

耳鼻咽喉科領域感染症に対する NY-198 の基礎的、臨床的検討

平田 哲康・関谷 透

山口大学医学部耳鼻咽喉科

新しいキノロン系合成抗菌剤である NY-198 の耳鼻咽喉科領域感染症に対する基礎的、臨床的検討を行なった。

臨床的検討では、耳鼻咽喉科領域感染症49例に本剤1日600mgないし300mgを3回に分けて投与し、著効11例、有効21例、やや有効7例、無効10例であり、全体の有効率は65.3%であった。

疾患別有効率は、中耳炎46.2%、副鼻腔炎81.8%、扁桃炎87.5%であり、慢性中耳炎および慢性中耳炎・急性増悪例を除き良好な成績であった。

副作用は下痢2例、胃部不快感2例に認められたが、いずれも軽度であった。

薬剤の組織内移行性は、本剤200mgを経口投与後の血清および組織（鼻茸、下甲介、上顎洞粘膜）について計測し、検討した。その結果、鼻茸、上顎洞粘膜へは血清と同等もしくはそれ以上のレベルの移行を示した。

以上より、本剤は耳鼻咽喉科領域感染症に対して有用な薬剤であると考えられる。

新しいキノロン系合成抗菌剤である NY-198 は、北陸製薬株式会社に開発され、グラム陰性菌のみならずグラム陽性菌および嫌気性菌に対して広い抗菌スペクトラムを有し、norfloxacin (NFLX)、ofloxacin (OFLX) に匹敵する抗菌力が認められている。その化学構造はキノロンカルボン酸を基本骨格に、1位にエチル基、6位および8位にフッ素原子ならびに7位に3-メチルピペラジノ基を有している (Fig. 1)。

今回我々は、耳鼻咽喉科領域感染症に対する NY-198 の臨床的検討を行ない、併せて少数例ではあるが鼻・副鼻腔組織への本剤の移行についても検討したので報告する。

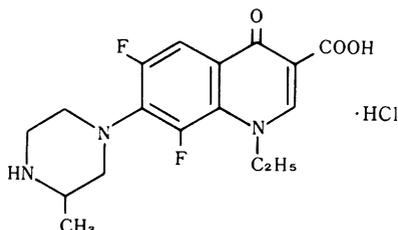


Fig. 1. Chemical structure of NY-198

I 臨床的検討

1. 対象および方法

対象は昭和61年7月から62年1月までに当科および

その関連施設を受診した20~89歳までの男32例、女17例の計49例である。その疾患の内訳は、急性中耳炎5例、慢性中耳炎12例、慢性中耳炎・急性増悪9例、耳癬1例、急性副鼻腔炎4例、慢性副鼻腔炎3例、慢性副鼻腔炎・急性増悪4例、急性扁桃炎4例、慢性扁桃炎3例、慢性扁桃炎・急性増悪1例、急性咽喉頭炎1例、慢性咽喉頭炎・急性増悪1例、感染耳瘻孔1例である。

投与方法は1回100mg, 1日3回投与が1例、他は全例1回200mg, 1日3回投与とした。投与期間は2~28日間、総投与量は、0.9~16.8gであった。臨床効果の判定は自覚症状の改善と体温や顔面X線、局所炎症所見等の改善により、著効、有効、やや有効、無効の4段階で行なった。また本剤投与前後に可能な限り血液検査、血液生化学検査、尿検査等を行ない、副作用の有無を検討した。

細菌学的効果は、本剤投与前後に病巣より採取した検体について菌検査を行ない、分離菌の消長にもとづき、消失、減少、菌交代、不変、不明と判定した。さらに分離株のMICを日本化学療法学会標準法に従って測定した。

2. 結果

NY-198を投与した耳鼻咽喉科領域感染症49例の臨床効果は、Table 1に示すとおりである。急性中耳炎5例では、著効3例、有効1例、やや有効1例で、有効率80%、慢性中耳炎12例では、著効1例、有効2例、やや有

