症例は、急性単純性膀胱炎 12 例、慢性複雑性膀胱炎 2 例であったが、急性単純性膀胱炎に対しては総合有効率 100%、慢性複雑性膀胱炎に対しては無効であった。

淋菌性尿道炎 21 例に対しては、著効 6 例、有効 15 例で 100% の有効率であり、急性前立腺炎の 1 例に対しても有効で、性器感染症に対して CXM-AX の優れた有効性が示された。

自覚的に問題となる副作用はみられず、安全性については従来の経口用セフェム剤と同程度と考えられた。

Cefuroxime axetil (CXM-AX, SN 407) は新しい経口用セフェム系抗生剤で、その構造式は Fig. 1 に示すとおりである。

本剤はそれ自体にほとんど抗菌作用はないが、経口投与された CXM-AX は腸管内で脱エステル化されて Cefuroxime (CXM) として吸収され抗菌作用を発揮するとされている。

Cefuroxime はすでに、第 2 世代のセフェム系注射剤として臨床的に使用されており、その広い抗菌力と  $\beta$ -lactamase に対する安定性は良く知られている。従って本剤は従来の経口用セフェム剤では効果の得られない菌種による感染症に対しても優れた有用性を示すことが期待されている。

今回われわれは、CXM-AX を泌尿器科領域の感染症に投与しその臨床効果について検討するとともに、最近

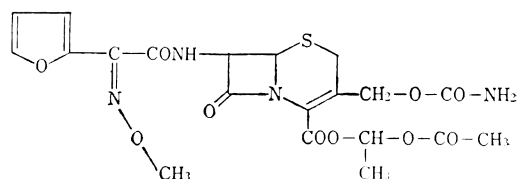
増加の著しい淋菌性尿道炎を対象として基礎的・臨床的検討を行った。

### I. 対象と方法

#### 1. 細菌学的検討

細菌学的検討に用いた淋菌は、1985 年 3 月より 5 月までの 3 か月間に、東京慈恵会医科大学泌尿器科およびその関連施設の淋病患者より分離された淋菌 50 株であ

Fig. 1 Chemical structure of CXM-AX



る。これら 50 株について、Penicillin G (PCG), Tetracycline (TC), Norfloxacin (NFLX), および CXM の最小発育阻止濃度 (MIC) を測定し、同時に  $\beta$ -lactamase 活性の測定も行った。

淋菌は、患者の尿道分泌物を MTM 培地<sup>2)</sup>に、前尿沈査を GC 培地に接種分離し、グラム染色、オキシダーゼ反応試験、糖分解能試験を行い同定した。分離同定された淋菌は、20% グリセリンバッファーを用いて、-20°C で冷凍保存した。

MIC の測定は、10% 馬血液加 GC 培地を使用した平板希釈法で行い接種菌量は  $10^6$  cells/ml とし、37°C 48時間ローック培養後の MIC 値を求めた。

$\beta$ -lactamase 活性の測定は Cephalosporin 87/312 (Glaxo) を使用した変色基質法の変法<sup>3)</sup> およびヨウ素澱粉反応法の変法<sup>4)</sup> を行い、この 2 方法ともに陽性を示した株を  $\beta$ -lactamase 活性陽性とした。

2. 臨床的検討

1) 対象

対象症例は、1985 年 1 月より同 5 月までに東京慈恵会医科大学泌尿器科およびその関連病院に入院または外来を受診した 43 例の尿路・性器感染症患者である。その内訳は、急性単純性膀胱炎 16 例、慢性複雑性膀胱炎 5 例、淋菌性尿道炎 21 例、急性前立腺炎 1 例である。

2) 投与方法

投与方法は、原則として急性単純性膀胱炎に対しては、1 回 250 mg を 1 日 3 回、3 日間投与、慢性複雑性膀胱炎に対しては 1 回 500 mg を 1 日 3 回、5 日間投与、淋菌性尿道炎に対しては 1 回 500 mg を 1 日 3 回、3 日間投与としたが、症例によっては投与量、あるいは投与日数が多少変動した。

