

Cefetamet pivoxil に関する基礎的・臨床的検討

松本 文夫・桜井 磐・今井 健郎・北條 敏夫

神奈川県衛生看護専門学校附属病院内科*

高橋 孝行・国分 勝弥・田浦 勇二

同 検査科

森 田 雅 之

同 薬剤科

新経口セフェム系抗生剤である cefetamet pivoxil (CEMT-PI) について、抗菌力、吸収・排泄、臨床効果を検討したところ、以下のごとき成績を得た。

1) 抗菌力：臨床分離 *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus pyogenes*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Proteus mirabilis* に対する cefetamet (CEMT) の抗菌力を測定したところ、*S. aureus* は $>100 \mu\text{g/ml}$, *S. pyogenes* は $\leq 0.1 \mu\text{g/ml}$, *E. coli* は $0.78 \mu\text{g/ml}$, *K. pneumoniae* は $0.2 \mu\text{g/ml}$, *P. mirabilis* は $0.2 \mu\text{g/ml}$ が MIC_{80-90} 値であった。

2) 吸収・排泄：高齢者の腎機能障害 2 例に CEMT-PI 500 mg を空腹時 1 回経口使用したときの血漿中濃度、尿中濃度を測定した。最高血漿中濃度 (C_{max}) は平均 $5.41 \mu\text{g/ml}$ で、平均血漿中半減期 ($T_{1/2}$) は 3.90 時間であった。本剤使用 10 時間までの尿中回収率は 16.4~29.7% であった。

3) 臨床成績：CEMT-PI を急性扁桃炎 1 例、急性咽頭炎 4 例、急性気管支炎 6 例、慢性気管支炎 3 例、急性腎盂腎炎 1 例、急性膀胱炎 4 例の計 19 例に 1 回 250 mg ないし 500 mg 1 日 2 回食後に使用した。臨床効果は、めまいまたは発疹のため使用中止した 2 例を除く 17 例では、急性扁桃炎、急性咽頭炎、急性気管支炎、慢性気管支炎、急性腎盂腎炎の全例および急性膀胱炎では 4 例中 3 例の計 16 例に有効の結果を得た。副作用は 2 例にめまいまたは発疹が認められたが、使用中止によりいずれも消失した。本剤による臨床検査値の異常は認められなかった。

Key words : Cefetamet pivoxil, Cefetamet, 抗菌力, 体内動態, 臨床効果

新経口セフェム系抗生剤である cefetamet pivoxil (CEMT-PI) はグラム陽性菌およびグラム陰性菌に対して幅広い抗菌力を有し、特にグラム陰性菌に優れた抗菌力を示す。また各種 β -lactamase に対してきわめて安定なため、 β -lactamase 産生株に対しても抗菌力を有する¹⁾。今回われわれは本剤の抗菌力、吸収・排泄および臨床効果について検討した。

I. 材料ならびに研究方法

1. 抗菌力

当院において 1988 年 3 月から 1989 年 2 月までの 1 年間に臨床材料から分離した *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus pyogenes*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae* および *Proteus mirabilis* 各 25 株に対する cefetamet (CEMT) の最小発育阻止濃度 (MIC) を日本化学療法学会標準法²⁾ に準じて測定した。培地

には pH 7.2 Sensitivity test agar[®] (栄研化学) を使用し、 $100 \mu\text{g/ml}$ から $0.1 \mu\text{g/ml}$ までの 2 倍希釈系列で薬剤を含む感受性測定用平板培地を作成し、一夜培養菌液の 100 倍希釈液の一白金耳 (内径 1 mm) を接種した。37°C 24 時間培養後完全に発育を阻止された最低濃度をもって MIC とした。本剤の他に cefixime (CFIX), ceftoram (CFTM), cefaclor (CCL), cephalixin (CEX), ampicillin (ABPC) についても同時に MIC を測定し、本剤のそれと比較した。

2. 血漿中および尿中濃度

CEMT-PI を高齢者の腎機能障害例に早朝空腹時 500 mg 1 回経口使用した時の血漿中濃度を測定した。使用後 0.5, 1, 2, 4, 6, 8 および 10 時間に採血して試料とした。また、尿中濃度測定は本剤使用後 2 時間毎に全尿採取し、それぞれの濃度を測定した。

