

外科領域における NY-198の基礎的臨床的検討

由良二郎・品川長夫・水野 章・真下啓二

保里恵一・福井拓治

名古屋市立大学医学部第一外科

吉見 治・石川 周

東海通信病院 外科

橋本 俊・中村明茂・清水保延

高浜市立病院 外科

岩井昭彦・水野裕支・早川哲史

知多厚生病院 外科

伊藤忠夫・松本一明・三宅 孝

多治見市民病院 外科

新しいピリドンカルボン酸系合成抗菌剤である NY-198について、外科領域における基礎的、臨床的検討を行ない以下の成績を得た。

1. 抗菌力：外科病巣分離の *Staphylococcus aureus* に対しては0.8~6.3 μ g/mlに分布し、MICの peak 値は1.6 μ g/mlであった。*Enterococcus* spp.に対しては3.2~6.3 μ g/ml, *Escherichia coli* では1.6 μ g/ml以下, *Klebsiella pneumoniae* では0.8 μ g/ml以下で阻止された。*Pseudomonas aeruginosa* に対しては peak 値が6.3 μ g/mlにあり、耐性株もみられた。

2. 胆汁中移行：臨床例4例に本剤200mgを経口投与し、胆汁中移行を血清中濃度と共に測定した。平均最高胆汁中濃度は3時間目に7.59 μ g/mlを示し、同時に施行した血清中濃度は1.74 μ g/mlであり、良好な胆汁中移行を示した。

3. 臨床使用成績：感染性粉瘤9例、蜂巣炎5例、癰3例、皮下膿瘍3例、瘰癧1例、肛門膿瘍1例、創感染4例、乳腺炎2例の計28例に投与した。臨床効果は著効11例、有効14例、やや有効2例、無効1例であり、有効率は89.3%であった。細菌学的効果は消失10例、減少2例、不変2例、不明14例で消失率は71.4%であった。自他覚的副作用は認められなかったが、臨床検査値では2例に好酸球増多、1例に GOT, GPT の軽度上昇を認めた。

NY-198は3位C置換ピペラジノ基を有する新しいピリドンカルボン酸系合成抗菌剤で、グラム陽性菌および陰性菌に広範囲な抗菌スペクトルを有する経口用抗菌剤である。その化学構造式はFig. 1の如くである。

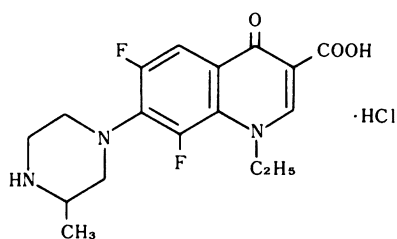
本剤は経口投与により、速やかに血中および各組織中に移行し、尿中には未変化体のまま排泄される。また MIC と MBC が近似しているため MIC に近い濃度で殺菌的に作用する新しいピリドンカルボン酸系合成抗菌剤である。他方、安全性の面では急性、亜急性の毒性試験、一般薬理試験等の結果、特に異常な作用は認められず、安全性が確認されている¹⁾。

我々は本剤の外科領域における基礎的、臨床的検討を

行ない、また4例の胆石症術後症例において胆汁中移行を検討した。

I 方 法

1. 抗菌力：当教室の外科病巣から分離された *Staphylococcus aureus* 18株, *Enterococcus* spp. 17株, *Escherichia coli* 20株, *Klebsiella pneumoniae* 20株, *Pseudomonas aeruginosa* 18株について、本剤の抗菌力を MIC-2000システムを用いたマイクロイオン希釈法により10⁶個/ml接種にて、その最小発育阻止濃度（以下



(±)-1-ethyl-6,8-difluoro-1,4-dihydro-7-(3-methyl-1-piperazinyl)-4-oxo-3-quinolinecarboxylic acid hydrochloride

Fig. 1. Chemical structure of NY-198

MIC)を測定し²⁾, 対照薬 ofloxacin(OFLX), norfloxacin(NFLX)と比較検討した。

2. 胆汁中移行: 胆石症術後の総胆管 T-チューブドレナージ施行症例 4 例に本剤の胆汁中移行を測定した。測定時間は胆汁分泌の比較的安定する術後 2 週間以上とし, 本剤 200mg を食前または食後経口投与し胆汁中移行を血中濃度と共に測定した。検体は採取後すみやかに遠心分離し, -20°C にて冷凍保存した。濃度測定は *E. coli* NIHJ JC-2 を検定菌とする Bioassay 法で, 標準曲線作成にあたり希釈液として血清では Consera (日水), 胆汁では 1/15M リン酸緩衝液を用いた。

3. 臨床使用成績: 対象症例は 14 歳から 75 歳 (平均 46.9 歳) までの男性 15 例, 女性 13 例の 28 例であり, 疾患の内訳は感染性粉瘤 9 例, 蜂巣炎 5 例, 癰 3 例, 皮下膿瘍 3 例, 瘻疽 1 例, 肛門膿瘍 1 例, 創感染 4 例, 乳腺炎 2 例であった。投与方法は 1 回 200mg, 1 日 2 回食後投与が 10 例, 1 日 3 回が 17 例, 途中減量が 1 例であり, 投与日数は最短 4 日より最長 17 日 (平均投与日数 8.4 日) であり, 総投与量は 2.0g より 10.2g (平均総投与量 4.4g) であった (Table 1)。臨床効果の判定は教室の判定基準によった。すなわち, 著効は本剤投与 3 日で主要症状の 2/3 以上が消失または改善したもの, 有効とは投与 5 日で主要症状の過半数が消失または改善したもの, やや有効とは投与 7 日で主要症状の過半数が消失または改善したものとし, 無効とは 7 日以上投与しても症状の改善しないもの, あるいは症状が悪化したものとした。