Table 1-1. Clinical results of NY-198

Case No.	Name	Age (yrs.) Sex	Diagnosis	Treatment			Isolated organisms		Clinical	Effect	Side-effects
				Daily dose (mg × times)	Duration (days)	Total dose (g)	Species	MIC (μg/ml)			
1	T. F.	30 M	R) Acute otitis media	200 × 3	14	8.4	<i>P. aeruginosa</i> <i>P. aeruginosa</i>	$\frac{6.25}{6.25}$	Fair	Unchanged	—
2	K. U.	54 F	R) Acute otitis media	200 × 3	7	4.2	<i>S. aureus</i>	1.56	Excellent	Unknown	—
3	M. A.	32 F	R) Acute otitis media	200 × 3	7	4.2	<i>S. aureus</i>	0.39	Excellent	Eradicated	—
4	T. Y.	77 M	L) Acute otitis media	200 × 3	6	3.6	<i>S. aureus</i> <i>S. xylosum</i>	$\frac{1.56}{0.78}$	Good	Eradicated	—
5	H. T.	23 M	R) Acute otitis media	200 × 3	7	4.2	<i>S. aureus</i> <i>S. intermedium</i> <i>S. aureus</i>	$\frac{0.39}{0.78}$ 0.39	Excellent	Decreased	—
6	S. A.	56 M	Chronic otitis media	200 × 3	14	8.4	<i>P. aeruginosa</i> <i>P. aeruginosa</i>	$\frac{0.78}{1.56}$	Poor	Unchanged	—
7	T. O.	38 M	Chronic otitis media	200 × 3	28	16.8	No growth	—	Poor	Unknown	—
8	S. T.	72 F	L) Chronic otitis media	200 × 3	28	16.8	<i>S. epidermidis</i>	0.39	Poor	Eradicated	—
9	M. F.	89 M	Chronic otitis media	200 × 3	14	8.4	<i>P. aeruginosa</i> <i>P. aeruginosa</i>	$\frac{1.56}{25}$	Fair	Unchanged	—
10	A. K.	57 M	Chronic otitis media	200 × 3	28	16.8	<i>S. aureus</i>	0.39	Poor	Eradicated	—

Table 1-2. Clinical results of NY-198

Case No.	Name	Age (yrs.) Sex	Diagnosis	Treatment			Isolated organisms		Effect		Side-effects
				Daily dose (mg × times)	Duration (days)	Total dose (g)	Species	MIC (μg/ml)	Clinical	Bacteriological	
11	T. S.	46 M	L) Chronic otitis media	200 × 3	7	4.2	<i>E. cloacae</i> <i>S. aureus</i> <i>Corynebacterium</i> sp.	0.10	Fair	Replaced	Abdominal discomfort
12	S. Y.	72 M	R) Chronic otitis media	200 × 3	11	6.6	<i>P. aeruginosa</i>	12.5	Good	Eradicated	—
13	H. S.	59 M	R) Chronic otitis media	200 × 3	14	8.4	<i>S. aureus</i> <i>S. aureus</i> <i>E. agglomerans</i>	0.39 1.56 1.56	Poor	Unchanged	—
14	T. T.	69 M	Chronic otitis media	200 × 3	11	6.6	<i>P. aeruginosa</i> <i>P. aeruginosa</i>	0.78 6.25	Good	Unchanged	—
15	M. M.	84 F	R) Chronic otitis media	200 × 3	11	6.6	<i>S. aureus</i> <i>S. capitis</i> <i>E. agglomerans</i> <i>S. aureus</i> Group G β-Streptococcus	0.39 0.39 0.39 0.39 3.13	Poor	Unchanged	—
16	T. O.	77 M	R) Chronic otitis media	200 × 3	8	4.8	<i>S. aureus</i> <i>S. aureus</i>	1.56 1.56	Poor	Unchanged	—
17	H. S.	82 F	L) Chronic otitis media	200 × 3	8	4.8	<i>S. aureus</i> <i>S. epidermidis</i>	0.39 1.56	Excellent	Eradicated	—
18	S. Y.	65 F	L) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	14	8.4	<i>P. stuartii</i>	—	Good	Eradicated	—
19	K. T.	78 M	L) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	15	9.0	<i>A. calcoaceticus</i> <i>A. calcoaceticus</i>	1.56 6.25	Poor	Unchanged	—
20	S. M.	87 F	R) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	13	7.8	<i>S. aureus</i> <i>S. equisimilis</i> <i>P. aeruginosa</i>	3.13 3.13 0.39	Poor	Eradicated	—

