

呼吸器感染症に対する NY-198 の臨床的検討

副島 林造・川根 博司・二木 芳人・矢木 晋・中浜 力
渡辺 正俊・日野 二郎・中川 義久・角 優
川崎医科大学 呼吸器内科

北陸製薬株式会社で新しく開発されたキノロンカルボン酸系合成経口抗菌剤である NY-198 について抗菌力ならびに呼吸器感染症に対する臨床的検討を行ない以下の成績を得た。

1. 各種臨床分離株に対する NY-198 の抗菌力を ciprofloxacin (CPFX), ofloxacin (OFLX), norfloxacin (NFLX), enoxacin (ENX) と比較した結果, *Staphylococcus aureus*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Serratia marcescens*, *Proteus mirabilis*, *Pseudomonas aeruginosa* など 9 菌種に対する本剤の MIC は, ほぼ NFLX あるいは OFLX に類似するものであり, CPFX にはやや劣っていた。

2. 患者飼育インコより分離した *Chlamydia psittaci* および *Chlamydia trachomatis* 標準株 B. E. L₂ 株に対する MIC は 0.78~1.56 μg/ml であり, minocycline (MINO), doxycycline (DOXY) より劣るが erythromycin (EM) にほぼ匹敵する成績であった。

3. 呼吸器感染症 45 例に 1 回 200mg (1 例のみ 100mg) 1 日 2~3 回あるいは 1 回 300mg 1 日 2 回食後内服で 2~17 日間投与した結果, 効果判定可能であった 42 例中, 著効 4, 有効 29, やや有効 5, 無効 4 で有効率は 78.6% であった。

副作用は, 嘔気, 頭痛, フラフラ感, 発疹などが 3 例 (6.7%) に認められたがいずれも重篤なものではなく, 臨床検査値異常は 4 例に GOT あるいは GPT の軽度上昇, 1 例に好酸球増多を認めたのみであった。

以上の成績から NY-198 は呼吸器感染症に対して有効で, 比較的安全性も高い薬剤であると考えられた。

NY-198 は北陸製薬株式会社で開発された経口抗菌剤で, その化学構造は Fig. 1 に示す如く, キノロンカルボン酸を基本骨格として 1 位にエチル基, 6 位, 8 位にフッ素ならびに 7 位に 3-メチルピペラジノ基を有している。

本剤は殺菌的に作用し, 嫌気性菌を含むグラム陽性菌, グラム陰性菌に対して広範囲な抗菌スペクトラムと強い抗菌活性を有しており, 種々の薬剤耐性菌に対しても優れた抗菌力を有している¹⁾。さらに体内動態に関しても血中半減期が 6~8 時間と長く各組織への移行も良好であり, 臨床的有用性を期待し得る薬剤であると考えられ

る²⁾。

今回我々は NY-198 について各種臨床分離細菌ならびに *Chlamydia* に対する MIC を測定し, 呼吸器感染症患者を対象として臨床的有効性ならびに安全性について検討を行ない若干の知見を得たので報告する。

I 研究方法

1. 抗菌力

使用菌株は臨床分離の *Staphylococcus aureus*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Serratia marcescens*, *Proteus mirabilis*, indole positive *Proteus* sp., *Pseudomonas aeruginosa*, *Pseudomonas cepacia*, *Acinetobacter calcoaceticus* である。MIC の測定は日本化学療法学会標準法に従い, pH7.2 の Mueller-Hinton agar を用いた平板希釈法により行ない, 同時に ciprofloxacin (CPFX), ofloxacin (OFLX), norfloxacin (NFLX), enoxacin (ENX) の MIC を測定し比

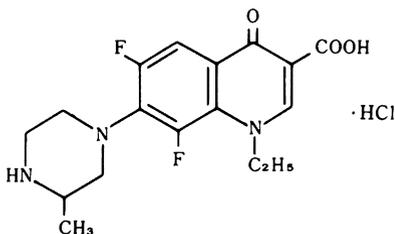


Fig. 1. Chemical structure of NY-198

Table 1. Susceptibility of various clinical isolates to NY-198 and related antibacterial agents