3) 効果判定

尿路感染症に対する効果の判定は、UTI 薬効評価基準 (第 2 版)<sup>5)</sup> に準じて行い、あわせて主治医判定も行った。

淋菌性尿道炎の臨床効果の判定は、淋菌の消長を第一とし、そのほか自覚的所見として前尿中白血球、尿道分泌物、尿道症状 (排尿痛、尿道掻痒感) の推移を指標とした。

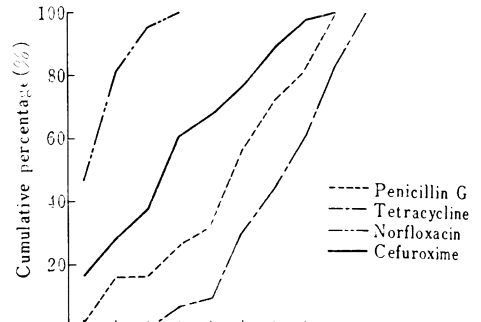
判定日に淋菌が消失し、自覚的所見が正常化したものを著効 (Excellent)、淋菌は消失したが、自覚的所見が完全には正常化しなかったものを有効 (Good)、淋菌が消失しなかったものを無効 (Poor) とした。

II. 成績

1. 細菌学的検討

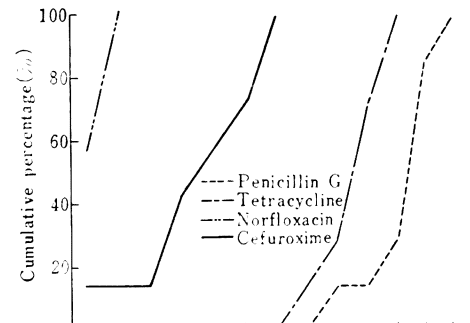
臨床分離淋菌 50 株のうち  $\beta$ -lactamase 活性測定で陽性を示した  $\beta$ -lactamase 産生淋菌 (PPNG ; penicilli-

Fig. 2 Susceptibility of non-PPNG 43 strains to Penicillin G, Tetracycline, Norfloxacin and Cefuroxime ( $10^6$  cells/ml)



MIC ( $\mu$ g/ml)	$\leq 0.0125$	0.025	0.05	0.1	0.2	0.4	0.8	1.6	3.13	6.25	12.5	25	50
Penicillin G	1	6		4	3	10	7	4	8				
Tetracycline				3	1	9	6	7	10	7			
Norfloxacin	20	15	6	2									
Cefuroxime	7	5	4	10	3	4	5	4	1				

Fig. 3 Susceptibility of PPNG 7 strains to Penicillin G, Tetracycline, Norfloxacin and Cefuroxime ( $10^6$  cells/ml)



MIC ( $\mu$ g/ml)	$\leq 0.0125$	0.025	0.05	0.1	0.2	0.4	0.8	1.6	3.13	6.25	12.5	25	50
Penicillin G									1		1	4	1
Tetracycline								1	1	3	2		
Norfloxacin	4	3											
Cefuroxime	1			2	1	1	2						

nase producing *Neisseria gonorrhoeae* は 7 株 (14%) であり、43 株は non-PPNG であった。

Non-PPNG 43 株に対する PCG, TC, NFLX, CXM の MIC 累積分布を Fig. 2 に示した。

各薬剤毎の MIC のピークは、PCG が  $0.4 \mu$ g/ml, TC が  $3.13 \mu$ g/ml, NFLX が  $\leq 0.0125 \mu$ g/ml, CXM が  $0.1 \mu$ g/ml にあり、NFLX が最もすぐれ、ついで CXM, PCG, TC の順であった。

PPNG 7 株に対する 4 剤の MIC 分布を Fig. 3 に示した。PCG, TC の両薬剤の MIC は、 $1.6 \mu$ g/ml から  $50 \mu$ g/ml までの高い濃度に分布し、non-PPNG に対する

