

Cefuroxime axetil (CXM-AX) の外科領域における臨床使用成績

上田 隆美・酒井 克治・藤本 幹夫

大阪市立大学医学部外科学第二教室

佐々木 武也・前田 貞邦

藤井寺市立道明寺病院外科

土居 進

大阪市立北市民病院

光 吉 聖

大阪市立桃山市民病院外科

平田 早苗

大阪市立城北市民病院外科

森 本 譲

森本病院外科

澤 田 晃

恵王病院外科

新しい経口抗生剤 Cefuroxime axetil (CXM-AX) について体液中濃度および臨床効果を検討し、次の結果を得た。

- 1) 胆石症術後例に CXM-AX 500 mg, 食後に経口投与したところ、血清中濃度は2時間後ピーク値 3.4 $\mu\text{g/ml}$ となり、胆汁中濃度は4~5時間後 5.4 $\mu\text{g/ml}$ のピーク値を得た。
- 2) 外科領域感染症 56 例に対する CXM-AX の臨床成績は著効 5 例, 有効 35 例, やや有効 15 例, 無効 1 例であり, 有効率 71.4% となった。
- 3) 副作用は 1 例に腹部膨満感を認めたが, 軽度であり, 投与を継続した。臨床検査値異常は 1 例で, GOT・GPT 値の上昇であった。

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、経口投与によりほとんど吸収されない Cefuroxime (CXM) の 1-acetoxyethyl ester 誘導体である (Fig. 1)。

本剤はそれ自体ほとんど抗菌作用を示さないが、経口投与後腸管内で脱エステル化されて CXM として吸収され、抗菌力を発揮する¹⁾。

CXM は β -lactamase に安定であるので、従来の経口用セファロsporin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*, *Proteus*, *Enterobacter* にも抗菌作用を示す²⁾。

一方、本剤の血中濃度は食後投与時の方が空腹投与時より高く、投与量の約 50% が CXM として吸収され、代謝されることなく尿中へ排泄される^{1,3-5)}。また、本剤の安全性についても特に問題となる点は認められていな

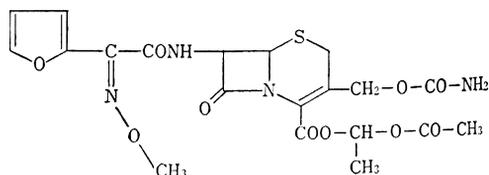
い¹⁾。

今回、われわれは本剤の体液中濃度および外科領域の感染症に対する臨床効果を検討したので、その成績を報告する。

I. 体液中濃度

胆石症術後例に、CXM-AX 500 mg を食後経口投与

Fig. 1 Chemical structure of CXM-AX



(RS)-1-acetoxyethyl (6R, 7R)-3-carbamoyloxymethyl-7-[(2Z)-2-(fur-2-yl)-2-methoxyiminoacetamido]-ceph-3-em-4-carboxylate $\text{C}_{25}\text{H}_{22}\text{N}_4\text{O}_{10}\text{S}$ (510.47)

Table 1 Serum and bile concentrations of CXM-AX after oral administration of 500 mg

Hours	Meal ↓				Meal ↓				
	0	1	2	3	4	5	6	7	8
Serum conc. ($\mu\text{g/ml}$)		1.25	3.4		2.5				
Bile vol. (ml)		20	16	13	18	20	18	18	21
Bile conc. ($\mu\text{g/ml}$)		0	1.2	2.2	3.4	5.4	5.0	3.8	2.2