Organism	Anti-biotic	No. of strains tested	MIC ($\mu\text{g/ml}$)															
			≤ 0.025	0.05	0.1	0.18	0.39	0.78	1.56	3.13	6.25	12.5	25	50	100	100<		
<i>S. aureus</i>	NY-198	44					5	21	7	7	4							
	CPFX					3	27	10	4									
	OFLX					3	27	7	5	2								
	NFLX						1	22	9	3	7	2						
ENX					5	24	3	6	6									
<i>E. coli</i>	NY-198	42		3	26	8		3	2									
	CPFX		38	2		1	1											
	OFLX		9	2	24	6	1											
	NFLX			7	27	6	1		1									
ENX		2	16	23				1										
<i>K. pneumoniae</i>	NY-198	48			15	23	4	1	2	3								
	CPFX		6	29	5	4	1	2	1									
	OFLX		1	2	30	12	3	3										
	NFLX				27	13	3	1	4									
ENX				7	32	5	1	1	2									
<i>S. marcescens</i>	NY-198	50			1	30	14	4			1							
	CPFX			11	30	8			1									
	OFLX				5	36	6	2			1							
	NFLX			1	22	19	6	1			1							
ENX			5	36	6	2				1								
<i>P. mirabilis</i>	NY-198	50			1	20	22	5	2									
	CPFX		10	27	10	3												
	OFLX				5	26	15	4										
	NFLX			3	28	9	8	2										
ENX				13	27	8	2											
Indole positive <i>Proteus sp.</i>	NY-198	25		4	1	15	4	1										
	CPFX		13	9	3													
	OFLX				15	9	1											
	NFLX		2	12	8	2	1											
ENX				5	16	4												
<i>P. aeruginosa</i>	NY-198	50						10	22	7	8	3						
	CPFX			2	7	22	12	5	2									
	OFLX						1	9	22	12	6							
	NFLX						10	21	10	8	1							
ENX					8	15	11	13	3									
<i>P. cepacia</i>	NY-198	30					4	6	2	6	8	3				1		
	CPFX				2	5	4	4	8	6	1							
	OFLX					2	7	1	9	1	7	1	1			1		
	NFLX						2	1	6	4	3	12	1			1		
ENX					3	4	4	5	5	8		1			1			
<i>A. calcoaceticus</i>	NY-198	40			1	2	22	13	2									
	CPFX			1		17	18	4										
	OFLX			1		12	20	6	1									
	NFLX					1	2	13	17	6	1							
ENX						8	21	10	1									

較した。

Chlamydia に対する抗菌力は *Chlamydia psittaci* MP 株と患者飼育インコより分離した 3 株, *Chlamydia trachomatis* B. E. L₂ 株について MIC を測定した。測定法は culture dish well 内に 10% FCS 含有 MEM 培地で培養した単層 L 細胞に、各々 $10^5 \sim 10^6$ IFU/well の

chlamydia を接種して感染成立後、各種抗生剤を添加し CO₂ インキュベーター内で 36~48 時間培養後、*C. psittaci* はギムザ染色、*C. trachomatis* はヨード染色を行ない、封入体形成のみられない最小薬剤濃度を MIC と判定した。

Table 2. Antimicrobial activity of NY-198 against *Chlamydia*

Drug	MIC ($\mu\text{g/ml}$)	
	<i>C. psittaci</i>	<i>C. trachomatis</i>
NY-198	0.78 ~ 1.56	1.56
NFLX	3.13	12.5
OFLX	0.78	0.39
CPFEX	0.18 ~ 0.39	0.78
EM	1.56	0.78 ~ 1.56
MINO	0.025 >	0.025 >
DOXY	0.025 ~ 0.1	0.025 >
RFP	0.025	0.025 >
Inoculum size	$10^5 \sim 10^6$ IFU/well	$10^5 \sim 10^6$ IFU/well
Test strain	MP strain, 3 isolated strains	B. E. L ₂ strains
Host cell	L-929 cell	L-929 cell

2. 臨床的検討

本剤使用症例は45例でその内訳は、急性気管支炎2例、肺炎4例、気管支拡張症14例、慢性気管支炎14例、肺気腫4例、その他の呼吸器感染症7例、計45例である。年齢分布は18~83歳平均57.6歳であり、性別は男子21例、女子24例である。

使用量は1回200mg (1例のみ100mg) 1日2~3回あるいは1回300mg 1日2回投与で2日から最長17日間使用した。

臨床効果は、発熱、咳嗽、喀痰などの自覚症状、および胸部X線写真、赤沈値、CRP、白血球数など検査所見の改善の程度ならびに起炎菌消失の有無により、著効、有効、やや有効、無効の4段階で判定した。同時に本剤使用前後の末梢血液像、肝・腎機能の変化についても検討した。