*〒 235 横浜市磯子区汐見台 1-6-5

血漿中および尿中濃度の測定は *E. coli* ATCC 39188 を検定菌とする disc 法により行った。標準液は血漿中濃度測定では CEMT をモニター I に溶解し、さらに 0.067 M リン酸緩衝液 (pH 7.0) に希釈調整した。また、尿中濃度測定では 0.067 M リン酸緩衝液 (pH 7.0) で希釈調整して作製した。

各薬動力学パラメータの算出にあたっては、吸収の lag-time を含む one compartment open model にデータをあてはめた。実際の計算は非線形最小二乗法により、SAS の NLIN プロシジャ中の Marquardt 法を使用した。

3. 臨床的検討

1) 対象

対象は急性扁桃炎 1 例、急性咽頭炎 4 例、急性気管支炎 6 例、慢性気管支炎 3 例、急性腎盂腎炎 1 例、急性膀胱炎 4 例の計 19 例の呼吸器感染症および尿路感染症であり、性別は男性 4 例、女性 15 例で、年齢は 20 ~ 88 歳に分布し、平均年齢は 46.5 歳であった。なお、

臨床的に検討した 19 例中 2 例は、めまいまたは発疹を生じて使用中止したため、臨床効果判定から除外した。

2) 使用方法

CEMT-PI 250mg 錠を用い、使用量は原則として 1 回 250 mg ないし 500 mg とし、1 日 2 回使用した。使用期間は 1~13 日で平均 5.7 日であった。なお、効果判定に影響をおよぼす他の抗菌薬の併用は一切行わなかった。

3) 効果判定基準

臨床効果は本剤使用 3 日以内に自、他覚症状の改善が認められたものを著効、4~7 日で改善あるいは正常化したものを有効、7 日以後で改善、正常化がみられたものはやや有効、7 日以後もなお改善、正常化がみられなかったか、あるいは悪化したものを無効とした。細菌学的効果は本剤使用前後の原因菌の消長から、消失、菌交代、減少、不変の 4 段階で判定した。

4) 安全性

Table 1. *In vitro* activity of cefetamet and other drugs

($\mu\text{g/ml}$)

Organism (No. of strains)	Compound	Range of MICs		MIC ₅₀	MIC ₉₀
<i>Staphylococcus aureus</i> (25)	cefetamet	3.13 - >100		50	>100
	cefixime	3.13 - >100		25	100
	cefteram	0.78 - >100		6.25	100
	cefaclor	0.39 - >100		6.25	100
	cephalexin	0.78 - >100		6.25	100
	ampicillin	0.2 - >100		6.25	100
<i>Streptococcus pyogenes</i> (25)	cefetamet	≤ 0.1	0.2	≤ 0.1	≤ 0.1
	cefixime	≤ 0.1	0.2	≤ 0.1	≤ 0.1
	cefteram	≤ 0.1		≤ 0.1	≤ 0.1
	cefaclor	≤ 0.1	0.39	0.2	0.2
	cephalexin	≤ 0.1	0.78	0.78	0.78
	ampicillin	≤ 0.1		≤ 0.1	≤ 0.1
<i>Escherichia coli</i> (25)	cefetamet	≤ 0.1	3.13	0.39	1.56
	cefixime	≤ 0.1	6.25	0.2	1.56
	cefteram	≤ 0.1	3.13	0.2	0.78
	cefaclor	0.39 -	100	3.13	12.5
	cephalexin	3.13 -	25	6.25	12.5
	ampicillin	0.78 -	100	3.13	100
<i>Klebsiella pneumoniae</i> (25)	cefetamet	≤ 0.1	1.56	0.2	0.39
	cefixime	≤ 0.1	0.78	≤ 0.1	0.39
	cefteram	≤ 0.1	3.13	0.2	0.78
	cefaclor	0.39 -	6.25	0.78	3.13
	cephalexin	3.13 -	25	6.25	12.5
	ampicillin	6.25 -	>100	100	100
<i>Proteus mirabilis</i> (25)	cefetamet	≤ 0.1	0.39	≤ 0.1	0.2
	cefixime	≤ 0.1	0.39	≤ 0.1	0.2
	cefteram	≤ 0.1	0.39	≤ 0.1	0.2
	cefaclor	0.39 -	6.25	1.56	3.13
	cephalexin	6.25 -	25	12.5	25
	ampicillin	0.39 -	6.25	0.78	3.13