し、血清中および胆汁中 CXM 濃度を測定した。

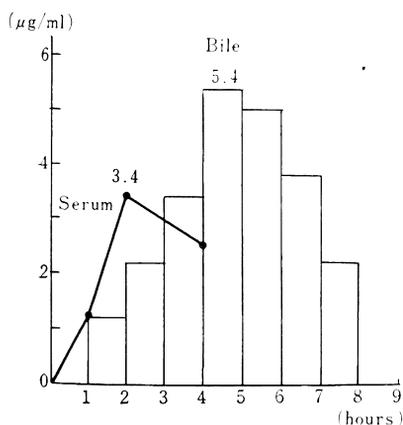
対象は胆石症のため胆のう摘出術を施行された術後17日目、肝機能が GOT 87 IU, GPT 78 IU, Al-P 17.6 KAU, Bil 1.5 mg/dl, と中等度肝機能障害をもつ患者である。食事摂取後, CXM-AX 500 mg を経口投与し, 留置されている T-tube より得られた胆汁を 0-8 時間まで1時間ごとに採取した。

また末梢血は投与後 1, 2, 4 時間に採取した。濃度測定には *B. subtilis* ATCC 6633 株を検定菌とするディスク法を用いた。

血清中濃度は, 2 時間後ピーク値 $3.4 \mu\text{g/ml}$ を示した。

一方, 胆汁中濃度は投与 1~2 時間後 $1.2 \mu\text{g/ml}$ を示し, 経時的に上昇し 4~5 時間後にはピーク値 $5.4 \mu\text{g/ml}$ となった。以後徐々に減少し, 7~8 時間後には $2.2 \mu\text{g/ml}$ を示した (Table 1, Fig. 2)。

Fig. 2 Serum and bile concentrations of CXM-AX after oral administration of 500 mg



58 years-old, male, 67 kg
GOT 87, GPT 78, Al-P 17.6, Bil 1.5

II. 臨床成績

外科領域感染症 56 例に CXM-AX を投与し, その治療成績を検討した。

対象は, 男 23 例, 女 33 例で, 平均年齢 48.8 歳であった (Table 2)。

投与量法別にみると, 本剤 250 mg を 1 日 3 回投与した症例が 35 例と最も多く, ついで 500 mg を 1 日 2 回投与例が 14 例であった。また 6~7 日間投与例が 32 例と半数以上を占め, 大部分が 10 日以内に投与を終了

Table 2 Background of patients
—Age and Sex—

Age	Sex		Total (%)
	Male	Female	
17~19	0	2	2(3.6)
20~29	1	4	5(8.9)
30~39	5	7	12(21.4)
40~49	7	3	10(17.9)
50~59	5	4	9(16.1)
60~69	4	9	13(23.2)
70~81	1	4	5(8.9)
Total (%)	23(41.1)	33(58.9)	56

Table 3 Number of patients treated with CXM-AX classified by duration

Duration (day)	No. of cases (%)
3~5	9 (16.1)
6~7	32 (57.1)
8~10	11 (19.6)
11~14	3 (5.4)
15	1 (1.8)
Total	56

Table 4-1 Clinical results of CXM-AX
—Furuncle—

Case	Age	Sex	Location of lesion	Isolated organisms MIC ($\mu\text{g/ml}$) (10^6)	Dosage schedule			Surgical treatment	Bacteriological effect	Clinical effect	Side effect
					Daily dose ($\text{mg} \times \text{time}$)	Duration (day)	Total dose (g)				
1 T.F.	65	F	Face	<i>S. aureus</i> (>100)	250×3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
2 S.T.	47	F	Nuchal region	<i>S. epidermidis</i>	250×3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
3 S.S.	40	M	Nuchal region	<i>S. aureus</i> (1.56)	250×3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Fair	None
4 H.Y.	29	F	L. breast	<i>S. aureus</i> (>100)	250×3	6	4.5	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
5 H.M.	32	F	R. armpit	<i>S. aureus</i> (>100)	250×3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
6 F.H.	53	F	Back	<i>S. aureus</i> (>100)	250×3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Fair	None
7 T.Y.	35	M	L. buttock	GPC	250×3	8	6.0	None	Eradicated	Fair	None
8 T.K.	64	M	R. femur	<i>S. aureus</i>	500×2	7	7.0	Incision Drainage	Eradicated	Good	None

