

## T-3262 に関する基礎的臨床的検討

加藤 政仁・林 嘉光・松浦 徹・武内 俊彦  
名古屋市立大学医学部第一内科\*

南 條 邦 夫  
名古屋市立城西病院内科

新しいピリドンカルボン酸系抗菌剤である T-3262 について抗菌力ならびに臨床効果を検討し以下の結果を得た。

1) 抗菌力：臨床材料から分離した *Staphylococcus aureus* (*S. aureus*), *Escherichia coli* (*E. coli*), *Klebsiella pneumoniae* (*K. pneumoniae*), *Proteus mirabilis* (*P. mirabilis*), *Proteus vulgaris* (*P. vulgaris*), *Morganella morganii* (*M. morganii*), *Serratia marcescens* (*S. marcescens*), *Pseudomonas aeruginosa* (*P. aeruginosa*) などの各種細菌 203 株について本剤の MIC を測定し、同系の抗菌剤である ofloxacin (OFLX), enoxacin (ENX), ciprofloxacin (CPF) の成績と比較した。本剤は *S. aureus*, *S. marcescens* に対して OFLX, ENX や CPF より優れた抗菌力を示した。*E. coli*, *K. pneumoniae*, *P. vulgaris*, *P. aeruginosa* に対しては OFLX, ENX より優れ, CPF と同等の抗菌力であった。*P. mirabilis*, *M. morganii* に対しては OFLX, ENX より優れるが, CPF より劣る抗菌力であった。

2) 臨床的検討：急性扁桃炎 1 例, 急性気管支炎 3 例, 肺炎 4 例, 慢性気管支炎, びまん性汎細気管支炎, 中葉症候群などに伴う慢性気道感染症急性増悪 5 例, 肺結核 1 例の計 14 例に T-3262 を使用し, 肺結核を除く 13 例を効果判定対象とした。臨床効果は著効 1 例, 有効 9 例, やや有効 2 例, 無効 1 例であり有効以上は 76.9% やや有効以上は 92.3% であった。細菌学的効果は, びまん性汎細気管支炎例での *P. aeruginosa* が除菌されなかった。副作用として全身掻痒感 1 例, 食欲不振 1 例。臨床検査値異常として好酸球増加 1 例, GPT 上昇 2 例がみられたがいずれも軽度であった。

**Key words** : T-3262, 試験管内抗菌力, 呼吸器感染症, 臨床効果

T-3262 は富山化学工業株式会社によって開発された新しいピリドンカルボン酸系抗菌剤である。その構造式は Fig. 1 に示す通りである<sup>1)</sup>。今回私どもは本剤について基礎的, 臨床的に検討したのでその結果について報告する。

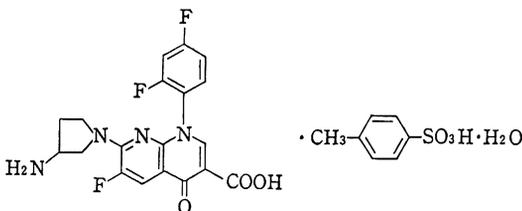


Fig. 1. Chemical structure of T-3262.

## I. 研究方法

### 1. 試験管内抗菌力

昭和 58 年 1 月から昭和 59 年 9 月までに当科で分離さ

れた *Staphylococcus aureus* (*S. aureus*) 27 株, *Escherichia coli* (*E. coli*) 27 株, *Klebsiella pneumoniae* (*K. pneumoniae*) 27 株, *Proteus mirabilis* (*P. mirabilis*) 27 株, *Proteus vulgaris* (*P. vulgaris*) 27 株, *Morganella morganii* (*M. morganii*) 22 株, *Serratia marcescens* (*S. marcescens*) 20 株, *Pseudomonas aeruginosa* (*P. aeruginosa*) 26 株について日本化学療法学会標準法<sup>2)</sup>により T-3262 の MIC を測定し, 同系の抗菌剤である ofloxacin (OFLX), enoxacin (ENX), ciprofloxacin (CPF) の成績と比較した。接種菌量は  $10^8$  cells/ml である。