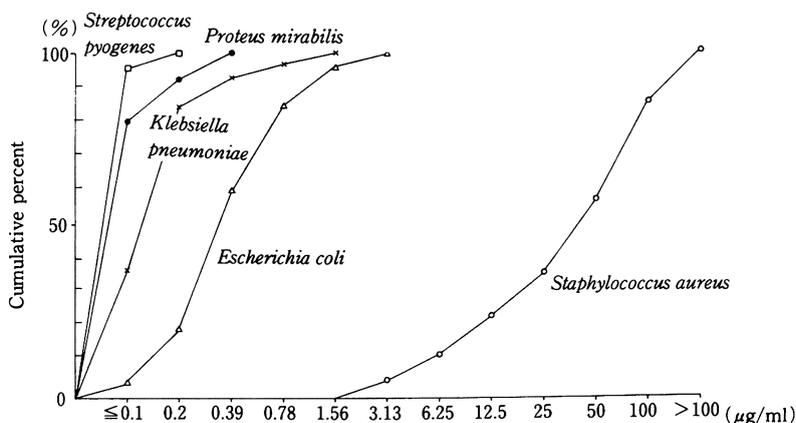


Fig. 1 Susceptibility distribution of clinical isolates (25 strains each) of 5 organisms to cefetamet

本剤の使用に際し、自覚症状による副作用を検討するとともに使用前後に可能な限り血液一般検査（赤血球、ヘモグロビン、ヘマトクリット、白血球、血小板）と生化学検査（S-GOT、S-GPT、AI-P、BUN、S-Creatinine）を実施し、異常値発現の有無を検討した。

なお、以上の臨床的検討は1987年9月より1988年4月の間に行われた。

II. 成績

1. 抗菌力 (Table 1, Fig.1)

S. aureus 25株に対する本剤のMICは3.13~>100 µg/mlに分布し、MIC₅₀、MIC₉₀値はそれぞれ50、>100 µg/mlであり、CFIXとほぼ同等であった。

S. pyogenes 25株に対する本剤のMIC分布は≤0.1~0.2 µg/mlにあり、25株中24株(96%)は≤0.1 µg/mlで発育を阻止され、MIC₉₀値は≤0.1 µg/mlであ

り、CFIXとほぼ同等、CCL、CEXより優れていた。

E. coli 25株に対する本剤のMIC分布は≤0.1~3.13 µg/mlにあり、MIC₅₀、MIC₉₀値はそれぞれ0.39、1.56 µg/mlであり、CFTM、CFIXとほぼ同等、CCL、ABPC、CEXより優れていた。

K. pneumoniae 25株に対する本剤のMIC分布は≤0.1~1.56 µg/mlにあり、25株中21株(84%)が0.2 µg/ml以下で発育を阻止され、CFIXとほぼ同等、CFTM、CCL、CEX、ABPCより優れた成績であった。

P. mirabilis は本剤0.39 µg/ml以下で全株が発育を阻止され、25株中23株(92%)が0.2 µg/ml以下で発育を阻止された。CFIX、CFTMと比較するとほぼ同等であった。

S. aureus、*S. pyogenes*、*E. coli*、*K. pneumoniae* および *P. mirabilis* 5菌種に対する本剤のMIC分布を

Table 2. Plasma levels of cefetamet in adult subjects

(500 mg p.o., fasting)