Table 4-2 Clinical results of CXM-AX
—Felon—

Case	Age	Sex	Location of lesion	Isolated organisms MIC ($\mu\text{g/ml}$) (10^6)	Dosage schedule			Surgical treatment	Bacteriological effect	Clinical effect	Side effect
					Daily dose ($\text{mg} \times \text{time}$)	Duration (day)	Total dose (g)				
9 K.I.	66	F	R. thumb	<i>K. pneumoniae</i> (1.56) <i>S. intermedium</i> (0.1)	250×2	6	2.75	Incision Drainage	Eradicated	Excellent	GOT(17-69) GPT(10-52)
10 K.K.	39	F	R. middle finger	<i>S. aureus</i> (1.56) <i>P. vulgaris</i> (50)	500×2	5	5.0	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
11 K.I.	32	F	L. middle finger	<i>S. aureus</i> (25)	250×3	5	3.75	Incision Drainage	Eradicated	Excellent	None
12 H.T.	40	M	R. ring finger	<i>S. aureus</i> (1.56)	250×3	3	2.25	Incision Drainage	Unknown	Good	None
13 S.F.	67	M	R. first toe	(-)	500×2	7	7.0	Incision Drainage	Unknown	Good	None

し、平均投与日数は7.3日であった (Table 3)。

疾患別内訳は、癰8例、癰疽5例、感染性粉瘤6例、蜂巣炎6例、膿瘍10例、創傷および術後二次感染9例、乳輪炎および乳腺炎5例、胆道感染症7例であった (Table 4)。

臨床効果の判定は、著者らが従来から用いている効果判定基準に従った。すなわち、著効は3日以内に2/3以上の炎症症状が消失した場合、有効は5日以内に2/3以

上の炎症症状が消失した場合、やや有効は7日以内に何らかの炎症症状の改善が認められた場合、無効は全く炎症症状の改善が認められないか、増悪した場合とした (Table 5)。

疾患別に臨床効果をみると、癰8例中有効5例、やや有効3例、癰疽5例中著効2例、有効3例、感染性粉瘤6例中有効5例、やや有効1例、蜂巣炎6例中著効1例、有効3例、やや有効2例、膿瘍10例中著効1例、

Table 4-3 Clinical results of CXM-AX
—Infected atheroma—

Case	Age	Sex	Location of lesion	Isolated organisms MIC ($\mu\text{g/ml}$) (10^6)	Dosage schedule			Surgical treatment	Bacteriological effect	Clinical effect	Side effect
					Daily dose ($\text{mg} \times \text{time}$)	Duration (day)	Total dose (g)				
14 M.Y.	56	M	Occipital region	(-)	250 \times 3	6	4.5	Incision Drainage	Unknown	Good	None
15 S.Y.	53	M	L. auricle	<i>S. epidermidis</i> (1.56) <i>P. aeruginosa</i> (>100)	250 \times 3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
16 A.T.	33	F	L. chest wall	(-)	500 \times 2	4	4.0	Incision Drainage	Unknown	Good	None
17 S.B.	30	M	R. upper arm	<i>E. lentum</i> 1.56)	250 \times 3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
18 M.Y.	60	M	L. femur	<i>S. epidermidis</i> (0.78)	500 \times 2	14	13.5	Incision Drainage	Eradicated	Fair	Sense of abdominal fullness
19 T.T.	22	F	L. knee	<i>P. anaerobius</i> (0.78)	250 \times 3	5	3.75	Incision Drainage	Eradicated	Good	None