Table 1 Clinical summary of acute uncomplicated cystitis treated with CXM-AX

Case No.	Age Sex	Diagnosis	Treatment			Symptoms *	Pyuria *	Bacteriuria *			Evaluation **		Side effects	
			Dose (mg×/day)	Route	Duration (days)			Species	Count	MIC of CXM (μg/ml)	UTI	Dr		
1	27 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	4	++ —	+	<i>E. coli</i> —	10 <sup>5</sup> —	N.T.	—	Excellent	Excellent	—
2	59 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	4	+ —	++	<i>E. coli</i> —	10 <sup>4</sup> —	N.T.	—	Excellent	Good	—
3	64 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	4	++ —	+	<i>E. coli</i> —	3.5 × 10 <sup>6</sup> —	1.56	—	Excellent	Excellent	—
4	21 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	4	++ —	++	<i>E. coli</i> —	2.9 × 10 <sup>6</sup> —	1.56	—	Excellent	Excellent	—
5	40 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	4	+ —	+	<i>E. coli</i> —	10 <sup>6</sup> —	3.13	—	Excellent	Excellent	—
6	28 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	5	++ —	++	<i>E. coli</i> <i>E. coli</i>	2 × 10 <sup>5</sup> 10 <sup>3</sup>	3.13 N.T.	—	Moderate	Excellent	—
7	59 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	3	+ —	++	<i>E. coli</i> —	10 <sup>7</sup> —	3.13	—	Moderate	Good	—
8	29 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	3	+ —	+	<i>E. coli</i> —	10 <sup>6</sup> —	3.13	—	Excellent	Excellent	—
9	20 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	3	+ —	++	<i>E. coli</i> —	10 <sup>6</sup> —	3.13	—	Excellent	Good	—
10	49 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	3	+ —	++	<i>E. coli</i> —	10 <sup>6</sup> —	3.13	—	Excellent	Excellent	—
11	27 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	3	+ —	++	<i>E. coli</i> —	10 <sup>7</sup> —	1.56	—	Excellent	Excellent	—
12	65 F	A.U.C.	500 × 3	p.o.	3	+ —	+	<i>E. coli</i> —	10 <sup>7</sup> —	6.25	—	Excellent	Excellent	—
13	71 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	4	+ —	++	<i>E. coli</i> —	10 <sup>7</sup> —	3.13	—	—	Excellent	—
14	24 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	5	++ —	±	<i>E. coli</i> <i>Enterococcus</i>	2 × 10 <sup>3</sup> 3 × 10 <sup>4</sup>	N.T.	—	—	Excellent	—
15	21 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	3	+ —	±	— —	— —	—	—	—	Unknown	—
16	77 F	A.U.C.	250 × 3	p.o.	3	+ —	++	— —	— —	—	—	—	Unknown	—

\* Before treatment  
After treatment

\*\* UTI : Criteria by the committee of UTI  
Dr : Dr's evaluation

N.T. : Not tested

A.U.C. : Acute uncomplicated cystitis

Table 2 Overall clinical efficacy of CXM-AX in acute uncomplicated 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	10	1								11 (92%)
	Decreased (Replaced)										0 (0%)
	Unchanged	1									1 (8%)
Efficacy on pain on urination		12 (100%)			0 (0%)			0 (0%)			Case total 12
Efficacy on pyuria		11 (92%)			1 (8%)			0 (0%)			
<div style="border: 1px solid black; width: 20px; height: 10px; display: inline-block;"></div> Excellent					10 (83%)			Overall effectiveness rate  12/12 (100%)			
<div style="border: 1px solid black; width: 20px; height: 10px; display: inline-block;"></div> Moderate					2						
<div style="border: 1px solid black; width: 20px; height: 10px; display: inline-block;"></div> Poor(or Failed)					0						

