

CS-807の臨床的検討

山口 一

いわき市立総合磐城共立病院 内科

清水喜八郎

東京女子医科大学 内科

新しく開発された経口用セファロスポリン系薬剤である CS-807を内科領域感染症9症例に使用し臨床的検討を行った。

対象疾患の内訳は呼吸器系感染症6例（急性気管支炎5例，慢性気管支炎1例），尿路感染症3例（いずれも急性膀胱炎）であった。

全例に1回量100mgを1日2回，5～20日間使用し，著効2例，有効6例，無効1例の臨床成績を得た。細菌学的にはB群 *Streptococcus*, *E. coli*, *S. epidermidis* に有効であった。全例に副作用および臨床検査値の異常変動は認められなかった。

CS-807は新しく開発された経口用セファロスポリン剤であり，グラム陽性，陰性菌に広範囲な抗菌スペクトルを有し，しかも従来のセファロスポリン系薬剤が抗菌力を示さなかった *Enterobacter*, *Serratia*, indole 陽性 *Proteus* 属にも強い抗菌作用を具備している。また β -lactamase に安定なため本酵素の産生株にも抗菌力を有している。著者らは，本剤を9例の内科領域の感染症例に投与し，臨床評価を試みたので，それらの成績を以下に報告する。

I. 対象および投与方法

対象患者は昭和61年2月から昭和62年3月までの1年1ヵ月間に当科へ入院あるいは外来通院していた，合意の得られた9症例であり，男性3例，女性6例であった。年齢は25歳～79歳であった（Table 1）。

検討症例の内訳は呼吸器感染症6例（急性気管支炎5例，慢性気管支炎1例），尿路感染症3例（急性膀胱炎3例）であり，いずれも軽症の細菌感染症であった。投与法は全例1回100mgを1日2回投与した。投与日数は5～20日，総投与量は1000mg～4000mgであった。また，他の抗生剤の併用は行わなかった。

II. 臨床成績

臨床効果判定は，細菌学的には起炎菌が消失し，臨床症状，検査所見の改善が著しかったものを著効（Excellent），起炎菌が消失または著明に減少し，臨床症状，検査所見に改善がみられたものを有効（Good），起炎菌および臨床症状，検査所見に改善が認められなかったものを無効（Poor）とした。

疾患別臨床効果を Table 1 に示した。急性気管支炎5例のうち，著効1例，有効3例，無効1例であり，慢性気管支炎1例は有効であった。急性膀胱炎3例では，著効1例，有効2例であった。

細菌学的効果の判定しえたのは4例で全例消失した。消失した菌は β -*Streptococcus*, *S. epidermidis*, *E. coli* であった。

III. 副作用

副作用は全例において認められなかった。また，本剤投与前後で末梢血液検査，血液生化学，および尿検査を施行して，臨床検査値異常の有無について検討した結果，本剤に起因すると思われる明らかな異常は認められなかった（Table 2）。

Table 1 Clinical results of CS-807 therapy

Patient No.	Age Sex	Diagnosis	Severity	Daily dose (mg × times)	Duration (days)	Causative organism	Clinical effect	Side-effect
1	N.K. 41 M	Acute bronchitis	Mild	100 × 2	5	N.F.	Excellent	(-)
2	Y.K. 48 M	Acute bronchitis	Mild	100 × 2	20	N.F.	Good	(-)
3	W.A. 58 F	Acute bronchitis	Mild	100 × 2	7	N.D.	Good	(-)
4	M.M. 70 F	Chronic bronchitis	Mild	100 × 2	8	N.F.	Good	(-)
5	A.A. 58 F	Acute bronchitis	Mild	100 × 2	10	<i>β-Streptococcus</i> (2×10^7) → (-)	Good	(-)
6	Y.R. 25 F	Acute bronchitis	Mild	100 × 2	5	N.F.	Poor	(-)
7	T.K. 79 F	Acute cystitis	Mild	100 × 2	7	<i>E.coli</i> ($>10^7$) → <i>E.faecalis</i> ($<10^3$) <i>S.epidermidis</i> ($<10^3$)	Good	(-)
8	I.R. 65 M	Acute cystitis	Mild	100 × 2	7	<i>S.epidermidis</i> ($>10^7$) → (-)	Good	(-)
9	O.A. 53 F	Acute cystitis	Mild	100 × 2	5	<i>E.coli</i> ($>10^7$) → (-)	Excellent	(-)