Table 4-4 Clinical results of CXM-AX
—Cellulitis—

Case	Age	Sex	Location of lesion	Isolated organisms MIC ($\mu\text{g/ml}$) (10^6)	Dosage schedule			Surgical treatment	Bacteriological effect	Clinical effect	Side effect
					Daily dose ($\text{mg} \times \text{time}$)	Duration (day)	Total dose (g)				
20 H.K.	40	F	R. eyelid		250 \times 3	4	2.5	None	Unknown	Excellent	None
21 M.Y.	34	F	R. eyelid		250 \times 3	6	4.25	None	Unknown	Good	None
22 K.I.	38	F	Abdominal wall	<i>S. aureus</i> (50)	250 \times 3	6	4.5	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
23 M.Y.	39	F	Abdominal wall	<i>S. aureus</i> (>100)	250 \times 3	9	6.25	Incision Drainage	Eradicated	Fair	None
24 E.N.	22	M	R. dorsal hand	<i>S. aureus</i> (1.56) <i>E. coli</i> (1.56)	500 \times 2	7	7.0	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
25 M.N.	65	M	R. dorsal foot	<i>S. aureus</i> (12.5)	500 \times 2	7	7.0	Incision Drainage	Unknown	Fair	None

有効5例, やや有効4例, 創傷および術後二次感染9例中著効1例, 有効5例, やや有効3例, 乳輪炎および乳腺炎5例中有効4例, やや有効1例, 胆道感染症7例中有効5例, やや有効1例, 無効1例となり, 56例中著効5例, 有効35例, やや有効15例, 無効1例, 有効率71.4%であった(Table 6)。

1日投与量別臨床効果は, 1回250mg 1日3回投与群35例中, 著効4例, 有効21例, 有効率71.4%, 1回500mg 1日2回投与群14例中, 有効9例, 有効率

64.3%であったほか, 250mg 2回投与1例は著効, 250mg 4回投与1例は有効, 500mg 3回投与5例では有効4例となった(Table 7)。

分離菌別細菌学的効果は, 病巣から分離された菌の消長をもって, 消失, 減少, 不変, 菌交代, 不明の5項目にわけ, 消失率(%)は不明を除いた(消失菌株数/検出菌株数) $\times 100$ で表した。

56例中, 菌の検出された症例は44例で, 株数は66株であった。

Table 4-5 Clinical results of CXM-AX
—Abscess—

Case	Age	Sex	Location of lesion	Isolated organisms MIC ($\mu\text{g/ml}$) (10^6)	Dosage schedule			Surgical treatment	Bacteriological effect	Clinical effect	Side effect
					Daily dose ($\text{mg} \times \text{time}$)	Duration (day)	Total dose (g)				
26 K.T.	72	M	R. breast	<i>S. aureus</i> (0.78)	250×3	7	5.25	None	Eradicated	Fair	None
27 S.O.	72	F	Abdominal wall	<i>E. coli</i> <i>E. cloacae</i>	250×3	6	4.5	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
28 Y.T.	53	M	Buttock	<i>M. morgani</i> (50) <i>P. asaccharolyticus</i> (0.05)	500×2	5	4.5	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
29 S.I.	59	F	R. buttock	<i>S. aureus</i> (>100) <i>E. faecalis</i> (50) <i>E. coli</i> (0.39) <i>K. pneumoniae</i> (0.78) <i>B. fragilis</i> (25) <i>P. anaerobius</i> (0.2)	250×3	10	7.5	Incision Drainage	Eradicated	Fair	None
30 S.Y.	59	F	L. knee joint	<i>S. aureus</i> (1.56)	250×3	8	6.0	Incision Drainage	Eradicated	Excellent	None
31 Y.Y.	65	F	L. femur	<i>S. aureus</i> (100)	250×3	8	6.0	Incision Drainage	Eradicated	Fair	None
32 K.U.	43	M	Periproctal region	<i>S. pyogenes</i> (0.1) <i>K. pneumoniae</i> (3.13)	250×3	5	3.75	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
33 T.F.	34	M	Periproctal region	<i>M. morgani</i> (25) <i>Peptococcus</i> sp. (0.39)	500×2	7	7.0	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
34 K.Y.	44	M	Periproctal region	<i>E. coli</i> (0.78) <i>K. pneumoniae</i> (0.39) <i>P. prevotii</i> (0.78)	500×2	7	7.0	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
35 S.K.	52	M	Periproctal region	<i>E. coli</i> (1.56) <i>B. fragilis</i> (50) <i>P. anaerobius</i> (0.78)	250×3	7	5.25	Incision Drainage	Unknown	Fair	None