II 結 果

1. 抗菌力: *S. aureus* に対する NY-198 の抗菌力は MIC ピーク値を $1.6\mu\text{g/ml}$ に有し, OFLX より約 1 管不良の抗菌性を示した (Fig. 2)。Enterococcus spp. に対する NY-198 の抗菌力は MIC ピーク値を $6.3\mu\text{g/ml}$ に有し, NFLX とほぼ同様な抗菌性を示したが, OFLX より 1 管劣っていた (Fig. 3)。*E. coli* に対する抗菌力

は 3 剤とも $3.2\mu\text{g/ml}$ 以上の耐性株を認めず, ほぼ同様な感受性パターンを示した (Fig. 4)。*K. pneumoniae* に対する NY-198 の抗菌力は MIC 値のピーク値を $0.2\mu\text{g/ml}$ に有し, OFLX, NFLX と同様な抗菌性を示し, すべての株は $0.8\mu\text{g/ml}$ 以下であった (Fig. 5)。*P. aeruginosa* に対する NY-198 の抗菌力は MIC ピーク値を $6.3\mu\text{g/ml}$ に有し, OFLX と同様な抗菌性を示した。NFLX はさらに 2 管ほど良好な抗菌性を示した。 $50\mu\text{g/ml}$ 以上の高度耐性株は 1 株で $3.2\mu\text{g/ml}$ 以下の感受性株が 7 株認められた (Fig. 6)。

2. 胆汁中移行: 66 歳から 83 歳にわたる平均 72.8 歳の男性 2 例, 女性 2 例に本剤 200mg を食前または食後経口投与し胆汁中移行検査を行なった。症例 1 および 3 は術前に化膿性胆管炎を併発し, 緊急手術を施行した症例である。4 例とも総胆管結石症術後 T-チューブ挿入例である。Table 2 はこれらの症例の検査時の血液検査結果である。

症例 1: K.H. 74 歳, 女性, 体重 40kg, 総胆管結石症, 化膿性胆管炎 (Fig. 7), 術後約 3 カ月で本剤 200mg 食前投与した。検査施行時の血液生化学検査では T.P. 5.9mg/dl , GOT 137 IU, GPT 79 IU と軽度低蛋白血症および肝機能障害を認めたが, 腎機能には異常は認められなかった。胆汁培養では *Enterobacter cloacae*, *Bacillus* spp. が検出されたが, 全身状態は良好であった。血液中の濃度は投与後 1/2 時間で $0.12\mu\text{g/ml}$ 検出され, 以後漸増し, 2 時間ではほぼプラトーになり, 4 時間でピーク値 $2.49\mu\text{g/ml}$ となった。胆汁では 1 時間で検出され始め, 3 時間でピーク値 $11.8\mu\text{g/ml}$ となり以後漸減していった。なお 8 時間後でも $4.25\mu\text{g/ml}$ と高い胆汁中濃度を維持していた。症例 2: F.K. 66 歳, 女性, 体重 49kg, 総胆管結石症 (Fig. 8), 術後約 3 週間で本剤 200mg 食後投与した。検査施行時の血液生化学検査では GOT 71 IU, GPT 98 IU, A ℓ -P 696 IU, Cho-E 2280 と軽度貧血症および肝機能障害を認めたが, 腎機能には異常は認められなかった。胆汁培養では *P. aeruginosa* (NY-198 の MIC は $25\mu\text{g/ml}$) が検出されたが, 全身状態は良好であった。血液中の濃度は投与後 2 時間で $0.61\mu\text{g/ml}$ 検出され, 4 時間でピーク値 $1.15\mu\text{g/ml}$ となった。胆汁中では 3 時間で検出され始め, 4 時間でプラトーになり, 5 時間でピーク値 $2.52\mu\text{g/ml}$ となり以後漸減していった。

症例 3: T.K. 68 歳, 男性, 体重 48kg, 総胆管結石症, 化膿性胆管炎 (Fig. 9), 術後約 1 カ月で本剤 200mg 食前投与した。検査施行時の血液生化学検査では貧血症, 低蛋白血症, 肝機能障害および腎機能障害は認められなかった。胆汁培養では *E. cloacae* (NY-198 の MIC は $50\mu\text{g/ml}$) が検出されたが, 全身状態は良好であった。血液中の濃度は投与後 1/2 時間で $0.43\mu\text{g/ml}$ 検出され, 1 時