### 2. 臨床的検討

各種呼吸器感染症 14 例に T-3262 を投与し, 臨床効果, 細菌学的効果, 副作用について検討した。

#### 1) 対象症例

投与対象は昭和 61 年 11 月から昭和 62 年 3 月までに

名古屋市立大学医学部第一内科および関連病院である名古屋市立城西病院内科に外来通院または入院し、試験参加の同意を得た 14 例である。男性 10 例、女性 4 例で年齢は 23~88 歳 (平均 57.1 歳) である。疾患の内訳は急性扁桃炎 1 例、急性気管支炎 3 例、肺炎 4 例、慢性気管支炎、びまん性汎細気管支炎、中葉症候群などに伴う慢性気道感染症急性増悪 5 例、肺結核 1 例の計 14 例であり、肺結核を除く 13 例を効果判定対象とした。副作用および臨床検査値異常の検討は全例を対象とした。

## 2) 投与量および投与方法

1 日投与量は 450 mg (分 3) が 13 例、1 日投与量 600 mg (分 2) が 1 例であり、1 日 3 回投与では毎食後 30 分に、1 日 2 回投与では朝食後および夕食後 30 分に投与した。投与日数は 4~21 日 (平均 10.4 日)、総投与量は 1.5~9.45 g (平均 4.7 g) であった。

## 3) 効果判定基準

効果判定は臨床効果と細菌学的効果に分けて検討した。臨床効果は体温、咳嗽、喀痰の量および性状、胸部レ線像、白血球数、CRP、 $\uparrow$ 赤沈値などの改善を指標として、次のような基準により各主治医が判定した。

著効 (Excellent): 本剤投与後 7 日以内に自覚的所見の著しい改善がみられたもの。

有効 (Good): 本剤投与後 7 日以内に自覚的所見の明らかな改善がみられたもの。

やや有効 (Fair): 本剤投与後 7 日以内に自覚的所見の軽度の改善がみられたもの。

無効 (Poor): 本剤投与後 7 日以内に自覚的所見の改善がみられなかったもの。

判定不能 (Unknown): 臨床効果を判定できないもの。

細菌学的効果は分離菌の動向により消失 (Eradicated), 減少 (Decreased), 菌交代 (Replaced), 不変 (Unchanged), 不明 (Unknown) に判定した。

## II. 研究成績

### 1. 試験管内抗菌力

#### 1) *S. aureus*

Fig. 2 に示すように T-3262 の MIC は全株 0.05  $\mu$ g/ml 以下に分布した。OFLX は 0.05  $\mu$ g/ml 以下~0.39  $\mu$ g/ml に分布し、そのピークは 0.2  $\mu$ g/ml にあった。ENX は 0.2~1.56  $\mu$ g/ml に分布し、そのピークは 0.78  $\mu$ g/ml にあった。CPFAX は 0.05  $\mu$ g/ml 以下~0.78  $\mu$ g/ml に分布し、そのピークは 0.2  $\mu$ g/ml にあった。T-3262 は他剤に比して優れた成績であった。

#### 2) *E. coli*

Fig. 3 に示すように T-3262 の MIC は全株 0.05  $\mu$ g/ml 以下に分布した。OFLX は 0.05  $\mu$ g/ml 以下~0.1  $\mu$ g/ml に分布し、そのピークは 0.05  $\mu$ g/ml 以下にあ