Table 1-3. Clinical results of NY-198

Case No.	Name	Age (yrs.) Sex	Diagnosis	Treatment			Isolated organisms		Effect		Side-effects
				Daily dose (mg × times)	Duration (days)	Total dose (g)	Species	MIC (μg/ml)	Clinical	Bacteriological	
21	R. N.	53 F	L) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	7	4.2	<i>S. aureus</i> <i>S. aureus</i>	0.78 0.78	Good	Decreased	—
22	T. D.	61 M	R) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	8	4.8	Coagulase negative Staphylococci	—	Good	Eradicated	—
23	Y. U.	39 M	R) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	7	4.2	<i>S. aureus</i> <i>S. aureus</i>	3.13 0.39	Excellent	Unchanged	—
24	B. S.	63 M	L) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	8	4.8	No growth	—	Poor	Unknown	—
25	T. F.	83 M	L) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	8	4.8	<i>P. aeruginosa</i> <i>P. aeruginosa</i>	3.13 1.56	Fair	Unchanged	—
26	K. M.	62 M	L) Chronic otitis media (exacer.)	200 × 3	8	4.8	Fungi	—	Good	Unknown	—
27	K. K.	83 F	Furuncle of ear	200 × 3	3	1.8	<i>S. aureus</i> <i>S. hominis</i>	0.78 0.78	Good	Eradicated	Diarrhea
28	M. H.	32 M	Acute paranasal sinusitis	200 × 3	5	3.0	<i>Corynebacterium</i> sp.	6.25	Good	Eradicated	Diarrhea
29	A. I.	21 M	Acute paranasal sinusitis	200 × 3	10	6.0	No growth	—	Good	Unknown	—
30	B. U.	32 M	Acute paranasal sinusitis	200 × 3	7	4.2	<i>E. faecium</i> <i>S. pneumoniae</i>	1.56 6.25	Excellent	Replaced	—

Table 1-4. Clinical results of NY-198

Case No.	Name	Age (yrs.) Sex	Diagnosis	Treatment			Isolated organisms		Effect		Side-effects
				Daily dose (mg × times)	Duration (days)	Total dose (g)	Species	MIC (μg/ml)	Clinical	Bacteriological	
31	T. M.	30 M	Acute paranasal sinusitis	200 × 3	7	4.2	<i>Peptostreptococcus</i> sp.	—	Fair	Unknown	—
32	T. I.	67 F	Chronic paranasal sinusitis	200 × 3	7	4.2	<i>S. aureus</i>	0.78	Good	Eradicated	Abdominal discomfort
33	F. N.	61 F	Chronic paranasal sinusitis	200 × 3	5	3.0	No growth	—	Good	Unknown	—
34	M. O.	20 F	Chronic paranasal sinusitis	200 × 3	7	4.2	No growth	—	Good	Unknown	—
35	S. K.	30 M	Chronic paranasal sinusitis (exacer.)	200 × 3	8	4.8	<i>E. coli</i>	—	Good	Eradicated	—
36	K. Y.	43 M	Chronic paranasal sinusitis (exacer.)	200 × 3	7	4.2	No growth	—	Good	Unknown	—
37	S. S.	72 F	Chronic paranasal sinusitis (exacer.)	200 × 3	8	4.8	No growth	—	Fair	Unknown	—
38	M. M.	33 M	Chronic paranasal sinusitis (exacer.)	200 × 3	7	4.2	<i>S. epidermidis</i>	—	Good	Eradicated	—
39	K. T.	31 M	Acute tonsillitis	200 × 3	7	4.2	<i>H. influenzae</i>	—	Excellent	Eradicated	—
40	K. K.	56 M	Acute tonsillitis	200 × 3	4	2.4	α -Streptococcus α -Streptococcus	—	Excellent	Unchanged	—