最も多く分離された *S. aureus* 21 株中、不明 2 株を除き、17 株消失し、消失率 89.5%、*E. coli*、*Peptostreptococcus* 各 5 株中、不明 1 株を除く 4 株がそれぞれ消失、*Klebsiella* 5 株は全て消失、*Enterobacter* 4 株は消失 2 株、減少、不変がそれぞれ 1 株ずつであった。

分離菌 66 株中、不明 5 株を除き 55 株が消失し全体の消失率は 90.2% と高い除菌効果を示した (Table 8)。

III. 副作用および臨床検査値異常

CXM-AX 投与中、副作用と思われる症状が 1 例に認められた。本例は糖尿病を基礎疾患にもつ感染性粉瘤の症例で、本剤を 1 回 500 mg 1 日 2 回投与されていた。投与開始 10 日目に腹部膨満感を訴えたが、本剤投与を継続し、投与終了後 2 日目に軽快、のち消失した。本剤との関連のある副作用と考えられる。

一方、臨床検査値異常が 1 例に認められた。癰疽にて 250 mg 1 日 2 回投与、10 日目に GOT 値 (17→69)、GPT 値 (10→52) の上昇を認め、本剤との関係が疑われた。

IV. 考察

CXM-AX は注射用抗生剤 Cefuroxime の 1-acetoxyethyl ester 誘導体である。経口投与後、腸管内で脱エステル化され、CXM として吸収されたのち、門脈血中を経て全身を循環し、代謝されることなく主として腎臓より排泄される¹⁾。

本剤の血清中および胆汁中 CXM 濃度を、1 例について測定し得た。500 mg 投与後の血清中濃度は 2 時間後ピーク値 3.4 $\mu\text{g/ml}$ となり、胆汁中移行に比べやや低値であった。これは、本剤の消化管からの吸収は良好で

Table 4-6 Clinical results of CXM-AX
—Wound infection, postoperative infection—

Case	Age	Sex	Location of lesion (Underlying disease)	Isolated organisms MIC ($\mu\text{g/ml}$) (10^6)	Dosage schedule			Surgical treatment	Bacteriological effect	Clinical effect	Side effect
					Daily dose ($\text{mg} \times \text{time}$)	Duration (day)	Total dose (g)				
36 G.N.	39	M	Face (Contusion)	(-)	250×3	6	4.5	None	Unknown	Good	None
37 T.I.	19	F	Mandibulofacial region (Bite suture)	<i>S. intermedius</i> (0.1)	500×2	7	7.0	Incision Drainage	Eradicated	Fair	None
38 T.F.	63	F	L. knee joint	<i>S. marcescens</i> (50)	250×3	11	8.25	Drainage	Unchanged	Fair	None
39 M.K.	60	F	Breast (Lumpectomy)	<i>S. aureus</i> (>100)	500×2	8	7.5	Incision Drainage	Unchanged	Fair	None
40 T.O.	63	F	L. breast (Radical mastectomy)	<i>S. aureus</i> (1.56)	250×3	7	5.25	None	Eradicated	Good	None
41 K.O.	37	M	Abdominal wall (Appendectomy)	<i>B. fragilis</i> (50)	250×3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Good	None
42 T.U.	58	F	Abdominal wall (Appendectomy)	<i>S. intermedius</i> (0.2) <i>S. chidomidis</i> (12.5)	250×3	10	7.5	Incision Drainage	Replaced	Good	None
43 M.M.	47	M	Abdominal wall (Appendectomy)	<i>P. aeruginosa</i> (>100)	250×3	7	5.25	Incision Drainage	Eradicated	Excellent	None
44 S.H.	76	F	Dead space (Rectal amputation)	<i>S. aureus</i> (>100)	250×3	12	9.0	Incision	Unchanged	Good	None