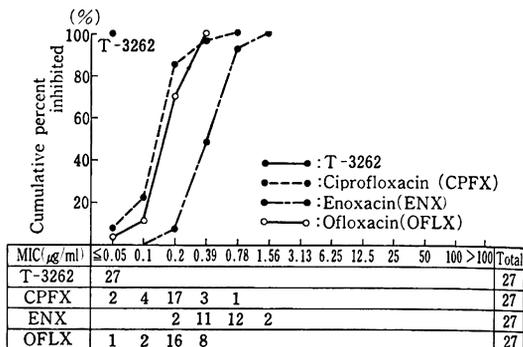


Fig. 2. Sensitivity distribution of clinical isolates of *Staphylococcus aureus* (27 strains). ( $10^6$  cfu/ml)

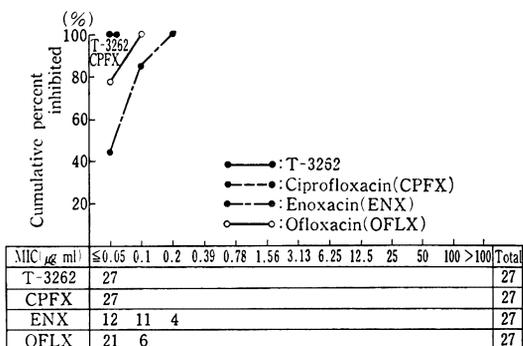


Fig. 3. Sensitivity distribution of clinical isolates of *Escherichia coli* (27 strains). ( $10^6$  cfu/ml)

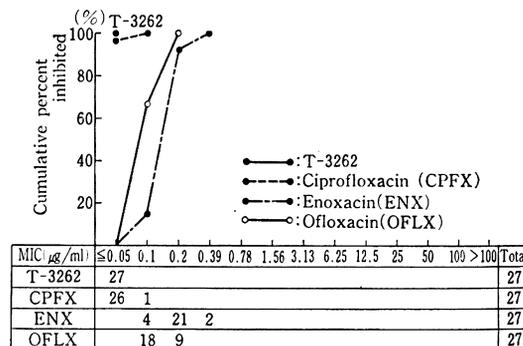


Fig. 4. Sensitivity distribution of clinical isolates of *Klebsiella pneumoniae* (27 strains). ( $10^6$  cfu/ml)

った。ENX は 0.05  $\mu$ g/ml 以下~0.2  $\mu$ g/ml に分布し、そのピークは 0.05  $\mu$ g/ml 以下にあった。CPFAX は全株 0.05  $\mu$ g/ml 以下に分布した。T-3262 は CPFAX と同等の抗菌力であり、OFLX, ENX に比して優れた成績であった。

#### 3) *K. pneumoniae*

Fig. 4 に示すように T-3262 の MIC は全株 0.05  $\mu$ g/ml

8) *P. aeruginosa*

Fig. 9 に示すように T-3262 の MIC は 0.05  $\mu\text{g/ml}$   $\sim$  0.39  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.2  $\mu\text{g/ml}$  にあった。CPFX は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  0.1  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下にあった。T-3262 は CPFX と同等の抗菌力であり、OFLX, ENX に比して優れた成績であった。

4) *P. mirabilis*

Fig. 5 に示すように T-3262 の MIC は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  1.56  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.1  $\mu\text{g/ml}$  にあった。OFLX は 0.1  $\sim$  3.13  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.2  $\mu\text{g/ml}$  にあった。ENX は 0.2  $\sim$  1.56  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.2  $\mu\text{g/ml}$  にあった。CPFX は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  0.39  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下にあった。T-3262 は CPFX より 1 段階程度劣るが、OFLX より 1 段階、ENX より 2 段階程度優れた成績であった。

5) *P. vulgaris*

Fig. 6 に示すように T-3262 の MIC は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  1.56  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下にあった。OFLX は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  3.13  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.1  $\mu\text{g/ml}$  にあった。