Table 1-5. Clinical results of NY-198

Case No.	Name	Age (yrs.) Sex	Diagnosis	Treatment			Isolated organisms		Effect		Side-effects
				Daily dose (mg × times)	Duration (days)	Total dose (g)	Species	MIC (μg/ml)	Clinical	Bacteriological	
41	F. F.	26 F	Acute tonsillitis	200 × 3	6	3.6	<i>S. pyogenes</i> <i>S. agalactiae</i>	1.56	Good	Eradicated	—
42	M. K.	33 M	Acute tonsillitis	200 × 3	2	1.2	<i>S. pyogenes</i> <i>S. aureus</i>	0.025 0.78	Excellent	Eradicated	—
43	K. I.	37 F	Chronic tonsillitis	100 × 3	3	0.9	Group A β-Streptococcus <i>H. parahaemolyticus</i> α-Streptococcus	—	Good	Eradicated	—
44	A. S.	38 F	Chronic tonsillitis	200 × 3	5	3.0	α-Streptococcus α-Streptococcus	—	Excellent	Unchanged	—
45	K. O.	55 M	Chronic tonsillitis	200 × 3	7	4.2	α-Streptococcus	—	Good	Eradicated	—
46	S. O.	41 F	Chronic tonsillitis (exacer.)	200 × 3	7	4.2	<i>S. pyogenes</i>	3.13	Fair	Eradicated	—
47	T. T.	39 M	Acute pharyngitis	200 × 3	2	1.2	<i>S. pyogenes</i> <i>A. viridans</i> <i>Branhamella</i> sp.	6.25 12.5 0.20	Excellent	Eradicated	—
48	M. O.	29 M	Chronic pharyngitis (exacer.)	200 × 3	5	3.0	<i>S. salivarius</i>	6.25	Good	Eradicated	—
49	S. M.	55 M	Infectious preauricular fistula	200 × 3	11	6.6	<i>S. aureus</i> <i>Corynebacterium</i> sp.	1.56 6.25	Good	Eradicated	—

(exacer : exacerbation)

Table 2. Clinical efficacy of NY-198

Diagnosis		No. of cases	Excellent	Good	Fair	Poor	Efficacy rate (%)
Otitis media	Acute	5	3	1	1		4/5 (80)
	Chronic	12	1	2	2	7	3/12 (25)
	Chronic (exacer.)	9	1	4	1	3	5/9 (55.6)
Furuncle of ear		1		1			1/1 (100)
Paranasal sinusitis	Acute	4	1	2	1		3/4 (75)
	Chronic	3		3			3/3 (100)
	Chronic (exacer.)	4		3	1		3/4 (75)
Tonsillitis	Acute	4	3	1			4/4 (100)
	Chronic	3	1	2			3/3 (100)
	Chronic (exacer.)	1			1		0/1 (0)
Pharyngitis	Acute	1	1				1/1 (100)
	Chronic (exacer.)	1		1			1/1 (100)
Infectious preauricular fistula		1		1			1/1 (100)
Total		49	11	21	7	10	32/49 (65.3)

効2例, 無効7例で, 有効率25%, 慢性中耳炎・急性増悪9例では, 著効1例, 有効4例, やや有効1例, 無効3例で, 有効率55.6%, 耳癬の1例は有効, 急性副鼻腔炎4例では, 著効1例, 有効2例, やや有効1例で, 有効率75%, 慢性副鼻腔炎の3例は全例有効で有効率100%, 慢性副鼻腔炎・急性増悪4例では, 有効3例, やや有効1例で, 有効率75%, 急性扁桃炎4例では著効3例, 有効1例で有効率100%, 慢性扁桃炎3例では著効1例, 有効2例で有効率100%, 慢性扁桃炎・急性増悪の1例はやや有効, 咽頭炎2例は著効と有効, 感染耳瘻孔は有効であった。NY-198を投与した耳鼻咽喉科領域感染症49例の総合臨床効果は, Table 2に示すとおりで, 著効11例, 有効21例, やや有効7例, 無効10例で, 有効率65.3%であった。