Table 1-1. Clinical efficacy in cases treated with NY-198

Case No.	Name	Age	Sex	Diagnosis	Underlying disease	Treatment			Isolated organisms (Before After)	Bacteriological effect	Clinical effect	Adverse effects
						Dose (mg)	Duration (days)	Total dose (g)				
1	S. M.	21	M	Infected atheroma (ear)	(-)	200×3	4	2.4	<i>S. epidermidis</i> (0.39) (-)	Disappeared	Good	(-)
2	Y. I.	63	M	Infected atheroma (leg)	(-)	200×3	9	5.4	(-) (-)	Unknown	Excellent	(-)
3	T. M.	43	M	Infected atheroma (back)	(-)	200×2	7	2.8	<i>S. epidermidis</i> (0.39) (-)	Disappeared	Good	(-)
4	T. K.	51	M	Infected atheroma (back)	(-)	200×2	7	2.8	<i>S. simulans</i> (0.39) <i>Bacteroides</i> spp. (12.5) N. T.	Decreased	Excellent	(-)
5	M. M.	38	M	Infected atheroma (neck)	(-)	200×3	7	4.2	<i>S. epidermidis</i> (0.78) <i>Corynebacterium</i> (6.25) (-)	Disappeared	Excellent	Eos. (9→15%)
6	G. N.	57	M	Infected atheroma (back)	(-)	200×3	6	3.4	<i>S. epidermidis</i> (3.13) <i>S. haemolyticus</i> (0.78) (-)	Disappeared	Good	(-)
7	S. S.	57	M	Infected atheroma (neck)	Anemia	200×3	11	6.6	(-) N. T.	Unknown	Good	(-)
8	I. Y.	75	M	Infected atheroma (neck)	(-)	200×3	6	3.4	<i>S. epidermidis</i> (0.78) <i>S. hyicus</i> (0.78) (-)	Disappeared	Excellent	(-)
9	Y. I.	63	M	Infected atheroma (leg)	(-)	200×3	11	6.6	(-) N. T.	Unknown	Good	(-)
10	Y. S.	34	F	Phlegmon (leg)	(-)	200×2	5	2.0	(-) N. T.	Unknown	Excellent	(-)

Table 1-2. Clinical efficacy in cases treated with NY-198

Case No.	Name	Age	Sex	Diagnosis	Underlying disease	Treatment			Isolated organisms (Before After)	Bacteriological effect	Clinical effect	Adverse effects
						Dose (mg)	Duration (days)	Total dose (g)				
11	K. T.	36	F	Phlegmon (foot)	(-)	200×2	6	2.4	N. T. N. T.	Unknown	Excellent	(-)
12	M. S.	44	F	Phlegmon (perineum)	Hyperthyroidism	200×3	6	3.4	(-) (-)	Unknown	Excellent	(-)
13	T. I.	63	M	Phlegmon (buttock)	D. M.	200×3	17	10.2	N. T. <i>S. agalactiae</i> (12.5)	Unknown	Good	(-)
14	H. I.	34	M	Phlegmon (armpit)	(-)	200×3	13	7.2	<i>S. aureus</i> (1.56) (-)	Persisted	Good	(-)
15	T. M.	42	M	Furuncle (buttock)	Bronchitis	200×3	7	4.2	N. T. N. T.	Unknown	Excellent	(-)
16	Y. F.	44	F	Furuncle (armpit)	(-)	200×3	7	4.2	<i>E. coli</i> (0.05) (-)	Disappeared	Excellent	(-)
17	E. S.	14	F	Furuncle (face)	(-)	200×3	7	4.2	<i>S. aureus</i> (0.39) (-)	Disappeared	Excellent	(-)
18	T. K.	38	F	Abscess (nipple)	Cystitis	200×3	5	3.0	<i>Peptostreptococcus</i> spp. GPC	Decreased	Good	(-)
19	K. Y.	42	F	Abscess (nipple)	(-)	200×2	10	4.0	(-) (-)	Unknown	Fair	(-)
20	K. Y.	61	M	Abscess (buttock)	D. M.	200×3	17	10.0	<i>P. magnus</i> (12.5) (-)	Unknown	Fair	(-)

Table 1-3. Clinical efficacy in cases treated with NY-198

Case No.	Name	Age	Sex	Diagnosis	Underlying disease	Treatment			Isolated organisms (Before After)	Bacteriological effect	Clinical effect	Adverse effects
						Dose (mg)	Duration (days)	Total dose(g)				
21	K. K.	72	F	Panaritium (foot)	(-)	200×2	7	2.8	<i>S. hominis</i> (0.78) <i>S. haemolyticus</i> (0.78) <i>S. epidermidis</i> (-)	Disappeared	Good	(-)
22	H. O.	41	M	Periproctitis	(-)	200×2	7	2.8	<i>E. coli</i> (0.05) <i>B. fragilis</i> (12.5) (-)	Disappeared	Good	Eos. (2→10%)
23	K. N.	31	F	Wound infection	(-)	200×2	7	2.8	GNB N. T.	Unknown	Good	(-)
24	A. O.	57	F	Wound infection	D.M. Bronchial asthma Uterine sarcoma	200×3 100×3	7 6	6.0	<i>E. faecalis</i> (3.13) N. T.	Unknown	Good	GOT (18→93) GPT (24→66)
25	E. A.	56	M	Wound infection	Appendicitis	200×2	8	3.2	(-) N. T.	Unknown	Good	(-)
26	K. I.	71	F	Wound infection	Ventral hernia	200×3	11	6.6	<i>S. aureus</i> <i>S. aureus</i>	Persisted	Poor	(-)
27	Y. S.	32	F	Mastitis	(-)	200×3	8	4.8	(-) (-)	Unknown	Excellent	(-)
28	K. S.	32	F	Mastitis	(-)	200×2	7	2.8	<i>E. coli</i> (-)	Disappeared	Good	(-)