Table 3 Clinical summary of chronic complicated cystitis treated with CXM-AX

Case No.	Age Sex	Diagnosis Underlying condition	Catheter (route)	UTI group	Treatment			Pyuria *	Bacteriuria *			Evaluation **		Side effects
					Dose (mg×/day)	Route	Duration (days)		Species	Count	MIC of CXM (μg/ml)	UTI	Dr	
17	77 M	C.C.C.	—	G-2	500 × 3	p.o.	6	##	<i>Enterobacter</i>	10 <sup>7</sup>	N.T.	Poor	Poor	—
		##						<i>Enterobacter</i>	10 <sup>6</sup>	N.T.				
18	60 M	C.C.C.	—	G-6	500 × 3	p.o.	5	##	<i>K. oxytoca</i>	10 <sup>5</sup>	N.T.	Poor	Poor	—
		±						<i>Enterobacter</i>	10 <sup>5</sup>	N.T.				
19	71 M	C.C.C.	—	G-4	500 × 3	p.o.	8	##	<i>E. coli</i>	1.1 × 10 <sup>8</sup>	3.13	—	Good	—
		±						<i>S. epidermidis</i>	1.1 × 10 <sup>7</sup>	N.T.				
20	76 M	C.C.C.	—	G-4	500 × 3	p.o.	7	##	<i>Enterobacter</i>	10 <sup>6</sup>	N.T.	—	Poor	—
		##						<i>Enterobacter</i>	10 <sup>5</sup>	N.T.				
21	48 M	C.C.C.	—	G-4	500 × 3	p.o.	7	±	<i>S. viridans</i>	10 <sup>3</sup>	N.T.	—	Unknown	—
		—						—	—	—				

\* Before treatment  
After treatment

\*\*UTI : Criteria by the committee of UTI  
Dr : Dr's evaluation

N.T. : Not tested

C.C.C. : Chronic complicated cystitis  
B.P.H. : Benign prostatic hypertrophy

Table 4-1 Clinical summary of male gonococcal urethritis treated with CXM-AX

Case No.	Age	Incubation time (day)	Treatment		Burning itching	Urethral* discharge	Pyuria*	<i>N. gono-rrhoeae</i>	MIC of CXM ( $\mu\text{g/ml}$ )	$\beta$ -lactamase	Clinical effect	Side effects
			Dose (mg $\times$ /day)	Duration (days)								
22	23	7	500 $\times$ 3	3	-	##	+	0.8	-	Good	-	
23	33	6	500 $\times$ 3	3	+	##	+	0.05	-	Good	-	
24	35	14	500 $\times$ 3	3	-	##	+	$\leq 0.0125$	-	Excellent	-	
25	35	7	500 $\times$ 3	3	+	##	+	$\leq 0.0125$	-	Good	-	
26	27	13	500 $\times$ 3	3	-	##	+	1.6	-	Good	-	
27	32	4	500 $\times$ 3	3	+	##	+	0.1	-	Good	-	
28	25	14	500 $\times$ 3	3	+	##	+	0.1	-	Good	-	
29	34	14	500 $\times$ 3	3	-	##	+	0.1	-	Good	-	
30	32	Unknown	500 $\times$ 3	3	+	##	+	$\leq 0.0125$	-	Excellent	-	
31	25	21	500 $\times$ 3	3	-	##	+	$\leq 0.0125$	-	Excellent	-	
32	33	10	500 $\times$ 3	3	+	##	+	0.8	+	Excellent	-	
33	31	3	500 $\times$ 3	3	-	##	+	$\leq 0.0125$	-	Good	-	