Table 4 7 Clinical results of CXM-AX
—Mastitis, arecolitis—

Case	Age	Sex	Diagnosis	Isolated organisms MIC ($\mu\text{g/ml}$) (10^6)	Dosage schedule			Surgical treatment	Bacteriological effect	Clinical effect	Side effect
					Daily dose (mg \times time)	Duration (day)	Total dose (g)				
45 M.M.	23	F	L. mastitis	<i>L. calcuiform</i> (1.56)	250 \times 3	7	5.25	Drainage	Eradicated	Good	None
46 K.H.	47	F	L. mastitis		250 \times 3	7	5.25	None	Unknown	Good	None
47 M.K.	27	F	Mastitis	<i>S. aureus</i>	500 \times 2	15	14.5	Puncture	Eradicated	Good	None
48 A.F.	65	F	R. arecolitis		250 \times 3	7	5.25	None	Unknown	Good	None
49 Y.M.	17	F	R. arecolitis	(-)	500 \times 2	7	7.0	Incision Drainage	Unknown	Fair	None

あったが、肝機能が低下しているため門脈から肝、さらに末梢血への移行が不良のため、十分な血清中濃度が得られなかったのではないかと考えられる。すなわち消化管機能が正常であっても肝機能異常が存在する場合、本剤のような経口抗生剤の末梢血中移行は阻害されることが推察される。

一方、胆汁中濃度は4～5時間後ピーク値 5.4 $\mu\text{g/ml}$ を示し、7～8 時間後でも 2.2 $\mu\text{g/ml}$ と血清中濃度の100～200% が移行し、胆道感染症に対する効果が期待される。

CXM-AX の抗菌力の本剤の本体が CXM であり、従来の経口用セファロスポリン剤より広い抗菌スペクトルをもっている。すなわち、*S. aureus*, *Streptococcus*, *H. influenzae* などには ABPC, CCL より良好な抗菌力を示し、また従来の経口剤がほとんど抗菌力を示さない *Enterobacter*, *Citrobacter*, *Morganella*, *Providencia* に対しても抗菌力をもっている¹⁾。

これらのことよりわれわれが対象とする外科領域感染症の中で *S. aureus* の多く分離される皮膚軟部組織感染症のほか、グラム陰性菌による感染症に対しても有効性が期待される。

今回、本剤を投与した 56 例のうち、菌を検索し得た 44 例から 21 株の *S. aureus* が分離され、消失率 89.5% と高い除菌効果を認めた。また、*S. aureus* 以外の、嫌気性菌を含むグラム陽性菌、陰性菌 45 株についても、90.5% という菌消失率が得られたことから、本剤の抗菌力は細菌学的効果に十分反映されていると思われる。

また、皮膚軟部組織感染症および術後感染症 49 例に対する本剤の成績は、膿瘍 60.0% から瘻瘻 100% に至るまで平均 71.4% であった。疾患により差が認められるものの、49 例中 1 例も無効と判定された症例がなかったことは良好な細菌学的効果を反映しているものと思われる。全症例 56 例中、無効と判定された症例は胆管炎の 1 例で、胆汁中より *Acinetobacter* sp. が検出されており、本剤の抗菌力が及ばなかったものと思われる。この症例を含む胆道感染症 7 例のうち、5 例が有効と判定されたことと、経口投与により胆汁中に良好に移行することから、本剤は、経口剤で治療可能な胆道感染症に対して有効な薬剤の一つであると考ええる。