II 成績

1. 抗菌力

臨床分離の*S. aureus* 44株、*E. coli* 42株、*K. pneumoniae* 48株、*S. marcescens*、*P. mirabilis*、*P. aeruginosa* 各50株、indole positive *Proteus* sp. 25株、*P. cepacia* 30株、*A. calcoaceticus* 40株に対するMICはTable 1に示した。

S. aureus に対する本剤のMICのピークは $0.78\mu\text{g/ml}$ でNFLX、ENXと同等であり、CPFEX、OFLXに1管程度劣る。

その他*E. coli*では $0.1\mu\text{g/ml}$ 、*K. pneumoniae*、*S. marcescens*、*P. mirabilis*、indole positive *Proteus* sp.、*A. calcoaceticus*では $0.18 \sim 0.39\mu\text{g/ml}$ 、*P. aeruginosa*では $1.56\mu\text{g/ml}$ にMICのピークを認め、ほぼOFLX、

NFLXに類似した成績であるがCPFEXより若干劣っている。

Chlamydia に対するMICはTable 2に示す如く、*C. psittaci* に対しては $0.78 \sim 1.56\mu\text{g/ml}$ 、*C. trachomatis* に対しては $1.56\mu\text{g/ml}$ のMICを示しており、NFLXより優れているがCPFEXよりやや劣る。Erythromycin (EM) とほぼ同等であるがminocycline (MINO)、doxycycline (DOXY)、rifampicin (RFP) にはかなり劣る成績である。

2. 臨床的検討

本剤使用症例の年齢、性別、感染症診断名、基礎疾患名、分離菌、投与量、投与日数および臨床効果、細菌学的効果判定の一覧をTable 3に示した。

Table 4には効果判定の可能であった42例の各疾患別の臨床効果をまとめて示したが、42例中著効4例、有効29例、やや有効5例、無効4例で有効率78.6%であった。疾患別にみると急性気管支炎の2例では1例、肺炎の3例では2例、気管支拡張症の14例では12例(85.7%)、慢性気管支炎の14例では11例(78.6%)、肺気腫の4例では2例、その他の呼吸器感染症5例では全例に有効以上の効果がみられている。

尚各投与法別の有効率は200mg 1日3回で77.3% (22例中17例に有効)、300mg 1日2回で75% (8例中6例有効)、200mg 1日2回で81.8% (11例中9例有効)であり、特に投与法別に有意差は認められなかった。

本剤投与例における細菌学的効果はTable 5に示した。*S. aureus* に対する除菌効果が50%とやや低率であったが、*Streptococcus pneumoniae*、*Haemophilus influenzae* など多くの菌に対して100%の除菌効果が認められ、*P. aeruginosa* に対しても71.4%と比較的高い除

Table 3-1. Clinical efficacy of NY-198

Case	Age Sex	Diagnosis	Underlying dis. or Complication	Isolated Organism	Daily dose and Duration (mg × times × days)	Evaluation		Side-effects
						Bact.	Clinical	
1. J. S.	39 M	Acute bronchitis	Asthma	N. D.	200 × 3 × 7	Unknown	Good	GPT ↑
2. K. M.	41 M	Acute bronchitis	None	<i>S. pneumoniae</i>	200 × 3 × 11	Unevaluable	Fair	—
3. T. I.	65 F	Pneumonia	None	<i>S. pneumoniae</i>	200 × 3 × 7	Eradicated	Poor	—
4. I. O.	79 M	Pneumonia	P. emphysema	N. F.	200 × 3 × 14	Unevaluable	Good	GOT ↑ GPT ↑
5. S. K.	56 F	Pneumonia	Polymyositis	<i>S. pneumoniae</i>	200 × 2 × 2	Unevaluable	Unevaluable	—
6. R. S.	55 F	Pneumonia	Bronchiectasis	<i>S. pneumoniae</i>	300 × 2 × 5	Eradicated	Excellent	—
7. T. M.	37 F	Bronchiectasis	Chronic sinusitis	<i>H. influenzae</i>	200 × 3 × 7	Eradicated	Excellent	—
8. I. N.	35 F	Bronchiectasis	None	N. F.	200 × 3 × 7	Unevaluable	Excellent	—
9. T. Y.	63 F	Bronchiectasis	None	<i>H. influenzae</i>	200 × 2 × 7	Eradicated	Good	—
10. Y. Y.	61 F	Bronchiectasis	Chronic sinusitis	<i>H. influenzae</i>	200 × 3 × 14	Eradicated	Excellent	—
11. T. N.	60 F	Bronchiectasis	Middle lobe syndrome	<i>H. influenzae</i> <i>S. aureus</i>	200 × 2 × 7	→ <i>S. pneumoniae</i>	Good	—
12. T. A.	72 F	Bronchiectasis	None	<i>H. influenzae</i>	200 × 3 × 5	Eradicated	Good	—
13. M. S.	63 F	Bronchiectasis	None	<i>S. aureus</i>	300 × 2 × 7	Persisted	Fair	—
14. T. Y.	63 F	Bronchiectasis	None	<i>S. aureus</i>	300 × 2 × 7	Eradicated	Good	—
15. C. G.	61 F	Bronchiectasis	None	N. D.	300 × 2 × 7	Unknown	Good	—