\* Before treatment  
After treatment

Table 4-2 Clinical summary of male gonococcal urethritis treated with CXM-AX

Case No.	Age	Incubation time (day)	Treatment		Burning* itching	Urethral* discharge	Pyuria*	<i>N. gono-rhooae</i> *	MIC of CXM ( $\mu\text{g/ml}$ )	$\beta$ -lactamase	Clinical effect	Side effects
			Dose (mg $\times$ /day)	Duration (days)								
34	34	21	500 $\times$ 3	3	+ —	# +	# +	+ —	1.6	—	Good	—
35	33	5	500 $\times$ 3	3	— —	# +	# +	+ —	N.T.	—	Good	—
36	59	5	500 $\times$ 3	3	# +	# +	# +	+ —	$\leq 0.0125$	—	Good	—
37	42	14	500 $\times$ 3	3	+ —	# +	# +	+ —	0.2	—	Good	—
38	41	21	500 $\times$ 3	3	— —	# —	# —	+ —	$\leq 0.0125$	+	Excellent	—
39	36	7	500 $\times$ 3	3	# +	# —	# +	+ —	$\leq 0.0125$	—	Good	—
40	21	3	500 $\times$ 3	3	— —	# +	# +	+ —	0.1	—	Good	—
41	21	3	500 $\times$ 3	3	— —	# +	# +	+ —	0.025	—	Good	—
42	24	Unknown	250 $\times$ 3	7	# —	# —	# —	+ —	N.T.	N.T.	Excellent	—

\* Before treatment

N.T.: Not tested

After treatment

Table 5 Clinical summary of prostatitis treated with CXM-AX

Case No.	Age Sex	Diagnosis Underlying condition	Treatment			Pyuria*	Bacteriuria*		Dr's evaluation	Side effects
			Dose (mg×/day)	Route	Duration (days)		Species	Count		
43	71 M	Acute bacterial prostatitis	500×3	p.o.	7	±	<i>S. epidermidis</i>	10 <sup>4</sup>	Excellent	—
		B.P.H.				—	—	—		

\* Before treatment                      B.P.H.: Benign prostatic hypertrophy  
After treatment

Table 6 Bacteriological response to CXM-AX in uncomplicated and complicated U.T.I.

Isolates	No. of strains	Eradicated (%)	Persisted	No. of strains appeared after treatment
<i>E. coli</i>	12	11 (91.6)	1	
<i>Enterobacter</i>	2		2	
<i>K. oxytoca</i>	1	1 (100)		
Total	15	12 (80.0)	3	0

MIC 分布とは大きく異なっていたのに対し、NFLX, CXM, の MIC 分布は、non-PPNG に対するそれと大きな差はなく、この両薬剤が  $\beta$ -lactamase によって影響を受けないことが示されていた。

## 2. 臨床的検討

### 1) 尿路感染症に対する CXM-AX の効果

急性単純性膀胱炎に対する本剤の効果は Table 1 の症例 1 から 16 に示した。このうち症例 13 は年齢により、症例 14 は投与前の膿尿不足により、また症例 15, 16 は投与前の菌数不足により UTI 薬効評価基準による効果判定不能のため主治医判定のみ行った。UTI 薬効評価可能な 12 例の総合臨床効果を Table 2 に示した。著効 10 例、有効 2 例で総合有効率は 100% であった。

症例 17 から 21 の慢性複雑性膀胱炎に対しては UTI 薬効評価可能な 2 例のうち 2 例とも細菌尿の改善がみられず無効であった。

症例 19, 20 は 5 日目で判定を行わず、UTI 薬効評価基準で評価できなかったが、これらをふくめた主治医判定では 4 例中有効 1 例、無効 3 例であった (Table 3)。

### 2) 男子生殖器感染症に対する CXM-AX の効果

症例 22 から 42 までは男子淋菌性尿道炎の症例である (Table 4)。

1 日投与量および投与期間は、症例 42 を除き、全例 1 日 1,500 mg, 3 日間投与であったが、著効 6 例、有効 15 例で有効率 100% であった。このうち  $\beta$ -lactamase 産生菌が分離されたのは 2 例であったが、2 例とも著効であった。

症例 43 は、急性細菌性前立腺炎の症例であるが 1 日 1,500 mg, 7 日間の投与で膿尿、細菌尿の改善がみられ著効と判定された (Table 5)。

## 3) 細菌学的効果

Table 6 には尿路感染症より分離された各種起炎菌に対する本剤の効果を示した。*E. coli* 12 株中 11 株が除菌され、細菌学的有効率は 91.6%, *K. oxytoca* 1 株に対しても有効であったが、*Enterobacter* に対しては無効であった。これらをまとめた細菌学的効果は 80% という成績であった。