副作用は腹部膨満感が 1 例に認められたが、軽度であり、投与を継続した。臨床検査値異常は 1 例に認められ、本剤との関係は疑わしいものの、重篤ではなかった。

以上のことから、本剤は従来経口剤を用いて治療してきた、皮膚軟部組織感染症だけではなく、胆道感染症を含む広い外科領域感染症に対し、有用な薬剤であると考ええる。

Table 4-8 Clinical results of CXM-AX
—Biliary tract infection—

Case	Age	Sex	Diagnosis (Underlying disease)	Isolated organisms MIC ($\mu\text{g}/\text{ml}$) (10^6)	Dosage schedule			Surgical treatment	Bacteriological effect	Clinical effect	Side effect
					Daily dose (mg \times time)	Duration (day)	Total dose (g)				
50 T.S.	62	F	Acute cholangitis (Gallbladder cancer)	<i>E. cloacae</i> (25) <i>E. faecalis</i> (50)	500 \times 3	7	10.5	PTCD	Eradicated	Good	None
51 A.M.	69	F	Acute cholangitis (Cholelithiasis)	(—)	250 \times 4	6	6.0	Cholelith- jejunostomy	Unknown	Good	None
52 S.F.	81	F	Acute cholangitis (Cholelithiasis)	(—)	500 \times 3	10	15.0	PTCD	Unknown	Fair	None
53 K.I.	59	M	Acute cholangitis (Cholangioma)	<i>Streptococcus</i> D group <i>E. aerogenes</i> ↓ <i>E. aerogenes</i>	500 \times 3	9	13.5	PTCD	Decreased	Good	None
54 M.F.	46	M	Acute obstructive cholangitis (Cholangioma)	<i>Actinobacter</i> sp.	250 \times 3	5	3.75	PTCD	Unchanged	Poor	None
55 K.Y.	44	M	Postoperative cholangitis (Pancreas cancer)	<i>Propionibacterium</i> sp. <i>E. aerogenes</i> <i>P. cepacia</i> ↓ <i>K. pneumoniae</i> <i>E. aerogenes</i> <i>E. cloacae</i>	500 \times 3	8	12.0	Total pan- createctomy T-tube drainage	Replaced	Good	None
56 H.K.	70	F	Acute cholecystitis	(—)	500 \times 3	10	15.0	None	Unknown	Good	None

Table 5 Criteria for evaluating effectiveness
of an agent on infectious diseases
in the field of surgery

Excellent	More than 2/3 of the symptoms and signs disappear within 3 days after onset of the treatment.
Good	More than 2/3 of the symptoms and signs disappear within 5 days after onset of the treatment.
Fair	Any one of the symptoms and signs disappear within 7 days after onset of the treatment.
Poor	None of the symptoms and signs disappear or their aggravation is observed after 7 days.

Table 6 Clinical effect of CXM-AX

Diagnosis	No. of cases	Excellent	Good	Fair	Poor	Effectiveness rate (%)
Furuncle	8		5	3		5/8 (62.5)
Felon	5	2	3			5/5 (100)
Infected atheroma	6		5	1		5/6 (83.3)
Cellulitis	6	1	3	2		4/6 (66.7)
Abscess	10	1	5	4		6/10(60.0)
Wound infection, postoperative infection	9	1	5	3		6/9 (66.7)
Mastitis, areolitis	5		4	1		4/5 (80.0)
Biliary tract infection	7		5	1	1	5/7 (71.4)
Total	56	5	35	15	1	40/56(71.4)

Table 7 Clinical effect of CXM-AX classified by daily dose

Daily dose (mg × time)	No. of cases	Excellent	Good	Fair	Poor	Effectiveness rate (%)
250 × 2	1	1				1/1
250 × 3	35	4	21	9	1	25/35(71.4)
250 × 4	1		1			1/1
500 × 2	14		9	5		9/14(64.3)
500 × 3	5		4	1		4/5
Total	56	5	35	15	1	40/56(71.4)