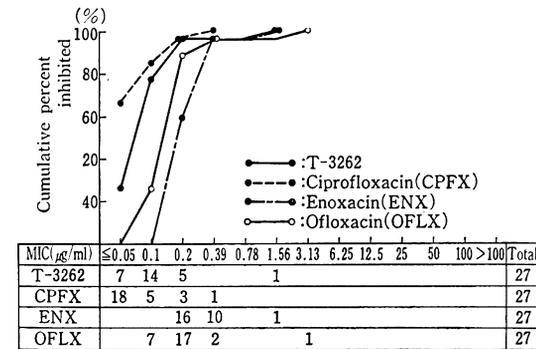


Fig. 5. Sensitivity distribution of clinical isolates of *Proteus mirabilis* (27 strains). ( $10^6$  cfu/ml)

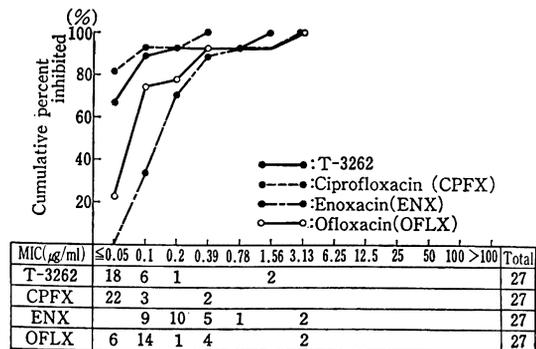


Fig. 6. Sensitivity distribution of clinical isolates of *Proteus vulgaris* (27 strains). ( $10^6$  cfu/ml)

ENX は 0.1  $\sim$  3.13  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.2  $\mu\text{g/ml}$  にあった。CPFX は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  0.39  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下にあった。T-3262 は CPFX と同等で、OFLX より 1 段階、ENX より 2 段階程度優れた成績であった。

6) *M. morgani*

Fig. 7 に示すように T-3262 の MIC は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  0.2  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.1  $\mu\text{g/ml}$  にあった。OFLX は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  0.39  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.1  $\mu\text{g/ml}$  にあった。ENX は 0.1  $\sim$  0.39  $\mu\text{g/ml}$  に分布し、そのピークは 0.2  $\mu\text{g/ml}$  にあった。CPFX は全株 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下に分布した。T-3262 は CPFX より劣るが、OFLX, ENX より 1 段階程度優れた成績であった。

7) *S. marcescens*

Fig. 8 に示すように T-3262 の MIC は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  6.25  $\mu\text{g/ml}$  に幅広く分布した。OFLX は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  12.5  $\mu\text{g/ml}$  に幅広く分布した。ENX は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  25  $\mu\text{g/ml}$  に幅広く分布した。CPFX は 0.05  $\mu\text{g/ml}$  以下  $\sim$  6.25  $\mu\text{g/ml}$  に幅広く分布した。T-3262 は CPFX, OFLX より 1  $\sim$  2 段階程度優れ、ENX より 3 段階程度優れた成績であった。

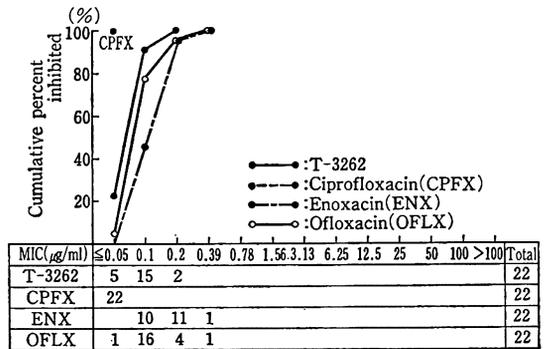


Fig. 7. Sensitivity distribution of clinical isolates of *Morganella morgani* (27 strains). ( $10^6$  cfu/ml)