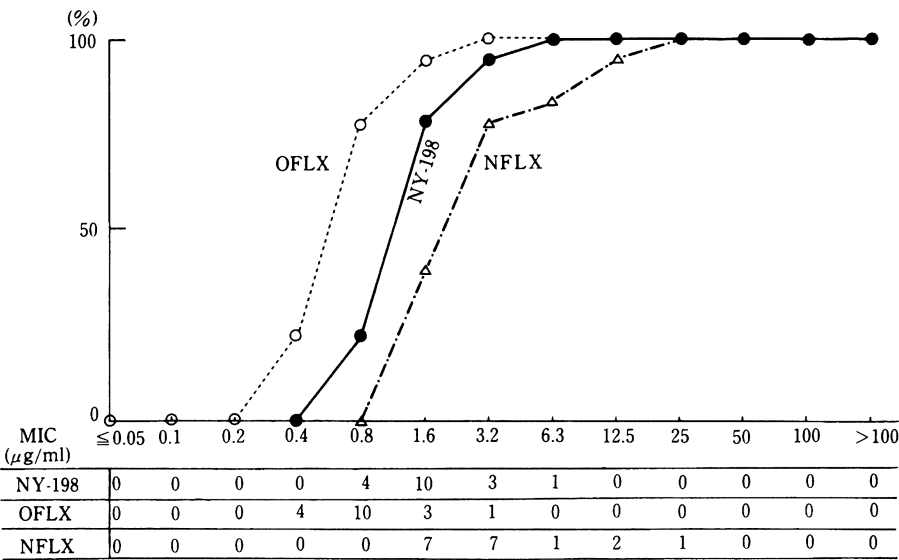


Fig. 2. Susceptibility of *S. aureus*

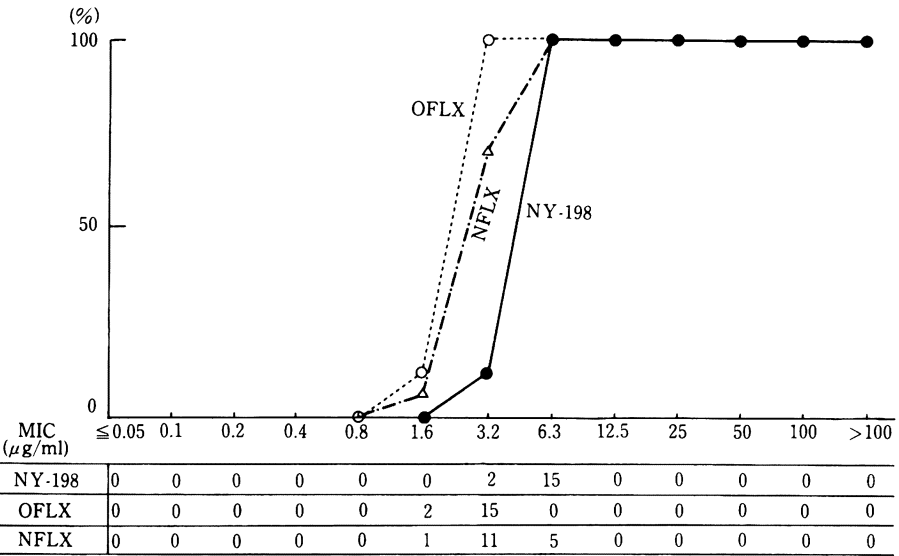
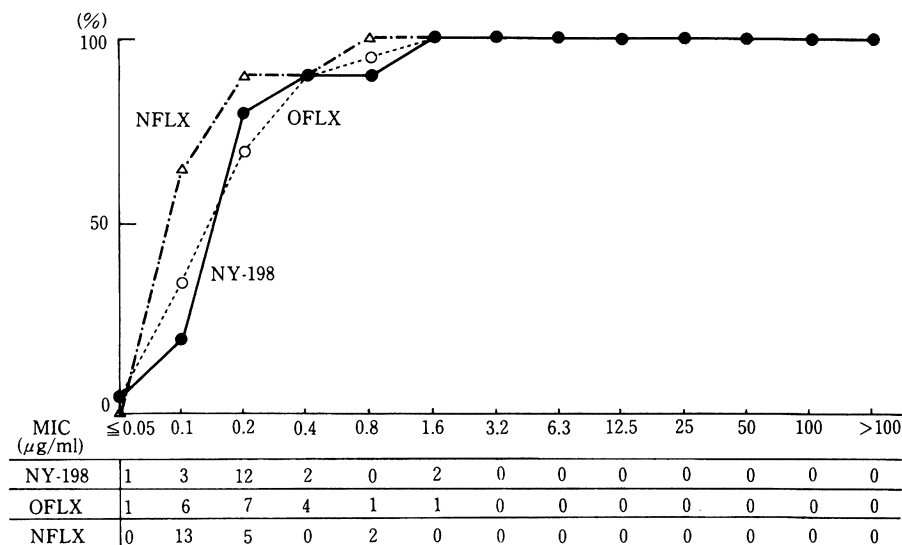
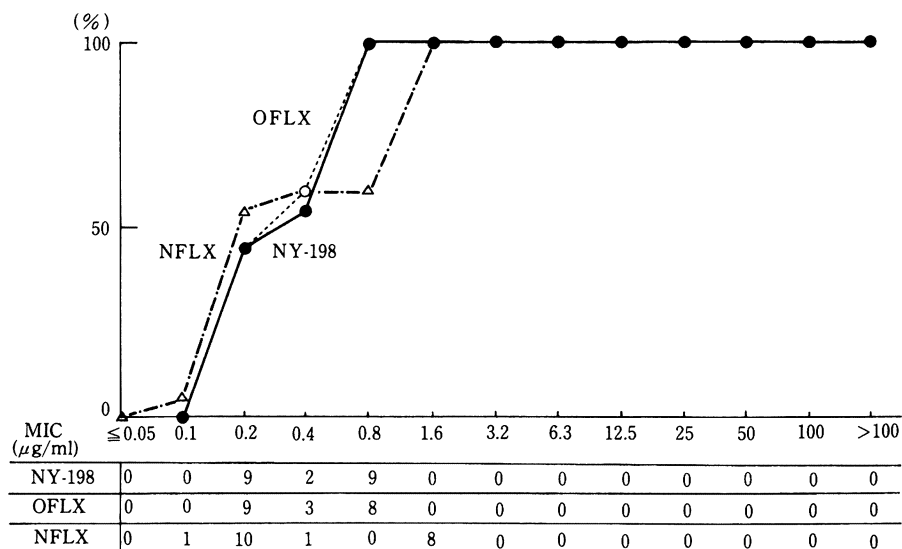