Table 3-2. Clinical efficacy of NY-198

Case	Age Sex	Diagnosis	Underlying dis. or Complication	Isolated Organism	Daily dose and Duration (mg × times × days)	Evaluation		Side-effects
						Bact.	Clinical	
16. S. S.	50 M	Bronchiectasis	None	N. D.	300 × 2 × 7	Unknown	Good	—
17. K. S.	18 M	Bronchiectasis	Respir. failure	<i>P. aeruginosa</i>	200 × 3 × 8	Persisted	Poor	—
18. H. I.	55 F	Bronchiectasis	None	<i>P. aeruginosa</i>	200 × 3 × 7	Eradicated	Good	—
19. D. Y.	18 M	Bronchiectasis	None	<i>H. parainfluenzae</i>	200 × 3 × 3	Unknown	Good	Nausea Vomiting Headache Wooziness
20. H. Y.	57 F	Bronchiectasis	Chronic sinusitis	<i>P. aeruginosa</i> <i>S. aureus</i>	300 × 2 × 17	→ <i>S. aureus</i>	Good	—
21. T. M.	58 M	Chronic bronchitis	Chronic hepatitis	<i>H. influenzae</i> <i>Klebsiella</i> sp.	200 × 2 × 7	→ β-streptococcus group B	Fair	—
22. E. O.	54 M	Chronic bronchitis	Chronic sinusitis	<i>H. influenzae</i>	200 × 3 × 7	Eradicated	Good	—
23. T. H.	62 M	Chronic bronchitis	P. emphysema	N. F.	200 × 3 × 7	Unevaluable	Good	—
24. K. O.	67 F	Chronic bronchitis	Old pulm. tuberculosis	<i>H. influenzae</i>	200 × 3 × 10	Eradicated	Good	—
25. K. O.	58 M	Chronic bronchitis	Chronic sinusitis	<i>P. aeruginosa</i>	200 × 2 × 7	→ <i>S. pneumoniae</i>	Good	—
26. S. M.	49 F	Chronic bronchitis	Hypertension	<i>S. epidermidis</i>	200 × 2 × 10	Eradicated	Good	—
27. K. M.	55 M	Chronic bronchitis	Chronic sinusitis	N. F.	200 × 2 × 14	Unevaluable	Good	GOT ↑
28. K. I.	83 F	Chronic bronchitis	Asthma Respir. failure	<i>P. aeruginosa</i>	200 × 3 × 6 100 × 3 × 1	→ <i>P. mendocina</i>	Good	Skin rash Woosiness
29. E. I.	57 F	Chronic bronchitis	P. fibrosis	N. F.	300 × 2 × 6	Unevaluable	Poor	—
30. H. T.	67 M	Chronic bronchitis	Old pulm. tuberculosis	<i>X. maltophilia</i> <i>A. calcoaceticus</i>	200 × 3 × 11	Eradicated	Fair	GOT ↑