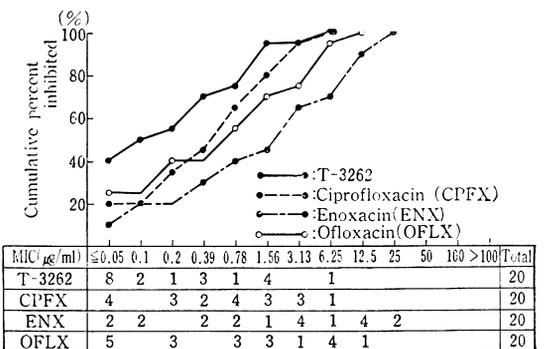


Fig. 8. Sensitivity distribution of clinical isolates of *Serratia marcescens* (20 strains). ( $10^6$  cfu/ml)

Table 1-1. Results of clinical trials with T-3262

Case no. Name	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease Complication	Daily dose (mg × times)	Duration (days)	Total dose (g)	Isolated organism	Clinical effect	side effects
1 M.M.	41 M	Acute tonsillitis	(-)	150 × 3	7	3.15	Normal flora	Excellent	(-)
2 O. Y.	70 M	Acute bronchitis	Bronchial asthma	150 × 3	7	3.15	Normal flora	Good	(-)
3 T. T.	73 M	Acute bronchitis	Bronchial asthma	150 × 3	7	3.15	Not done	Good	(-)
4 A. F.	52 F	Acute bronchitis	Bronchial asthma	150 × 3	7	3.15	Not done	Good	(-)
5 N. E.	37 F	Pneumonia	(-)	150 × 3	14	6.15	Not done	Good	(-)
6 Y. T.	54 M	Pneumonia	Liver disfunction	150 × 3	12	5.25	Normal flora ↓ <i>S. pyogenes</i> ↓ Normal flora	Fair	(-)
7 E. K.	37 F	Pneumonia	Diabetes mellitus	150 × 3	14	6.15	Not done	Good	Itching
8 H.M.	88 M	Pneumonia	Hypertension	300 × 2	10	5.7	Normal flora	Good	(-)
9 I. K.	75 M	Acute exacerbation	Chronic bronchitis Hypertension	150 × 3	14	6.15	Normal flora	Good	(-)
10 T. S.	54 F	Acute exacerbation	Diffuse panbronchiolitis	150 × 3	7	3.15	<i>P. aeruginosa</i> ↓ <i>P. aeruginosa</i>	Fair	Anorexia

Table 1-2. Results of clinical trials with T-3262

Case no. Name	Age Sex	Diagnosis	Underlying disease Complication	Daily dose (mg × times)	Duration (days)	Total dose (g)	Isolated organism	Clinical effect	side effects
11 K. T.	72 M	Acute exacerbation	Diffuse panbronchiolitis	150 × 3	21	9.45	Normal flora	Good	(-)
12 N. M.	46 M	Acute exacerbation	Diffuse panbronchiolitis	150 × 3	14	6.3	Normal flora	Poor	(-)
13 T. T.	23 M	Acute exacerbation	Middle lobe syndrome Chronic sinusitis	150 × 3	7	3.15	Normal flora	Good	(-)
14 I. K.	77 M	Pulmonary tuberculosis	Coronary insufficiency	150 × 3	4	1.5	Normal flora ↓ <i>M. tuberculosis</i>	Unknown	(-)

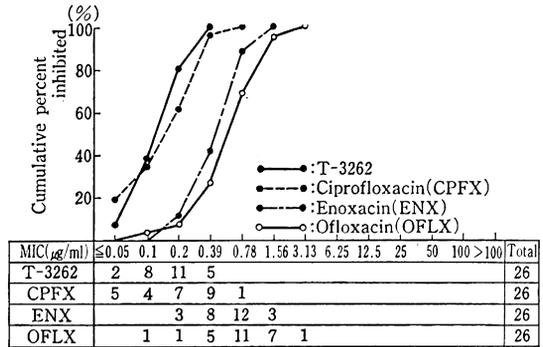


Fig. 9. Sensitivity distribution of clinical isolates *Pseudomonas aeruginosa* (26 strains) ( $10^8$  cfu/ml)