Case No.	Age	Body weight (kg)	Plasma level (µg/ml)							Half life (h)
			0.5	1	2	4	6	8	10 (h)	
1	76	57	0.60	2.60	4.09	3.93	3.30	2.42	1.93	3.44
2	66	51	5.11	5.68	6.08	5.55	3.68	2.57	1.38	4.36
Mean	71	54	2.86	4.14	5.09	4.74	3.49	2.50	1.66	3.90

Table 3. Pharmacokinetic parameters of cefetamet pivoxil

Subjects	Dose	Case No.	C _{max} (µg/ml)	T _{max} (h)	T _{1/2} (h)	AUC (µg·h/ml)
Elderly	500 mg	1	4.273	3.100	3.436	37.521
		2	6.542	1.500	4.361	52.619
		Mean ±SD	5.408 ±1.604	2.300 ±1.131	3.899 ±0.564	45.070 ±10.675

Fig.1 に示した。

2. 血漿中および尿中濃度

高齢者の腎機能障害 2 例に CEMT-PI 500mg を 1

回空腹時使用した時の血漿中濃度を Table 2 に示した。血漿中濃度のピーク値は使用後 2 時間にあつて、その平均値は 5.09 $\mu\text{g/ml}$ であり、10 時間後において

Table 4. Urinary excretion of cefetamet in adult subjects

(500 mg p.o., fasting)

Case No.	Time	Urinary excretion											
		0~2 h		2~4 h (0~4 h)		4~6 h		6~8 h		8~10 h		0~10 h	
		L ($\mu\text{g/ml}$)	R (mg)	R (mg)	Rate (%)								
1		30.9	9.9	171.0	13.7	137.0	20.6	139.0	11.4	92.6	7.9	63.5	16.4
2				(98.4	14.3)	399.0	60.8	298.0	21.6	163.0	18.7	115.4	29.7

L: level, R: recovery

Table 5. Therapeutic results with cefetamet pivoxil

Case No.	Age Sex	Clinical diagnosis	Causative organism (MIC)	Daily dose (mg \times times)	Response		Side effects
				Duration	clinical	bacteriological	
1	56 F	Acute bronchitis	<i>Staphylococcus aureus</i> (6.25)	250 \times 2	good	eradicated	—
	4						
2	48 M	Acute bronchitis	normal flora	250 \times 2	good	unknown	—
	7						
3	81 M	Acute bronchitis	—	250 \times 2	good	unknown	—
	8						
4	29 M	Acute bronchitis	normal flora	250 \times 2	good	unknown	—
	4						
5	36 F	Acute bronchitis	normal flora	250 \times 2	good	unknown	—
	8						
6	59 F	Acute bronchitis	normal flora	500 \times 2	good	unknown	—
	4						
7	65 F	Chronic bronchitis	—	250 \times 2	good	unknown	—
	4						
8	72 F	Chronic bronchitis	—	250 \times 2	good	unknown	—
	5						
9	88 F	Chronic bronchitis	—	250 \times 2	—	unknown	Dizziness
	1						
10	44 M	Acute tonsillitis	—	250 \times 2	good	unknown	—
	4						
11	35 F	Acute pharyngitis	<i>Staphylococcus aureus</i> (6.25)	250 \times 2	good	eradicated	—
	6						
12	32 F	Acute pharyngitis	<i>Staphylococcus aureus</i> (6.25)	250 \times 2	good	eradicated	—
	6						
13	33 F	Acute pharyngitis	<i>Staphylococcus aureus</i> (0.39)	250 \times 2	—	unknown	Eruption
	1						
14	26 F	Acute pharyngitis	—	250 \times 2	good	unknown	—
	6						
15	57 F	Acute cystitis	<i>Staphylococcus aureus</i> (3.13)	250 \times 2	good	eradicated	—
	7						
16	20 F	Acute cystitis	<i>Escherichia coli</i> (0.39)	250 \times 2	good	eradicated	—
	7						
17	20 F	Acute cystitis	<i>Enterococcus faecalis</i> α -haemolytic streptococcus	500 \times 2	poor	replaced	—
	7						
18	49 F	Acute cystitis	<i>Klebsiella pneumoniae</i> (0.2)	500 \times 2	good	eradicated	—
	7						
19	33 F	Acute pyelonephritis	<i>Escherichia coli</i> (0.39)	500 \times 2	good	eradicated	—
	13						