Table 3-3. Clinical efficacy of NY-198

Case	Age Sex	Diagnosis	Underlying dis. or Complication	Isolated Organism	Daily dose and Duration (mg × times × days)	Evaluation		Side-effects
						Bact.	Clinical	
31. H. H.	57 F	Chronic bronchitis	None	N. F.	200 × 3 × 7	Unevaluable	Good	—
32. K. I.	69 F	Chronic bronchitis	Hypertension	<i>P. aeruginosa</i>	100 × 3 × 17	Eradicated	Good	—
33. H. S.	54 F	Chronic bronchitis	Dermatomyositis	N. F.	200 × 3 × 7	Unevaluable	Good	Eosinophilia
34. A. T.	71 M	Chronic bronchitis	Hepatoma	N. F.	200 × 2 × 12	Unevaluable	Good	—
35. K. O.	77 M	Pulmonary emphysema	Chronic heart failure	<i>H. influenzae</i>	200 × 3 × 7	Eradicated	Fair	—
36. K. U.	78 M	Pulmonary emphysema	Cancer of the oral floor	<i>E. cloacae</i> <i>K. pneumoniae</i>	200 × 3 × 6	→ <i>E. cloacae</i>	Good	—
37. K. D.	79 M	Pulmonary emphysema	Hypertension	<i>A. calcoaceticus</i>	200 × 2 × 14	Eradicated	Poor	Nausea
38. Y. A.	68 M	Pulmonary emphysema	Chronic respir. failure	<i>H. influenzae</i>	300 × 2 × 7	Eradicated	Good	—
39. H. O.	25 M	Bronchial asthma with infection	None	N. F.	200 × 2 × 6	Unevaluable	Good	—
40. S. O.	51 F	Bronchial asthma with infection	Depression	N. F.	200 × 3 × 7	Unevaluable	Good	—
41. T. S.	56 F	Bronchial asthma with infection	None	<i>B. catarrhalis</i>	200 × 2 × 7	Eradicated	Good	—
42. T. T.	44 M	Mixed infection of pul. tuberculosis	P. tuberculosis	N. F.	300 × 2 × 5	Unevaluable		—
43. Y. O.	75 M	Mixed infection of old p. tuberculosis	Old pulm. tuberculosis	N. F.	200 × 2 × 7	Unevaluable	Good	—
44. O. K.	68 M	Mixed infection of pleuritis	Lung cancer Pleuritis	N. F.	300 × 2 × 7	Unevaluable		—
45. K. K.	64 F	Mixed infection of old p. tuberculosis	Old pulm. tuberculosis	<i>P. aeruginosa</i>	200 × 3 × 7	Persisted	Good	—

Table 4. Overall clinical efficacy of NY-198

Diagnosis	Number of cases	Clinical evaluation				Efficacy rate (%)
		Excellent	Good	Fair	Poor	
Acute bronchitis	2		1	1		50.0
Pneumonia	3	1	1		1	66.7
Bronchiectasis	14	3	9	1	1	85.7
Chronic bronchitis	14		11	2	1	78.6
Pulmonary emphysema	4		2	1	1	50.0
Others	5		5			100
Total	42	4	29	5	4	78.6

Table 5. Bacteriological response to NY-198

Organism	Number of strains	Bacteriological evaluation			Eradication rate (%)
		Eradicated	Persisted	Replaced	
<i>S. aureus</i>	4	1	2	1	50.0
<i>S. epidermidis</i>	1	1			100
<i>S. pneumoniae</i>	2	2			100
<i>K. pneumoniae</i>	2	1		1	100
<i>E. cloacae</i>	1		1		0
<i>P. aeruginosa</i>	7	3	2	2	71.4
<i>X. maltophilia</i>	1	1			100
<i>A. calcoaceticus</i>	2	2			100
<i>H. influenzae</i>	10	8		2	100
<i>B. catarrhalis</i>	1	1			100
Total	31	20	5	6	83.9

菌効果が認められた。

副作用は3例に認められ、その内訳は発疹、フラフラ感が1例、嘔気のみ1例、嘔気・嘔吐、頭痛、フラフラ感が1例であり、1回200mg 1日3回投与例が2例、1日2回投与例が1例である。いずれも重篤なものではなく、服薬中止または終了後直ちに改善している。

臨床検査成績では Fig. 2, 3 に示す如く、1例に好酸球増多を、4例に GOT あるいは GPT の軽度上昇を認めたのみであり、その他肝・腎機能、末梢血液像で本剤によると考えられる異常は認められなかった。

III 考 察

NFLX に始まるいわゆるニューキノロン剤は抗菌スペクトラムならびに抗菌力はきわめて優れたものであり、methicillin-resistant *S. aureus* (MRSA) を含む耐性ブドウ球菌から緑膿菌にまで幅広い抗菌活性を有してお

り、抗緑膿菌作用を有する唯一の経口抗菌剤である。

NFLX³⁾以来我々は OFLX⁴⁾、ENX⁵⁾さらに CPFX⁶⁾について、主として呼吸器感染症に対する臨床評価を行ないその有用性について報告してきた。今回の NY-198 は抗菌力は NFLX、OFLX とほぼ同等であり CPFX にやや劣るが、血中半減期が6~8時間と長く、良好な組織移行性から、実験的マウス感染症に対する感染防御効果も他のニューキノロン剤に比し優れた効果を示しており、臨床的有効性が示唆されている。