ml 以下に分布した。OFLX は 0.1~0.2 μg/ml に分布し、そのピークは 0.1 μg/ml にあった。ENX は 0.1 以下~0.39 μg/ml に分布し、そのピークは 0.2 μg/ml にあった。OFLX は 0.1~3.13 μg/ml に分布し、そのピークは 0.78 μg/ml にあった。ENX は 0.2~1.56 μg/ml に分布し、そのピークは 0.78 μg/ml にあった。CPFX は 0.05 μg/ml 以下~0.78 μg/ml に分布し、そのピークは 0.39 μg/ml にあった。T-3262 は CPFX と同等で、OFLX、ENX より 2 段階程度優れた成績であった。

2. 臨床的検討 (Table 1)

1) 臨床効果

急性扁桃炎の 1 例は著効、急性気管支炎の 3 例は全例有効、肺炎 4 例は有効 3 例、やや有効 1 例であり急性の呼吸器感染症の有効率は 87.5% であった。

慢性気管支炎、びまん性汎細気管支炎、中葉症候群などに伴う慢性気道感染症急性増悪 5 例では有効 3 例、やや有効 1 例、無効 1 例であり有効率は 60% であった。肺結核の 1 例は判定不能とした。全体では効果判定対象 13 例中著効 1 例、有効 9 例、やや有効 2 例、無効 1 例であり、有効率は 76.9% であった。

2) 細菌学的効果

本剤投与前に有意菌が検出されたのは Case 10 のびまん性汎細気管支炎の 1 例のみであった。*P. aeruginosa* が分離されたが本剤投与により除菌されなかった。臨床的にはやや有効であった。

3) 副作用

T-3262 が原因と考えられる自覚的な副作用として掻痒感が 1 例、食欲不振が 1 例みられたがいずれも継続投与可能であった。掻痒感に対しては抗ヒスタミン剤の投与により本剤投与終了 4 日後には改善し、また食欲不振に対しては特に処置することなく本剤投与終了 2 日後には改善した。

Table 2. Laboratory findings before and after administration of T-3262

No.		ESR (1 h)	CRP	RBC ( $\times 10^4$ )	WBC	Platelet ( $\times 10^4$ )	Fosino. (%)	GOT (KU)	GPT (KU)	ALP (IU)	BUN (mg/dl)	Creatinine (mg/dl)
1	Before	42	6 +	468	9,400	14.1	0	102	305	241	17	1.2
	After	8	+	446	7,500	28.9	0	14	76	183	11	0.8
2	Before	19	$\pm$	528	6,600	31.4	2	16	23	127	14	1.0
	After	6	$\pm$	514	5,800	25.8	3	29	40	117	15	1.2
3	Before	10	$\pm$	463	7,900	17.5	0	14	13	64	15	1.1
	After	17	-	484	8,100	19.6	0	14	16	66	15	1.2
4	Before	26	+	460	5,300	25.5	8	24	16	86	11	1.2
	After	28	-	463	5,100	25.8	9	24	12	76	20	1.0
5	Before	37	4 +	412	6,900	18.2	3	17	12	143	8	0.9
	After	2.5	-	397	4,400	20.1	1	17	12	123	7	0.9
6	Before	63	6 +	437	12,800	50.8	1	72	67	899	12	0.9
	After	52	4 +	461	12,800	49.0	1	62	92	1,143	13	1.0
7	Before	36	3 +	386	8,000	21.7	1	15	7	80	9	0.9
	After	11	-	393	3,900	19.9	6	16	6	75	11	1.1
8	Before	143	5 +	303	8,200	30.5	0	14	10	225	19	1.6
	After	80	+	310	5,200		10	19	7	240	21	1.6
9	Before	10	4 +	403	5,400		1	41	21	104	17	1.1
	After	16	$\pm$	411	4,000	28.5	10	41	28	105	17	1.1
10	Before	20	+	471	12,300	26.4	4	21	22	82	18	0.9
	After	22	+	489	6,300	26.5	2	19	23	78	12	0.8
11	Before	78	6 +	453	20,500	27.0	0	81	62	235	19	1.5
	After	17		485	8,500	18.8	4	25	14	91	13	1.0
12	Before	2	5 +	513	19,100	27.1	0	21	23	102	17	1.1
	After	14	+	531	21,100	23.4	1	18	11	80	13	1.1
13	Before	7	2 +	572	6,500	15.9	1	22	21	97	15	1.2
	After	7	-	528	5,700	25.2	0	27	45	86	13	0.9
14	Before	85	6 +	398	7,000		0	21	9	56	17	1.0
	After	81	6 +	370	4,900	24.3	7	31	11	42	17	1.0