また淋菌性尿道炎から分離された 21 株の淋菌は全て消失、急性前立腺炎から分離された *S. epidermidis* も除菌された。

## 4) 副作用

今回対象となった 43 例の尿路・生殖器感染症患者では自覚的な副作用ならびに臨床検査値異常は認められなかった。

## III. 考 察

Cefuroxime はすでに第 2 世代のセフェム剤として臨床で広く使用されており、その広い抗菌スペクトラムと  $\beta$ -lactamase に対する安定性は良く知られている。CXM-AX は経口投与により体液中で Cefuroxime として存在するため、従来の経口用セフェム剤では効果の期待できなかった *E. coli*, *Klebsiella* のセファロsporin 耐性株や *Citrobacter*, *Enterobacter* などにも抗菌作用を示すことが期待されている<sup>1)</sup>。

今回、細菌学的検討としては、淋菌のみを対象として

行ったが、これは近年、従来の PC 剤あるいは経口用セフェム剤に抵抗を示す  $\beta$ -lactamase 産生淋菌が増加しているという理由からである<sup>6)</sup>。その結果、non-PPNG 43 株に対して CXM は、PCG より 1 管、TC より 2 管程度優れた抗菌力を示した。一方 PPNG 7 株では、PCG の MIC は 3.13 から 50  $\mu\text{g}/\text{ml}$  と高値を示したが、CXM の MIC は  $\leq 0.0125 \mu\text{g}/\text{ml}$  から 0.8  $\mu\text{g}/\text{ml}$  に分布し、non-PPNG に対する抗菌力とほぼ同程度であった。このことは、本剤が淋菌の産生する  $\beta$ -lactamase によって不活化されないことを示すものである。なお、non-PPNG、PPNG を問わず最も強い抗菌力を示したのは Norfloxacin であったが、この薬剤以外にも、Enoxacin、Ciprofloxacin などの新しいピリドンカルボン酸系の化学療法剤が淋菌に対し優れた抗菌力を示すのはすでに報告されている通りである<sup>7,8)</sup>。

今回の淋菌性尿道炎に対する CXM-AX の有効性の検討では、21 例中、著効 6 例、有効 15 例で全例に有効であり、淋菌に対する本剤の抗菌力を反映する成績が得られた。この成績は、これまでわれわれが行ってきた新しいピリドンカルボン酸系の抗菌剤の淋菌性尿道炎に対する有効性と同様に優れたものである<sup>7,8)</sup>。

尿路感染症に対する検討では、急性単純性膀胱炎に対し、UTI 判定で 12 例中著効 10 例、有効 2 例で 100%、主治医判定でも 14 例中著効 11 例、有効 3 例で有効率 100% と優れた成績であった。

慢性複雑性膀胱炎に対する成績では、UTI 薬効評価可能な 2 例中 2 例に無効で、主治医判定でも 4 例中有効 1 例、無効 3 例と満足すべき成績ではなかった。今回のわれわれの数少ない症例では、本剤の複雑性尿路感染症に対する適応について結論は出せない。しかし、CXM-AX の新薬シンポジウムにおける全国集計<sup>1)</sup>で複雑性尿路感染症に対する有効率が 54.3% に留まっており、特にカテーテル留置群あるいは *Serratia*, *P. aeruginosa* などの菌種に対する有効率が低かったことを考え合わせると、複雑性感染症における本剤の投与に際してはその

病態、菌種などを考慮に入れて行い必要があると思われる。

急性前立腺炎に対しては 1 例のみであったが、著効であった。これも少ない症例であるが、前立腺炎に対する効果の全国集計<sup>1)</sup>で、75% の有効率であったこと、あるいは本剤の前立腺組織内濃度が比較的高いことなどを考えれば、前立腺炎に対してかなり良い効果が期待できると考えられる。