も平均 1.66 $\mu\text{g/ml}$ の値を維持していた。また各症例の薬動学的パラメーターを Table 3 に示した。平均 $T_{1/2}$ は 3.90 時間、平均 AUC は 45.07 $\mu\text{g}\cdot\text{h/ml}$ であった。

本剤使用 10 時間後まで測定した尿中回収率は Table 4 に示すように 16.4~29.7% であった。

3. 臨床成績

CEMT-PI の臨床症例を Table 5 に示した。Table 5 の No.9, 13 の 2 例は、使用開始直後、めまいまたは発疹の副作用が認められたので臨床効果判定例より除外した。本剤の使用量は Table 5 のごとく急性気管支炎、急性腎盂腎炎各 1 例、急性膀胱炎 2 例では 1 回 500

Table 6. Laboratory findings before and after administration of cefetamet pivoxil

Case No.		RBC ($10^4/\text{mm}^3$)	Hb (g/dl)	Ht (%)	WBC ($/\text{mm}^3$)	Platelet ($10^4/\text{mm}^3$)	GOT (IU)	GPT (IU)	Al-P (KA)	BUN (mg/dl)	S-Creatinine (mg/dl)
1	Before	452	13.7	42.4	8,400	26.5	18	14	5.4	18.1	0.86
	After	461	13.8	43.4	7,100	24.9	14	11	5.4	17.4	0.84
2	Before	497	15.3	47.6	7,600	20.4	16	15	4.8	17.4	1.04
	After	491	14.8	46.4	6,900	22.6	18	14	5.1	16.4	1.01
3	Before	414	13.4	40.4	8,900	24.6	21	14	3.4	16.4	1.24
	After	424	13.5	41.2	7,100	26.6	18	14	3.9	15.8	1.12
4	Before	498	14.6	46.4	6,300	29.5	34	34	7.5	16.6	0.94
	After	501	14.9	46.7	6,100	31.6	36	30	7.4	16.2	0.93
5	Before	449	12.9	41.5	16,000	25.6	11	7	5.2	15.3	0.96
	After	446	12.7	41.0	6,400	28.4	11	8	5.1	16.1	0.89
6	Before	462	13.7	42.2	10,000	21.0	19	16	7.1	18.6	1.21
	After	462	13.6	43.4	7,100	24.6	18	14	6.9	17.4	1.19
7	Before	430	13.1	39.9	9,800	14.4	17	8	6.0	9.6	0.66
	After	424	12.9	38.4	7,000	16.0	16	9	5.8	9.8	0.62
8	Before	458	13.8	42.5	6,100	21.1	41	42	7.9	11.4	1.02
	After	456	13.6	42.2	7,500	24.3	44	45	8.0	11.8	1.09
9	Before	348	11.4	34.8	6,500	28.7	19	9	6.2	12.5	1.27
	After	361	11.9	35.0	4,600	26.4	23	11	5.3	12.8	1.26
10	Before	516	15.3	48.8	6,800	22.5	78	105	7.0	13.2	1.05
	After	512	15.4	47.9	5,800	26.4	76	101	7.2	13.4	1.04
11	Before	469	12.5	39.7	5,600	21.2	30	30	4.2	11.3	0.86
	After	481	13.2	41.3	6,500	21.4	21	26	4.2	10.6	0.84
12	Before	459	13.4	41.7	6,600	26.4	14	9	3.1	17.9	0.96
	After	464	13.6	41.7	6,900	28.5	15	8	4.9	18.1	0.94
13	Before	388	11.7	35.8	11,500	26.8	20	10	3.4	13.5	—
	After	381	11.5	34.8	9,300	32.1	11	9	4.1	8.9	0.59
14	Before	455	12.6	39.9	6,400	34.3	16	11	5.6	10.6	0.96
	After	487	14.0	42.1	7,100	34.1	24	11	5.4	11.9	0.92
15	Before	384	11.9	36.1	8,500	22.6	22	14	5.5	18.6	1.00
	After	388	11.9	36.4	5,600	24.6	24	18	5.3	16.5	1.42
16	Before	460	13.7	41.8	5,500	25.2	21	10	6.1	9.7	0.69
	After	450	13.8	41.5	6,100	25.1	19	11	6.0	10.2	0.68
17	Before	431	13.5	40.8	6,000	18.1	16	38	3.1	12.0	0.91
	After	451	13.9	42.9	4,600	18.0	16	30	2.8	11.9	0.78
18	Before	442	12.9	39.8	6,100	27.1	10	23	6.8	26.6	0.63
	After	449	13.4	40.1	5,900	28.4	12	20	6.5	20.9	0.64
19	Before	423	12.5	38.8	10,800	37.3	11	7	5.4	16.4	0.64
	After	457	13.1	42.5	10,300	67.4	11	6	5.3	10.4	0.64