臨床検査値異常として末梢血好酸球増加が1例 (Case 8: 0→10%), GPT 上昇が2例 (Case 2: 23→40, Case 13: 21→45) みられたがいずれも軽度であった (Table 2)。

#### 代表例の紹介

##### Case 1 41 歳, 男性, 急性扁桃炎

2～3日前から 39°C 台の発熱および咽頭痛が持続し来院。本剤1回 150 mg, 1日3回投与により3日後には解熱し, 咽頭痛も改善した。7日間投与により白血球数は 9,400→7,500, CRP は 6+→+ となり著効と判定した。

##### Case 4 52 歳, 女性, 急性気管支炎

気管支喘息にて外来治療中 38°C の発熱とともに咳嗽, 喀痰がみられ本剤を投与した。本剤1回 150 mg, 1日3回, 7日間投与により自覚症状改善し, CRP が +→- となり有効と判定した。

##### Case 8 88 歳, 男性, 肺炎

高血圧症にて外来治療中発熱, 咳嗽, 喀痰をきたし胸部 X-P にて右下肺野に浸潤影を認め本剤を投与した。本剤1回 300 mg, 1日2回, 10日間投与により自覚症状, 聴診所見, 胸部 X-P 所見改善し, CRP は 5+→+ となり有効と判定した。

##### Case 11 72 歳, 男性, 慢性気道感染症急性増悪

びまん性汎細気管支炎にて治療中3日前より発熱に伴い喀痰の膿性化をきたし呼吸困難増強した。本剤1回 150 mg, 1日3回, 21日間投与により解熱, 呼吸困難軽減し, 喀痰の性状の改善もみられ, 白血球数は 20,500→8,500, CRP は 6+→2+ となり有効と判定した。

### III. 考 案

T-3262 は 1,8-ナフチリジン環の 1,7 位にそれぞれ新しい 2,4-ジフルオロフェニル基および 3-アミノピロリジニル基を有する, 新しいピリドンカルボン酸系抗菌剤である。私どもは臨床分離の各種菌株について本剤の抗菌力を測定し同系の抗菌剤である ofloxacin (OFLX), enoxacin (ENX), ciprofloxacin (CPFX) のそれと比較検討した。本剤は *S. aureus*, *S. marcescens* に対して OFLX, ENX や CPFX より優れた抗菌力を示した。*E. coli*, *K. pneumoniae*, *P. vulgaris*, *P. aeruginosa* に対しては OFLX, ENX より優れ, CPFX と同等の抗菌力であった。*P. mirabilis*, *M. morgani* に対しては

OFLX, ENX より優れるが, CPFX より劣る抗菌力であった。また私たちは検討していないが本剤はメチリン耐性の *S. aureus*, *Streptococcus pneumoniae*, *Haemophilus influenzae*, *Branhamella catarrhalis*, 嫌気性菌に対しても強い抗菌力を有していると報告されている<sup>8)</sup>。すなわち本剤は呼吸器感染症の起炎菌の大部分をカバーする広範囲な抗菌スペクトラムを有していると言える。