Fig. 3. Susceptibility of *Enterococcus* spp.

間でピーク値1.61μg/mlとなり、以後漸減していった。胆汁中では1時間ですでにピーク値9.08μg/mlとなり、以後漸減していった。なお8時間後でも2.47μg/mlの胆汁中濃度を維持していた。

症例4：S.M. 83歳、男性、体重59kg、総胆管結石症、(Fig.10)、術後約3週間で本剤200mg食前投与した。検査施行時の血液生化学検査では貧血症、低蛋白血症、肝機能障害および腎機能障害は認められなかった。胆汁培養では *Citrobacter freundii* (NY-198のMICは0.20

μg/ml) が検出された。NY-198の血液中の濃度は投与後1/2時間で0.57μg/ml検出され、1時間でピーク値3.97μg/mlとなり、以後漸減していった。胆汁中では1時間では検出されず、2時間でピーク値15.56μg/mlとなり、以後漸減していった。なお8時間後でも4.59μg/mlと高い胆汁中濃度を維持していた。本剤の胆汁中移行検査を施行した4例の最高濃度の平均値は7.59μg/mlで、到達時間は3時間であり、胆汁中半減期は3.76時間であった。同時に施行された平均最高血清中濃度は1.74μg/mlで、

Fig. 4. Susceptibility of *E. coli*Fig. 5. Susceptibility of *K. pneumoniae*

到達時間は2時間であり、血中半減期は4.69時間であった(Fig.11)。症例1および2は軽度肝機能障害を呈していたが、前者は良好な移行を示し、4例中3例は食前投与であり、食後投与の1例に比し、明らかに高濃度移行を示した。

3. 臨床使用成績：感染性粉瘤9例、蜂巣炎5例、癰3例、皮下膿瘍3例、療疽1例、肛門膿瘍1例、創感染4例、乳腺炎2例に投与した。臨床効果は著効11例、有効14例、やや有効2例、無効1例であり、全体としての有

効率は89.3%であった(Table 3)。宿主の感染防御能を低下せしめる糖尿病を基礎疾患としてもった症例は28例中3例であり、その臨床効果は有効2例、やや有効1例で有効率66.7%であった。また200mg 1日2回投与群と1日3回投与群を比較し、1日投与量について検討した。前者は10例中、著効3例、有効6例、やや有効1例で、有効率90.0%であった。一方、後者は17例中、著効8例、有効7例、やや有効1例、無効1例で、有効率88.2%で両者に差は認められなかったが、著効率は前者で30