mg, 他は1回250 mgであった。評価可能であった呼吸器感染症12例の急性扁桃炎, 急性咽頭炎, 急性気管支炎, 慢性気管支炎では全例有効の結果が得られ, また尿路感染症5例では急性腎盂腎炎の1例と急性膀胱炎3例に有効の結果が得られた。

一方, 細菌学的効果は呼吸器感染症の急性咽頭炎2例および急性気管支炎1例で原因菌として検出し得た *S. aureus* 3株はすべてが除菌され, また尿路感染症の急性腎盂腎炎1例および急性膀胱炎3例で原因菌として検出し得た *S. aureus* 1株, *K. pneumoniae* 1株, *E. coli* 2株も除菌された。

自覚的副作用については, No.9, 13の2例にめまいまたは発疹が認められたが使用中によりいずれも消失した。その他本剤によると思われる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 (Table 6)。

III. 考 察

新経口セフェム系抗生剤 CEMT-PI は従来の経口セフェム剤に比し, 各種細菌の産生する β -lactamase に対して高い安定性を示すことはすでに報告されている¹⁾。われわれの検討では CEMT の抗菌力は, *S. aureus*, *S. pyogenes* については CFIX とほぼ同等であった。また *E. coli*, *K. pneumoniae*, *P. mirabilis* などグラム陰性桿菌の MIC₉₀ 値は 0.2~1.56 μ g/ml であり, 本剤の抗菌力はグラム陽性菌については CFIX とほぼ同等, グラム陰性桿菌については CFIX, CFTM と同等と判断された。

高齢者および腎機能障害時における CEMT の血漿中濃度は使用後約6~8時間でピークに達し, 長時間持続するとされているが³⁾, われわれが高齢者の腎機能障害例に500 mg 空腹時1回経口使用した時の検討では, C_{max} は平均5.41 μ g/ml, T_{max} は平均2.30時間, T_{1/2} は平均3.90時間, AUC は平均45.07 μ g/ml であった。これらを健康成人の T_{max} および T_{1/2}³⁾ と比べると明らかに延長傾向を示している。また, 本剤は経口使用後8~12時間尿でも有効濃度を推移し, 12時間までの尿中回収率は約50%前後であるが³⁾, われわれが検討した高齢者腎機能障害例の10時間までの尿中回収率は16.4~29.7%と健康成人のそれより低率であったことは, 高齢者における吸収性や腎からの排泄低下が関与していることが要因と解される。