副作用は, 49例中, 下痢2例, 胃部不快感2例の計4例に認められたがいずれも軽度であった。下痢のうち1例は本剤中止により治癒し, また胃部不快感2例は健胃薬により治癒した。臨床検査値異常は認められなかった。

分離菌別臨床効果は, Table 3に示すとおりである。臨床効果では, 最も多く検出された *Staphylococcus aureus* において, 単独感染では62.5%とやや低い結果を示したが, 混合感染では, 75%と単独感染に比べ高い有効率を示した。また *Pseudomonas aeruginosa* は単独, 混合感染あわせて7例に検出されたが, 28.6%と低い結

果であった。以上, 単独感染症例の有効率は60%, 混合感染症例の有効率は81.8%で, 単独感染に比べ混合感染の方が高い有効率を示した。

細菌学的効果においては, *S. aureus* 単独感染で, 消失率(消失+菌交代)は42.9%と低値を示したが, 混合感染では75%, 全体で60%であった。*P. aeruginosa* は単独, 混合感染合わせて28.6%と低い消失率であった (Table 4)。疾患別にみると, 中耳炎では, *S. aureus* で45.5%, *P. aeruginosa* で28.6%, 全体で45.5%の消失率であった。副鼻腔炎では, 検出菌株は少ないながら, 全体で100%の高い消失率であった。扁桃炎では, 頻度の多かった *Streptococcus pyogenes* で100%, 全体で75%の消失率を示した。

II 血中濃度と組織内濃度

1. 対象および方法

慢性副鼻腔炎患者5例, 肥厚性鼻炎患者1例の計6例に NY-198, 200mgを経口投与し, 投与後60分から180分間の血清ならびに組織(鼻茸, 下甲介, 上顎洞粘膜)への移行を検討した。濃度測定は HPLC 法にて行なった。

2. 結果

本剤経口投与後の血清および組織内濃度は Table 5に示すとおりである。

Table 3. Clinical efficacy of NY-198 classified by species of isolated organisms

Isolated organism		No. of cases	Excellent	Good	Fair	Poor	Efficacy rate (%)	
Single infection	G (+)	<i>S. aureus</i>	8	3	2		3	5/8 (62.5)
		<i>S. epidermidis</i>	2		1		1	1/2 (50)
		<i>S. pyogenes</i>	1			1		0/1 (0)
		<i>S. salivarius</i>	1		1			1/1 (100)
		α -Streptococcus	3	2	1			3/3 (100)
		Coagulase negative Staphylococci	1		1			1/1 (100)
		<i>Peptostreptococcus</i> sp.	1			1		0/1 (0)
	G (-)	<i>E. coli</i>	1		1			1/1 (100)
		<i>E. cloacae</i>	1			1		0/1 (0)
		<i>E. faecium</i>	1	1				1/1 (100)
		<i>A. calcoaceticus</i>	1				1	0/1 (0)
		<i>H. influenzae</i>	1	1				1/1 (100)
		<i>P. stuartii</i>	1		1			1/1 (100)
		<i>P. aeruginosa</i>	6		2	3	1	2/6 (33.3)
<i>Corynebacterium</i> sp.	1		1			1/1 (100)		
Sub total		30	7	11	6	6	18/30 (60)	
Mixed infection	<i>S. aureus</i> + <i>S. epidermidis</i>		1	1				1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. pyogenes</i>		1	1				1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. xylosum</i>		1		1			1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. hominis</i>		1		1			1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. intermedius</i>		1	1				1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>Corynebacterium</i> sp.		1		1			1/1 (100)
	<i>S. pyogenes</i> + <i>S. agalactiae</i>		1		1			1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. capitis</i> + <i>E. agglomerans</i>		1				1	0/1 (0)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. equisimilis</i> + <i>P. aeruginosa</i>		1				1	0/1 (0)
	<i>S. pyogenes</i> + <i>A. viridans</i> + <i>Branhamella</i> sp.		1	1				1/1 (100)
	Group A β -Streptococcus + <i>H. parahaemolyticus</i> + α -Streptococcus		1		1			1/1 (100)
Sub total		11	4	5		2	9/11 (81.8)	
Unknown		8		5	1	2	5/8 (62.5)	
Total		49	11	21	7	10	32/49 (65.3)	