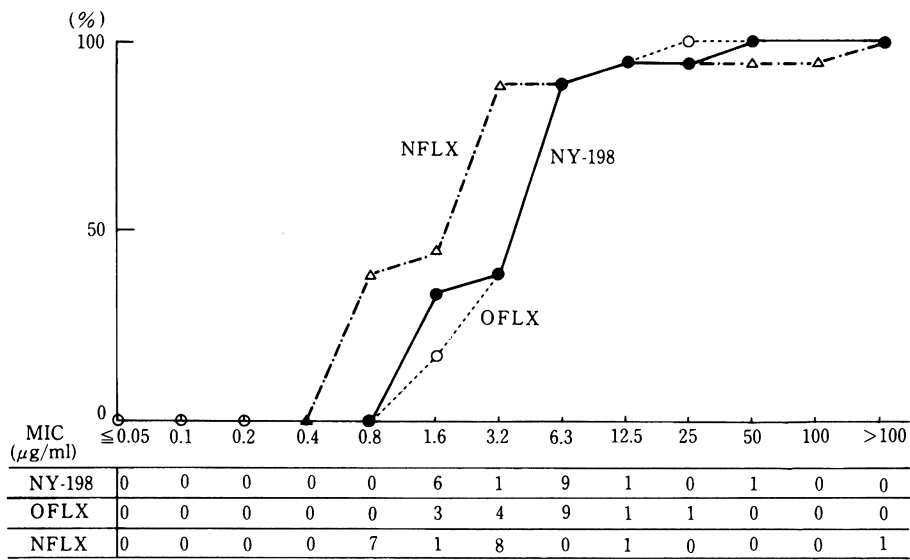


Fig. 6. Susceptibility of *P. aeruginosa*

Table 2. Laboratory features

Case No.	RBC 10 ⁴ / mm ³	Hb g/dl	Ht %	WBC /mm ³	T. P g/dl	T. Bil mg/dl	D. Bil mg/dl	GOT mU/ ml	GPT mU/ ml	LDH U	ALP mU/ ml	γ-GTP mIU/ ml	ZTT U	Ch. E IU/ gHb	BUN mg/dl	Cr mg/dl
1	421	13.7	42	4500	5.9	0.6	—	137	79	361	248	266	7.5	221	5.4	0.4
2	328	10.0	29.4	5000	6.3	0.9	0.4	71	98	289	696	141	6.3	2280	14.4	0.5
3	429	14.1	40	6200	7.0	0.2	—	20	32	295	203	36	6.0	215	12.6	0.8
4	326	10.7	31	6100	6.7	0.3	—	20	22	266	161	27	10.0	353	24.1	1.2

Table 3. Clinical efficacy in cases treated with NY-198 (Summary)

Diagnosis	No. of cases	Excellent	Good	Fair	Poor	Efficacy rate
Infected atheroma	9	4	5			100
Phlegmon	5	3	2			100
Furuncle	3	3				100
Abscess	3		1	2		33.3
Panaritium	1		1			100
Periproctitis	1		1			100
Wound infection	4		3		1	75
Mastitis	2	1	1			100
Total	28	11	14	2	1	89.3%

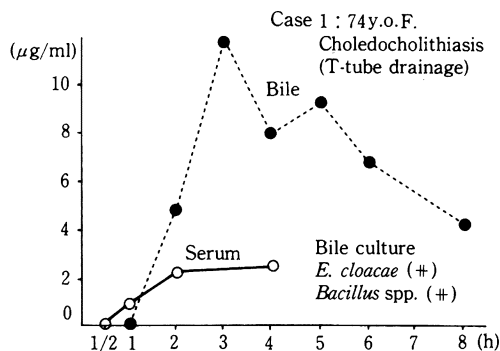


Fig. 7. Serum and bile levels of NY-198 (200mg)

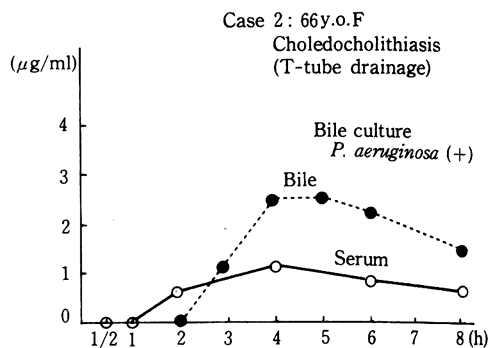


Fig. 8. Serum and bile levels of NY-198 (200mg)

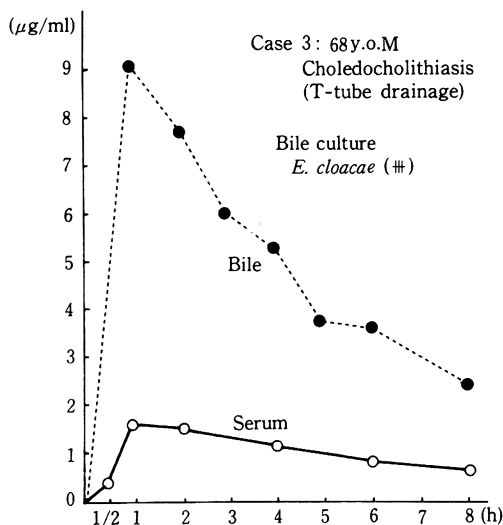


Fig. 9. Serum and bile levels of NY-198 (200mg)

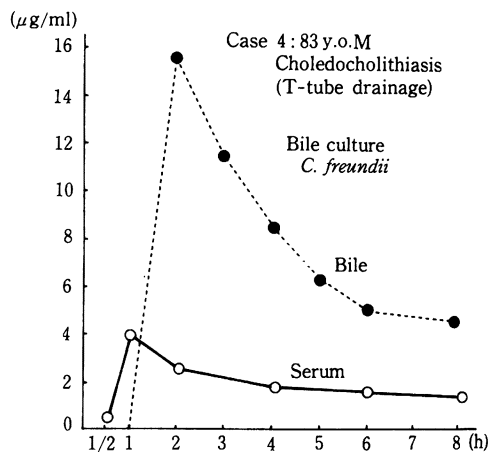


Fig. 10. Serum and bile levels of NY-198 (200mg)

%, 後者で47.1%であった。疾患別では、皮下膿瘍の有効率は33.3%と低かったが、他の皮膚軟部組織感染症に対しては極めて良好な臨床効果を得た。

28例中25例に細菌学的検査が施行された。感染病巣から分離された好気性グラム陽性球菌は15株で主として *S. aureus* 3株, *Staphylococcus epidermidis* 6株, *Staphylococcus haemolyticus* 2株であった。グラム陰性桿菌は *E. coli* が3株分離され、嫌気性菌は *Bacteroides* spp. 2株が分離され、グラム陽性球菌の検出率が71.4% (15/21株) で多く占めた。