Table 8 Bacteriological effect of CXM-AX on clinical isolates

Isolated organisms	No. of strains	Eradicated	Decreased	Unchanged	Unknown	Eradicated rate (%)
<i>S. aureus</i>	21	17		2	2	17/19 (89.5)
<i>S. epidermidis</i>	3	3				3/3
<i>S. pyogenes</i>	1	1				1/1
<i>S. intermedius</i>	3	3				3/3
<i>Streptococcus D</i>	1	1				1/1
<i>E. faecalis</i>	2	2				2/2
GPC	1	1				1/1
<i>E. coli</i>	5	4			1	4/4
<i>Klebsiella</i> sp.	5	5				5/5
<i>Enterobacter</i> sp.	4	2	1	1		2/4
<i>P. vulgaris</i>	1	1				1/1
<i>M. Morganii</i>	2	2				2/2
<i>S. marcescens</i>	1			1		0/1
<i>Pseudomonas</i> sp.	3	3				3/3
<i>Acinetobacter</i> sp.	1			1		0/1
<i>Peptococcus</i> sp.	1	1				1/1
<i>Peptostreptococcus</i> sp.	5	4			1	4/4
<i>Propionibacterium</i> sp.	1	1				1/1
<i>Eubacterium</i>	1	1				1/1
<i>B. fragilis</i>	3	2			1	2/2
<i>Lactobacillus</i> sp.	1	1				1/1
Total	66	55	1	5	5	55/61 (90.2)

文 献

- 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
- 中川圭一: Cefuroxime, Jap. J. Antibiotics. 35 (2): 283~295, 1982
- 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
- HARDING, S. M.; P. E. O. WILLIAMS & J. AYRTON: Pharmacology of cefuroxime as the 1-acetoxyethyl ester in volunteers, Antimicrob. Agents Chemother. 25 (1): 78~82, 1984
- SOMMERS, De. K.; M. V. WYK, P. E. O. WILLIAMS & S. M. HARDING: Pharmacokinetics and tolerance of Cefuroxime axetil in volunteers during repeated dosing. Antimicrob. Agents Chemother. 25(3): 344~347, 1984

A CLINICAL TRIAL ON CEFUROXIME AXETIL (CXM-AX) IN THE FIELD OF SURGERY

TAKAMI UEDA, KATSUJI SAKAI and MIKIO FUJIMOTO

The Second Department of Surgery, Osaka City University Medical School

TAKEYA SASAKI and SADAKUNI MAEDA

Department of Surgery, Fujiidera City Domyoji Hospital

SUSUMU DOI

Department of Surgery, Osaka City Kita Hospital

TAKASHI MITSUYOSHI

Department of Surgery, Osaka City Momoyama Hospital

SANAE HIRATA

Department of Surgery, Osaka City Shirokita Hospital

YUZURU MORIMOTO

Department of Surgery, Morimoto Hospital

AKIRA SAWADA

Department of Surgery, Keio Hospital

Cefuroxime axetil (CXM-AX), a new orally absorbable prodrug of Cefuroxime, was investigated for its serum and bile concentrations, clinical effectiveness and side effects.

1) Following oral administration of 500 mg of CXM-AX after meal in a patient after cholelithotomy, the serum concentration showed its peak of 3.4 $\mu\text{g/ml}$ at 2 hours after dosing, and the bile concentration showed its peak of 5.4 $\mu\text{g/ml}$ at 4—5 hours.

2) CXM-AX was given to 56 patients with infections in the field of surgery. The results obtained were as follows; "Excellent" in 5 cases, "Good" in 35 cases, "Fair" in 15 cases and "Poor" in 1 case. The effectiveness rate was 71.4%.

3) As to side effects related to CXM-AX, sense of abdominal fullness was observed in one case, but it was mild and the administration was continued. As to abnormal laboratory data, increase in GOT · GPT values was noted in 1 case.