鼻茸, 上顎洞粘膜内濃度は血清濃度と同等もしくは2~3倍と高い移行を示したが, 下甲介へはほとんど移行を示さなかった。

III 考 察

NY-198は新しく合成されたキノロン系抗菌剤であり, 従来の nalidixic acid (NA), piromidic acid (PA), pipemidic acid (PPA) の抗菌スペクトラムがグラム陰

性菌に限られていたのに対し, 本剤は NFLX, OFLX と同様, グラム陽性菌にも拡大されている¹⁻³⁾。

耳鼻咽喉科領域感染症の中では, 疾患により検出菌種は多少異なるが, *S. aureus*, *Haemophilus influenzae*, *Streptococcus pneumoniae* の頻度が高く^{4,5)}, NY-198 は, これらの菌種, 特に前二者に対して強い抗菌力をもつことが確かめられている¹⁾。

今回の臨床的検討に関して, まず中耳炎については,

Table 4. Bacteriological effect of NY-198 classified by species of isolated organisms

Isolated organisms		No. of cases	Eradicated	De-creased	Re-placed	Un-changed	Un-known	Eradicated rate (%)	
Single infection	G (+)	<i>S. aureus</i>	8	3	1		3	1	3/7 (42.9)
		<i>S. epidermidis</i>	2	2					2/2 (100)
		<i>S. pyogenes</i>	1	1					1/1 (100)
		<i>S. salivarius</i>	1	1					1/1 (100)
		α -Streptococcus	3	1			2		1/3 (33.3)
		Coagulase negative Staphylococci	1	1					1/1 (100)
		<i>Peptostreptococcus</i> sp.	1					1	
	G (-)	<i>E. coli</i>	1	1					1/1 (100)
		<i>E. cloacae</i>	1			1			1/1 (100)
		<i>E. faecium</i>	1			1			1/1 (100)
		<i>A. calcoaceticus</i>	1				1		0/1 (0)
		<i>H. influenzae</i>	1	1					1/1 (100)
		<i>P. stuartii</i>	1	1					1/1 (100)
		<i>P. aeruginosa</i>	6	1			5		1/6 (16.7)
		<i>Corynebacterium</i> sp.	1	1					1/1 (100)
Sub total		30	14	1	2	11	2	16/28 (57.1)	
Mixed infection	<i>S. aureus</i> + <i>S. epidermidis</i>		1	1					1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. pyogenes</i>		1	1					1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. xylosum</i>		1	1					1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. hominis</i>		1	1					1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. intermedius</i>		1		1				0/1 (0)
	<i>S. aureus</i> + <i>Corynebacterium</i> sp.		1	1					1/1 (100)
	<i>S. pyogenes</i> + <i>S. agalactiae</i>		1	1					1/1 (100)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. capitis</i> + <i>E. agglomerans</i>		1				1		0/1 (0)
	<i>S. aureus</i> + <i>S. equisimilis</i> + <i>P. aeruginosa</i>		1	1					1/1 (100)
	<i>S. pyogenes</i> + <i>A. viridans</i> + <i>Branhamella</i> sp.		1	1					1/1 (100)
	Group A β -Streptococcus + <i>H. parahaemolyticus</i> + α -Streptococcus		1	1					1/1 (100)
Sub total		11	9	1		1		9/11 (81.8)	
Total		41	23	2	2	12	2	25/39 (64.1)	

急性中耳炎では、80%の有効率を示したが、慢性中耳炎、慢性中耳炎・急性増悪ではそれぞれ25%、55.6%の有効率で、決して満足できる結果とは言えない。特に慢性中耳炎で有効率が低いことの理由として、*P. aeruginosa*が12例中4例に検出されたこと、本剤投与前に、種々の抗生剤、抗菌剤が奏効しなかった例が2例(症例6, 7)認められたことなどが挙げられる。副鼻腔炎は、急性、慢性とも良好な成績が得られ、全体で81.8%の有効率であった。扁桃炎も、87.5%と高い有効率を示した。