我々が今回検討した臨床成績では、呼吸器感染症45例中効果判定が可能であった42例中著効4例、有効29例で有効率78.6%であった。特に慢性気管支炎や気管支拡張症など慢性気道感染症で78.6%~85.7%と優れた有効率が得られている。さらに細菌学的効果では83.9%の除菌率を示しており高く評価し得るものと考えられる。緑膿菌分離7例中3例が消失、2例に菌交代がみられており71.4%と高い除菌率を示しているが、全国集計による

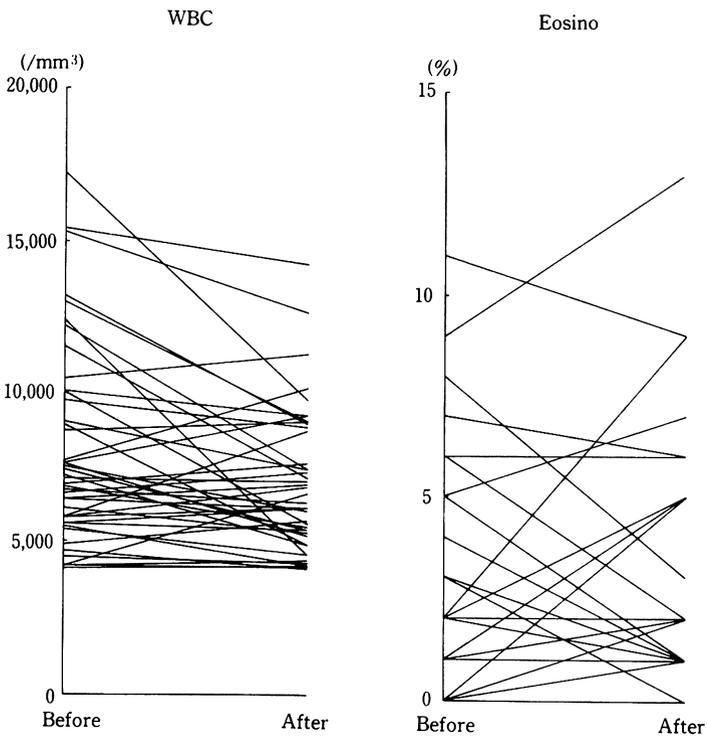
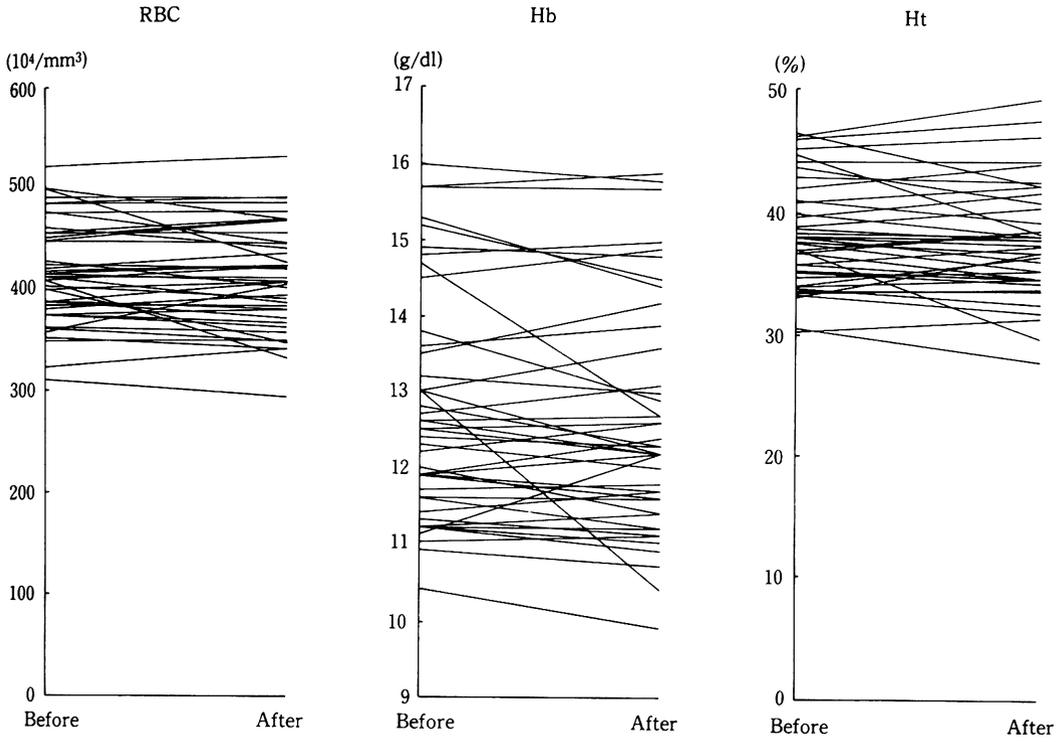