安全性に関しては、自他覚的に問題となるものはなく従来の経口用セフェム剤と同程度と考えられた。

## 文 献

- 1) 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) THAYER, J. D. ph. D. & J. E. MARTIN, Jr. B. A.: Improved Medium Selection and Cultivation of *N. gonorrhoeae* and *N. meningitis*. Public Health Report 81 : 559~562, 1966
- 3) O'CALLAGHAN, C. H.; A. MORRIS, S. M. & A. H. SHINGLER: Novel Method of detection of  $\beta$ -lactamase by using a chromogenic cephalosporin substrate. Antimicrob. Agents and Chemother. 1 : 283~288, 1972
- 4) PERRET, C. J.: Iodometric assay of penicillinase: Nature 174 : 1012~1013, 1954
- 5) 大越正秋, 河村信夫 (UTI 研究会代表): UTI (尿路感染症) 薬効評価基準 (第 2 版)。Chemotherapy 28 : 321~341, 1980
- 6) 小野寺昭一: 性行為感染症の診断と治療—ペニシリン耐性淋菌—。臨泌, 39 : 113~119, 1985
- 7) 小野寺昭一, 町田豊平, 鈴木博雄, 岸本幸一, 清田 浩, 後藤博一, 岡崎武二郎: 尿路感染症に対する AT-2266 の基礎的・臨床的検討。Chemotherapy 32 (S-3), 680~688, 1984
- 8) 岡崎武二郎, 清田 浩, 後藤博一, 小野寺昭一: BAYo 9867 (Ciprofloxacin) の男子淋菌性尿道炎に対する細菌学的検討と臨床効果。Jpn. J. Antibiotics 投稿中



FUNDAMENTAL AND CLINICAL STUDIES ON CEFUROXIME  
AXETIL (CXM-AX) IN URINARY TRACT AND  
GONORRHOEAL INFECTIONS

SHOICHI ONODERA, TOYOHEI MACHIDA, HIROSHI KIYOTA and HIROKAZU GOTO  
Department of Urology, Jikei University School of Medicine  
(Director : Prof. T. MACHIDA)

KENICHI SAITO  
Department of Urology, National Okura Hospital

TAKEJIRO OKAZAKI  
Department of Urology, Tokyo Metropolitan Taito Hospital

Antibacterial activity against *N. gonorrhoeae* was examined as a fundamental study on CXM-AX, and clinical effects were also evaluated in 43 cases of genitourinary tract infections.

1) Antibacterial activity

Antibacterial activities of penicillin G, tetracycline, norfloxacin and CXM against 50 strains of *N. gonorrhoeae* (43 non-PPNG and 7 PPNG) were examined. MICs of penicillin G for the 50 strains were  $\leq 0.0125$ – $50 \mu\text{g/ml}$  and those of tetracycline were  $0.1$ – $6.25 \mu\text{g/ml}$ , whilst MICs of CXM for the 50 strains were  $\leq 0.0125$ – $3.13 \mu\text{g/ml}$  and those of NFLX were  $\leq 0.0125$ – $0.1 \mu\text{g/ml}$ .

CXM and NFLX showed stronger antibacterial activity than PCG and TC against PPNG.

2) Clinical results

CXM-AX was administered to 16 patients with acute uncomplicated cystitis for 3 to 5 days at a daily dose of 750 mg or 1,500 mg, to 5 patients with chronic complicated cystitis for 5 to 8 days at a daily dose of 1,500mg, also administered to 21 patients with uncomplicated male gonococcal urethritis, and to one patient with acute bacterial prostatitis for 3 or 7 days at a daily dose of 750 mg or 1,500 mg.

The effectiveness rate was 100% in uncomplicated cystitis and 25% in complicated cystitis.

Of these cases, 14 were evaluable according to the "Criteria by UTI Committee", and overall effectiveness rate was 100% in acute uncomplicated cystitis and 0% in complicated cystitis.

The overall clinical effectiveness rate in male gonococcal urethritis was 100%, excellent in 6 cases and good in 15 cases. No noteworthy side effect was observed in any of these cases.