本剤の臨床的検討は抗菌力と血漿中濃度推移および尿中濃度を考慮して, 1回量を250~500 mg と定め, 1日2回で検討した。呼吸器感染症の急性扁桃炎, 急性

咽頭炎, 急性気管支炎, 慢性気管支炎では, 1回250 mg 1日2回使用した11例および1回500 mg 1日2回使用した1例のすべてに有効の結果が得られ, 尿路感染症の急性膀胱炎および急性腎盂腎炎では, 1回250 mg 1日2回使用した2例と1回500 mg 1日2回使用した3例中2例に有効の結果が得られた。この良好な成績については本剤の優れた抗菌力と血漿中濃度および尿中濃度の持続性が要因と考えられるが, *S. aureus* に対して本剤の MIC は 3.13~>100 μ g/ml に分布し MIC₅₀₋₉₀ 値は 50~>100 μ g/ml であったにもかかわらず, *S. aureus* 分離呼吸器感染症例においても有効の成績が得られた。このことについては, MIC 値が 3.13~6.25 μ g/ml と低値であったことと, 症例が若年者および基礎疾患を有さないものが多かったことが要因と考えられる。また, 本剤使用例のほとんどは外来通院の軽症例であったことも高い有効率が得られた原因と思われる。今後さらに継続的に検討していく必要がある。安全性については自覚的な副作用として, めまいおよび発疹が2例認められたが, 使用中によりいずれも消失した。また, 使用前後の臨床検査値を検討し得た症例については本剤によると思われる検査値異常は認められなかった。

以上の成績から本剤は抗菌力の増強と血漿中濃度の持続を特徴とし, 軽症ないし中等症であれば1回250 mg 1日2回使用でもほぼ満足すべき成績が得られるものと解されるが, 临床上呼吸器感染症では原因菌として高頻度に分離される *S. pneumoniae*, *H. influenzae* などに対する本剤の抗菌力 (MIC₉₀ 値) がそれぞれ 0.39, 0.2 μ g/ml であること³⁾を考慮すると, 呼吸器感染症では1回250 mg 使用が妥当と考えられる。また, 尿路感染症においては1回250 mg ないし500 mg 使用が最適と量だと考えられる。

文 献

- 1) NEU H C, CHIN N, LABTHAVIKUL P: *In Vitro* Activity and β -Lactamase Stability of Two Oral Cephalosporins, Cefetrame (Ro19-5247) and Cefetamet (Ro15-8074). *Antimicrob Agents Chemother* 30(3): 423~428, 1986
- 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) 大石正夫, 小林宏行: 第36回日本化学療法学会東日本支部総会, 新薬シンポジウム. Ro15-8075 (cefetamet pivoxil), 新潟, 1989

BASIC AND CLINICAL STUDIES ON CEFETAMET PIVOXIL

FUMIO MATSUMOTO¹⁾, IWAO SAKURAI¹⁾, TAKEO IMAI¹⁾, TOSHIO HOJO¹⁾,
TAKAYUKI TAKAHASHI²⁾, KATSUYA KOKUBU²⁾, YUJI TAURA²⁾, MASAYUKI MORITA³⁾

¹⁾ Department of Internal Medicine, Kanagawa Prefectural School of Nursing and Hygiene Hospital,
1-6-5 Shiomidai, Isogo-ku, Yokohama-shi 235, Japan

²⁾ Central Laboratory, Kanagawa Prefectural School of Nursing and Hygiene Hospital

³⁾ Pharmacy, Kanagawa Prefectural School of Nursing and Hygiene Hospital

We studied the antibacterial activity, absorption, excretion and clinical efficacy of cefetamet pivoxil (CEMT-PI), a new oral cephalosporin, and obtained the following results.

1) Antibacterial activity: the antibacterial activity of cefetamet (CEMT) against 25 clinical isolates each of 5 organisms was investigated. CEMT had broad-spectrum activity against Gram-positive and -negative organisms, and the MIC_{80-90s} against *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus pyogenes*, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, and *Proteus mirabilis*, were > 100 , ≤ 0.1 , 0.78, 0.2 and 0.2 $\mu\text{g/ml}$, respectively.

2) Absorption and excretion: CEMT-PI was administered at 500mg to two elderly patients with apparent renal dysfunction. The peak plasma concentration was 5.41 $\mu\text{g/ml}$, the plasma half-life was 3.90h, and the 10-h urinary recovery rate was 16.4~29.7%.

3) Clinical evaluation: CEMT-PI was administered to 14 patients with respiratory tract infections and 5 with urinary tract infections in daily doses of 500 ~ 1000mg after meals in two divided doses. The clinical response was good in 16 cases, poor in 1 and unknown in 2 cases. As to side effects, dizziness and eruption developed in one patient each, but these subsided the day after withdrawal of CEMT-PI. No abnormal laboratory findings were noted in any of the cases.