Fig. 2. Laboratory findings before and after NY-198 treatment (1)

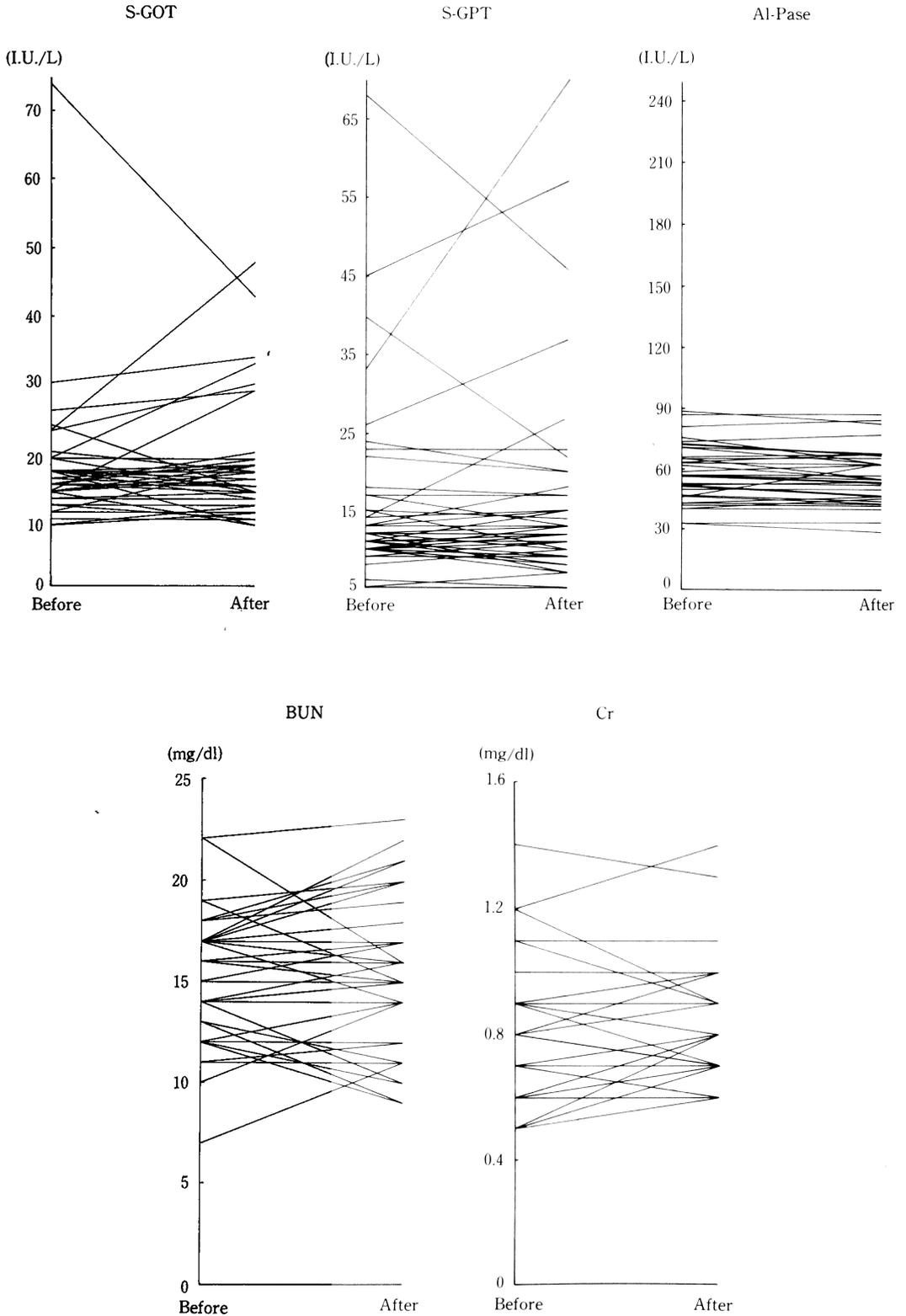


Fig. 3. Laboratory findings before and after NY-198 treatment (2)