N.F.: Normal flora, N.D.: Not detected

IV. 考 察

CS-807は、R-3763にイソプロポキシカルボニルオキシエチルをエステル結合させ、経口吸収性を高めた新規口用セフェム剤であり、*Enterobacter*, *Serratia*, indole陽性 *Proteus* にも抗菌スペクトルが拡大している。また、その抗菌力の強さは PBP に対する強い親和性と β -lactamase に対する高い安定性にある。

今回の臨床検討症例 9 例はいずれも比較的軽症例である。1 例を除いて著効あるいは有効のすぐれた臨床効果が認められ、細菌学的にも原因菌の判明した 4 例中全例で完全に除菌された。本剤が無効であった症例 6 は、甲状腺機能亢進症の治療中に急性気管支炎を発症した症例

である。CS-807を 1日200mg, 5日間投与したが、自覚症状の改善を認めず、ABPCに変更して治療している。

この例においては投与量あるいは投与期間が不適当であったのか等が推察されるが詳細は不明である。

副作用は自他覚症状および臨床諸検査値において 1 例も認められず、本剤の安全性は高いものと思われた。

以上より CS-807は内科領域の軽症感染症に有効性が期待でき、かつ安全な薬剤と考えられた。

文 献

- 1) 第35回日本化学療法学会総会 新薬シンポジウムII, CS-807 盛岡, 1987

Table 2 Laboratory findings before and after CS-807 therapy

Patient No.	Before After	Hematology						Renal function			Liver function				Electrolyte			CRP			Urinalysis		
		WBC	RBC ×10 ⁴	Hb (g/dl)	Ht (%)	ESR (mm/hr)	BUN (mg/dl)	Cr (mg/dl)	S-GOT	Al-P	γ-GTP	Na (mEq/l)	K (mEq/l)	Cl (mEq/l)	CRP	P	S	U					
1	N.K.	5000	427	12.3	37.2	14		102	195		138	4.0	99	+2									
	A	4900	457	12.8	39.8	10		48	183		143.	3.9	99	±									
2	B	12300	557	15.4	48.6	13		18	91	64	139	4.3	104	+4	-	±	±						
	A	6200	532	15.3	45.8	6		30	91	44	143	4.6	107	-	-	±	±						
3	B	4700	523	14.3	44.9	14		24	111	18				-									
	A	4300	496	14.1	42.1	17		20	102	20				-									
4	B	4400	359	10.7	32.1	23		17	119	8	142	4.7	103	-									
	A	5300	374	11.5	33.5	35		11	116	14	143	4.6	109	-									
5	B	5100	424	12.2	36.9	5		24	84	9	142	4.9	109	-									
	A	4800	433	12.2	37.5	40		19	85	6	142	4.3	113	-									
6	B	6600	557	13.9	43.3	9		22	305	64	145	4.8	112	-									
	A	6900	499	12.4	38.0	7		18	305	37	142	3.7	108	-									
7	B	8700	451	13.7	43.4			19	110		143	5.1	104	+2	-	-	±						
	A	7400	393	11.9	38.3			19	97		143	5.5	103	+1	-	-	±						
8	B	6800	543	16.3	49.4	3		19	116	7				-	-	+	+						
	A	7900	529	16.0	48.1	4		10	104	20				-	-	+	+						
9	B	9700	472	13.4	40.1	7		13	128					-	+	-	±						
	A	4600	494	13.5	41.8	9		16	118					-	-	-	±						

B: before therapy A: after therapy P: protein in urine S: sugar in urine U: urobilinogen in urine

CLINICAL EVALUATION OF CS-807

HAJIME YAMAGUCHI

Department of Internal Medicine, Iwaki Kyoritsu General Hospital, Iwaki

KIHACHIRO SHIMIZU

Department of Internal Medicine, Tokyo Women's Medical College, Tokyo

CS-807, a new orally absorbed pro-drug of R-3763, was evaluated for its clinical efficacy in five cases of acute bronchitis, one case of chronic bronchitis and 3 cases of acute cystitis.

CS-807 was administered orally at a daily dose of 200mg in two divided doses. The duration of treatment ranged from 5~20 days, and the total dose from 1.0g~4.0g.

The clinical effects were excellent in two, good in six and poor in one case.

Bacteriologically, strains of *β-streptococcus*, *E. coli* and *S. epidermidis* were eliminated.

Neither side-effects nor abnormal laboratory values were observed.

Our results suggest that CS-807 is an effective and safe drug against infectious diseases.