このような優れた抗菌力をもつ本剤の臨床面での有用性を検討するため急性扁桃炎1例, 急性気管支炎3例, 肺炎4例, 慢性気管支炎, びまん性汎細気管支炎, 中葉症候群などに伴う慢性気道感染症急性増悪5例, 肺結核1例の計14例の各種呼吸器感染症に使用した。そして肺結核を除く13例を効果判定対象とし, 副作用の判定は全例を対象とした。その結果, 急性扁桃炎, 急性気管支炎, 肺炎などの急性の呼吸器感染症での有効率は 87.5% と高く本剤の優れた抗菌力が反映されたと考えられた。慢性気道感染症急性増悪では有効率は 60% であったが基礎疾患を考慮すれば比較的高い有効率といえる。

細菌学的には, *P. aeruginosa* が除菌されなかったが, 本例はびまん性汎細気管支炎例であり長期に *P. aeruginosa* を排菌している患者のため抗生剤療法の限界と考えた。

本剤が原因と考えられる自覚的な副作用として搔痒感, 食欲不振が各1例みられたがいずれも継続投与可能であり本剤投与終了後改善した。臨床検査値異常として末梢血好酸球増加が1例, GPT 上昇が2例みられたがいずれも軽度であった。

以上, 本剤は各種呼吸器感染症治療に有用かつ安全性の高いものと考えられる。

#### 文 献

- 1) 第34回日本化学療法学会東日本支部総会, 新薬シンポジウム, T-3262, 東京, 1987
- 2) 日本化学療法学会: 最小発育阻止濃度 (MIC) 測定法再改訂について。Chemotherapy 29: 76~79, 1981
- 3) 五島瑛智子, 武藤弓子, 小川正俊, 金子康子, 桑原章吾: 新ピリドンカルボン酸系抗菌剤 T-3262 の *in vitro*, *in vivo* 抗菌作用。Chemotherapy 36 (S-9): 36~58, 1988

## LABORATORY AND CLINICAL STUDIES ON T-3262

MASAHITO KATO, YOSHIMITSU HAYASHI, TORU MATSUURA  
and TOSHIHIKO TAKEUCHI

First Department of Internal Medicine, School of Medicine,  
Nagoya City University  
1 Kawazumi, Mizuho-machi, Mizuho-ku, Nagoya-shi 467, Japan

KUNIO NANJO

Department of Internal Medicine, Nagoya City Josai Hospital

The antibacterial activity and clinical effect of T-3262, a new pyridone-carboxylic acid derivative, were investigated and the following results obtained :

1) Antibacterial activity : Antibacterial activity of T-3262 was investigated against 203 clinical isolates, including *Staphylococcus aureus*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Morganella morganii*, *Serratia marcescens*, and *Pseudomonas aeruginosa*, and compared with that of ofloxacin (OFLX), enoxacin (ENX) and ciprofloxacin (CPFX). T-3262 was superior to OFLX, ENX and CPFX against *S. aureus* and *S. marcescens*. Against *E. coli*, *K. pneumoniae*, *P. vulgaris* and *P. aeruginosa*, T-3262 was superior to OFLX and ENX and was equal to CPFX. T-3262 was superior to OFLX and ENX against *P. mirabilis* and *M. morganii*, but was inferior to CPFX.

2) Clinical evaluation : T-3262 was administered to a total of 14 patients : 1 case of acute tonsillitis, 3 of acute bronchitis, 4 of pneumonia, 5 of acute exacerbation of chronic respiratory infection and 1 of pulmonary tuberculosis. Clinical response was excellent in 1 case, good in 9 cases, fair in 2 and poor in 1 ; the efficacy rate being 76.9%. The case of pulmonary tuberculosis was not evaluable. The efficacy rate, including fair, was 92.3%. Bacteriologically, *P. aeruginosa*, isolated from the patient with acute exacerbation of diffuse panbronchiolitis, persisted. As side effects, itching and anorexia were observed in 1 patient each, and as abnormal laboratory findings, eosinophilia was noted in 1 and elevation of GPT in 2 cases. All were however, mild.