成績では全体の除菌効果は80%と優れていたが、緑膿菌に対しては33.9%と低率であり、緑膿菌感染に対しては今後さらに投与量、投与方法など検討が必要であろう。

副作用も45例中3例(6.7%)にみられたのみであり、いずれも重篤なものではなく、全国集計でも2,546例中88例(3.5%)と比較的低率である。

その他ニューキノロン剤ではテオフィリンや非ステロイド系消炎鎮痛剤などとのdrug interactionが問題になっているが、少なくとも本剤はテオフィリンとの併用投与でほとんどテオフィリンの血中濃度に影響はなく臨床的に問題はないと考えられる⁷⁾。

以上の成績から本剤は呼吸器感染症、特に慢性気道感染症に対して経口剤としてきわめて高い有用性と十分な安全性が期待出来る薬剤であると考えられた。

文 献

- 1) HIROSE, T.; E. OKEZAKI, H. KATO, Y. ITO, M. INOUE & S. MITSUHASHI: *In vitro* and *in vivo* activity of NY-198, a new difluorinated

quinolone. *Antimicrob. Agents and Chemother.* 31: 854~859, 1987

- 2) 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
- 3) 副島林造, 二木芳人, 川西正泰, 松島敏春, 田野吉彦, 加藤 収, 矢木 晋, 原 宏紀, 莊田恭聖: AM-715に関する基礎的・臨床的研究. *Chemotherapy* 29 (S-4): 335~342, 1981
- 4) 副島林造, 二木芳人, 川西正泰, 松島敏春, 川根博司, 中浜 力, 渡辺正俊, 日野二郎: DL-8280に関する基礎的研究と主として呼吸器感染症に対する臨床的検討. *Chemotherapy* 32 (S-1): 443~453, 1984
- 5) 二木芳人, 日野二郎, 渡辺正俊, 中浜 力, 川西正泰, 松島敏春, 副島林造: AT-2266の基礎的・臨床的研究. *Chemotherapy* 32 (S-3): 554~561, 1984
- 6) 二木芳人, 中川義久, 角 優, 岸本寿男, 日野二郎, 渡辺正俊, 松島敏春, 副島林造: BAY o9867に関する臨床的研究—主として呼吸器感染症に対する有効性ならびに安全性の検討—. *Chemotherapy* 33 (S-7): 475~485, 1985
- 7) 副島林造, 二木芳人, 渡辺正俊: 経口抗菌剤の現状と展望. *Prog. Med.* 7 (supple 1): 2157~2165, 1987

NY-198 IN RESPIRATORY TRACT INFECTIONS

RINZO SOEJIMA, HIROSHI KAWANE, YOSHIHITO NIKI, SUSUMU YAGI, CHIKARA NAKAHAMA,
MASATOSHI WATANABE, JIRO HINO, YOSHIHISA NAKAGAWA and MASARU SUMI
Division of Respiratory Diseases, Department of Medicine, Kawasaki Medical School, Kurashiki

Bacteriological and clinical studies of NY-198, a new quinolone derivative, were carried out and the following results were obtained.

1) Antimicrobial activity of NY-198 against various clinical isolates was compared with those of CPF, OFLX, NFLX and ENX. The activity of NY-198 against 9 bacterial strains including *S. aureus*, *E. coli*, *K. pneumoniae*, *S. marcescens*, *P. mirabilis* and *P. aeruginosa* was almost equal to those of NFLX and OFLX, but somewhat inferior to that of CPF.

2) The MICs of NY-198 against *C. psittaci* strains isolated from budgerigars kept by patients and *C. trachomatis* B. E. L₂ standard strains, were 0.78-1.56 μg/ml, which were almost equal to those of EM, though inferior to those of MINO and DOXY.

3) Forty-five patients with respiratory tract infection were given 200mg (100mg in one case) of NY-198 two or three times a day or 300mg two times a day for 2-17 days. The efficacy of the drug was evaluated in 42 cases: it was excellent in 4, good in 29, fair in 5, and poor in 4 cases, with an efficacy rate of 78.6%. Side-effects were observed in 3 patients (6.7%) who complained of nausea, vomiting, headache, wooziness and eruption; but these symptoms were very slight. Abnormal laboratory findings observed were: slight elevation of GOT or GPT in 4 cases and eosinophilia in one.

From these results, we conclude that NY-198 is an extremely useful and safe oral antibacterial agent for the treatment of respiratory tract infections.