細菌学的効果は消失10例、減少2例、不変2例、および

不明14例で、消失率は71.4%であった。菌株の消失率は *S. aureus*, は3株中1株, 33.3%で, *S. epidermidis* 6株, *S. haemolyticus* 2株は100%の消失率であった。その他のGPCでは *Staphylococcus simulans* の1株を除いて100%の消失率であった。グラム陰性桿菌の *E. coli* では3株すべてが消失し、嫌気性菌では33.3%の消失率であった (Table 4)。

自他覚的副作用は認められなかったが、本剤との関連性が考えられる臨床検査値異常は25例中3例に認められた (Table 5)。症例5で9%から15%へ好酸球増多が認められ、症例22でも2%から10%へ好酸球増多が認め

Table 4. Bacteriological response to NY-198 treatment

Isolated organism	No. of strains	Disappeared	Decreased	Persisted	Disappearance rate
<i>S. aureus</i>	3	1		2	33.3
<i>S. epidermidis</i>	6	6			100
<i>S. haemolyticus</i>	2	2			100
<i>S. simulans</i>	1		1		0
<i>S. hominis</i>	1	1			100
<i>S. hyicus</i>	1	1			100
<i>Corynebacterium</i>	1	1			100
<i>E. coli</i>	3	3			100
<i>Peptostreptococcus</i> spp.	1		1		0
<i>Bacteroides</i> spp.	2	1	1		50
Total	21	16	3	2	76.2

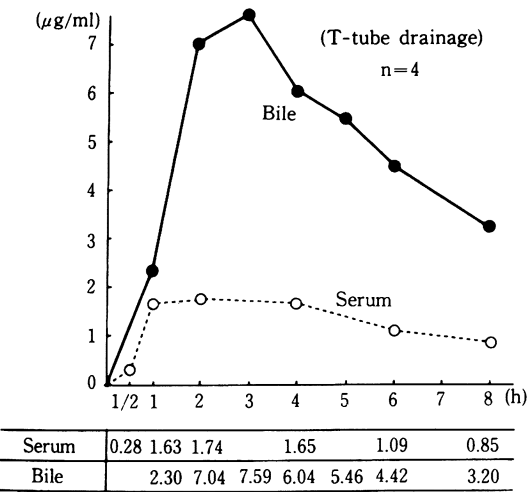


Fig. 11. Serum and bile levels of NY-198 (200mg)

られた。症例24では GOT 18IU から93IU, GPT 24IU から66IU と上昇を認めたが1週間後にはほぼ正常値に復した。

Ⅲ 考 察

抗菌力において、*S. aureus* に対しては NFLX より約1管良好で、OFLX より約1管不良の抗菌性を示した。*Enterococcus* spp.に対しては OFLX, NFLX より約1管不良な抗菌性を示した。*E. coli* に対しては OFLX とほぼ同様な抗菌力を示したが、NFLX より1管劣っていた。3剤とも3.2µg/ml以上の耐性株を認めず、ほぼ同様

な感受性パターンを示した。*K. pneumoniae* に対しては MIC ピーク値を0.2µg/mlに有し、OFLX, NFLX と同様な抗菌性を示し、すべての株は0.8µg/ml以下であった。*P. aeruginosa* に対しては MIC ピーク値を6.3µg/mlに有し、OFLX と同様な抗菌性を示した。NFLX はさらに2管ほど良好な抗菌性を示した。50µg/ml以上の高度耐性株は1株で3.2µg/ml以下の感受性株が7株認められ、高度耐性株は非常に少なく、優れた抗菌力を示しているので、有効な臨床効果が期待できる。

経口用抗菌剤の胆汁中移行³⁾に関しては、症例の病態により吸収および胆汁中排泄の解析が複雑である。すなわち症例の栄養状態、肝硬変あるいは肝機能障害の有無、黄疸の期間、担癌状態の有無などにより、薬剤の吸収および胆汁中排泄率が異なり、血中および胆汁中移行は様々である。さらにこの検査症例は術後で、異物としてのT-tube 挿入状態での検査値であり、生理的な状態での胆汁中移行とは多少異なっていると判断すべきであろう。このように個々の症例について胆汁中濃度にある程度の差は認められるが本剤については、平均のピーク値が7.59µg/mlであり、8時間後においても3.20µg/mlを維持している。この移行度は、OFLX⁴⁾の胆汁中移行濃度とほぼ同程度であり、本剤の各細菌に対する MIC からみれば十分有効な胆汁中移行が得られていると思われる。

皮膚軟部組織感染症から分離された細菌は、GPC が80.0%, GNR が100%, 嫌気性菌が33.3%の消失率であり、その臨床効果も89.3%を得た。以上、外科領域において NY-198の基礎的、臨床的検討を行い、本剤の有用性が認められた。