総合的には、中耳炎例の不良成績の影響があり、65.3%の有効率であった。

副作用は、49例中4例(下痢2例、胃部不快感2例)に認められたが、いずれも軽度であった。ニューキノロン剤と非ステロイド性消炎鎮痛剤との併用による痙攣発作が問題として挙げられるが、今回はそのような副作用は認めなかった。

組織、体液中移行に関して、少数例の検討では、特に上顎洞粘膜および鼻茸では血清濃度を上まわる例が認め

Table 5. Comparison of NY-198 (200mg) concentration in serum and tissues after single oral administration

Case No.	Name	Age Sex	Sampling time after administration (min.)	Concentration		
				Tissue ($\mu\text{g/g}$)	Serum ($\mu\text{g/ml}$)	
1	K. T.	52 F	90	Nasal polyp	0.45	
			120	Nasal polyp	0.53	
2*	S. A.	54 M	60	Nasal polyp	0.27	0.20
			90	Nasal polyp	0.14	
			120			0.71
			180			0.96
3*	S. A.	54 M	70	Mucosa of the maxillary sinus	1.10	1.15
4*	S. A.	54 M	75	Mucosa of the maxillary sinus	0.57	0.20
5	Y. T.	38 M	80	Nasal polyp	0.42	0.18
6	Y. S.	35 F	70	Inferior turbinate	0	0
			100	Inferior turbinate	0	0.11

* same diagnosis

られ、組織移行の面からも、有用性が高いと考える。しかしながら、下甲介粘膜への移行を検討した例では、血清濃度、組織内濃度ともに著しく低値を示した。血清濃度が低いため、組織内濃度が低かったものと考えられる。血清濃度の低値の理由については、薬剤投与上の問題、測定上の問題が挙げられるが明らかではない。

以上より、NY-198は、耳鼻咽喉科領域感染症に対して有用な薬剤であると考えられる。

文 献

- 1) 第35回日本化学療法学会総会，新薬シンポジウム (3)，NY-198。盛岡，1987
- 2) 伊藤 明，平井敬二，井上松久，三橋進：AM-715に関する細菌学的検討。Chemotherapy 29 (S-4)：1～11，1981
- 3) 佐藤謙一，井上松久，三橋進：DL-8280の *in vitro* および *in vivo* 抗菌活性評価。Chemotherapy 32 (S-1)：1～12，1984
- 4) 日吉正明，松尾隆晶，平田哲康，今手祐二，山田隆志，関谷 透，大山英樹，常岡英弘，奥園達也：化膿性中耳炎の検出菌とくに嫌気性菌について。日本耳鼻咽喉科感染症研究会会誌 2：90～93，1984
- 5) 馬場駿吉：上気道細菌感染の成立機序とその臨床。第89回日本耳鼻咽喉科学会総会宿題報告，1987

1) 第35回日本化学療法学会総会，新薬シンポジウム

CLINICO-PHARMACOLOGICAL STUDY ON NY-198 IN OTORHINOLARYNGOLOGY

TETSUYASU HIRATA and TORU SEKITANI

Department of Otorhinolaryngology, School of Medicine, Yamaguchi University, Yamaguchi

We performed a clinico-pharmacological study on NY-198, with the following results.

1. The efficacy against otorhinolaryngological infections was evaluated in 49 cases as: excellent 11, good 21, fair 7, and poor 10. The total efficacy rate was 65.3%.

The efficacy rate was 46.2% in otitis media (OM) (80% in acute OM, 25% in chronic OM, and 55.6% in exacerbation of chronic OM), 81.8% in paranasal sinusitis and 87.5% in tonsillitis.

2. Adverse reactions were observed in 4 of the 49 cases, including diarrhea in 2 and abdominal discomfort in 2. But these were mild and easily controlled.

3. Concentration of NY-198 in tissues was studied after oral administration of 200mg (2 capsules). Tissues consisting of nasal polyp, inferior turbinate, maxillary mucosa, and venous blood were collected for assaying. The concentration in nasal polyp and mucosa of the maxillary sinus was the same as or higher than in serum.