Table 5. Laboratory findings of patients treated with NY-198

Case	RBC 10 ⁴ /mm ³	Hb g/dl	WBC /mm ³	Eos %	PLT 10 ⁴ /mm ³	GOT mU/ml	GPT mU/ml	ALP mU/ml	BUN mg/dl	Cr mg/dl	
2	B	498	15.4	6600	1	14	18	17	174	14.5	0.9
	A	508	16.3	6300	1	17	17	17	174	15.0	0.9
3	B	493	16.3	6400	7	28	23	21	7.5	15.4	1.1
	A	517	16.6	7000	3	26	24	18	6.9	16.2	1.2
5	B	452	14.4	5400	9	25	30	20	6.2	19.1	1.3
	A	448	14.7	6200	15	24	30	19	6.3	14.9	1.4
6	B	382	11.8	7900	0	32.5	13	7	3.8	23.7	1.6
	A	395	11.9	7500	0	29.8	10	5	4.7	24.3	1.7
7	B	376	6.7	4700	2	41	26	10	119	13.9	1.0
	A	376	6.3	5800	3	35	25	19	121	15.9	0.8
8	B	314	7.7	5000	5	35	18	13	288	45.1	3.6
	A	343	8.2	5400	1	36	23	15	291	43.5	3.5
9	B	498	15.4	6600	1	14	18	13	174	14.5	0.9
	A	508	16.3	6300	—	—	17	17	174	16.7	0.9
10	B	—	—	—	—	—	12	10	40	16.0	0.8
	A	456	12.5	5000	0	29.2	14	8	46	19.0	0.8
11	B	512	10.0	5100	0	32	19	12	7.0	12.0	1.1
	A	509	9.9	4900	1	32	17	13	6.8	12.0	0.9
12	B	446	13.9	8300	0	20.1	11	13	6.3	22.0	0.7
	A	465	14.6	6500	3	20.7	17	13	6.3	15.1	0.8
13	B	492	13.5	8400	4	21.3	19	16	9.3	10.3	0.9
	A	487	12.9	5300	6	33.4	20	16	9.2	11.8	0.8
14	B	434	13.7	7900	1	21.8	20	19	5.7	12.8	0.8
	A	424	12.8	3500	3	21.6	22	30	5.8	11.1	0.7
15	B	495	14.7	7300	0	30.2	13	10	10.3	8.8	0.7
	A	508	15.3	7400	1	32.7	14	9	8.6	8.5	0.7
16	B	400	9.1	5700	1	34.1	16	7	7.6	14.4	0.6
	A	399	9.3	5100	1	33.3	15	8	8.2	16.3	0.6
17	B	406	11.0	8200	—	24	15	5	247	12.0	0.6
	A	436	11.3	5200	5	27	14	6	262	—	—
18	B	425	13.8	8500	5	14.1	13	13	97	12.8	1.2
	A	417	13.6	6100	3	20.7	13	7	98	16.7	1.1
19	B	499	14.6	5500	1	28	16	16	6.9	16	1.1
	A	456	13.7	5400	2	28	18	6	5.9	12	0.6
20	B	421	13.2	5000	2	20	16	15	113	10.0	0.9
	A	432	13.7	5100	2	19	24	21	103	11.6	0.8
22	B	534	16.7	12100	2	29.1	29	125	113	10	0.8
	A	514	15.5	7200	10	29.3	32	85	102	10	1.0
23	B	374	12.1	4900	0	42.5	108	226	118	17	0.7
	A	352	11.3	5200	3	47.2	24	76	104	7	0.7
24	B	318	9.4	3200	4	26.9	18	24	83	10	1.0
	A	343	9.9	4900	0	20.2	93	66	104	4	1.1
25	B	506	15.9	9800	3	42	29	41	7.6	16	1.2
	A	498	15.3	6100	3	36					

NY-198 IN SURGERY

JIRO YURA, NAGAO SHINAGAWA, AKIRA MIZUNO, KEIJI MASHITA, KEIICHI HORI and TAKUJI FUKUI

First Department of Surgery, Nagoya City University Medical School, Nagoya

OSAMU YOSHIMI and SHU ISHIKAWA

Department of Surgery, Tokai Teishin Hospital, Nagoya

TAKASHI HASHIMOTO, AKISHIGE NAKAMURA and YASUNOBU SHIMIZU

Department of Surgery, Takahama City Hospital, Takahama

AKIHIKO IWAI, HIROSHI MIZUNO and TETSUSHI HAYAKAWA

Department of Surgery, Chita Kosei Hospital, Chitagun

TADAO ITO, KAZUAKI MATSUMOTO and TAKASHI MIYAKE

Department of Surgery, Tajimi City Hospital, Tajimi

We performed basic and clinical investigations on NY-198, a newly synthesized antibacterial pyridone carbonate, in the surgical field. Results obtained are:

1) Antibacterial activity : against *S. aureus* isolated from resected foci, the MIC of NY-198 was 0.8–6.3 μ g/ml with a peak value of 1.6 μ g/ml ; against *Enterococcus* spp., 3.2–6.3 μ g/ml ; *E. coli*, below 1.6 μ g/ml ; *K. pneumoniae*, below 0.8 μ g/ml; and against *P. aeruginosa*, 6.3 μ g/ml at peak, though resistant strains were detected.

2) Penetration into bile: 200mg of NY-198 was orally administered to 4 patients and its concentrations in bile and serum were measured. The mean peak level was 7.59 μ g/ml in bile and 1.74 μ g/ml in serum 3 h after administration, indicating favorable penetration of the test drug into bile.

3) Clinical results : NY-198 was administered to a total of 28 patients: infectious pulverulent phyma 9, phlegmon 5, furuncle 3, subcutaneous abscess 3, panaritium 1, perianal abscess 1, wound infection 4, and mastitis 2. The result was excellent in 11 patients, good in 14, fair in 2 and poor in 1, with an overall efficacy rate of 89.3%. As to bacteriological effect, results were : "disappeared" in 10 patients; "decreased" in 2 ; "persisted" in 2 and "unknown" in 14. The disappearance rate was 71.4%.

No subjective or objective side-effects were observed, though laboratory data included increased eosinophils in 2 patients, and slightly increased GOT and GPT in 1 patient.