

Fleroxacinの基礎的、臨床的検討

副島林造・沖本二郎・二木芳人
日野二郎・角 優・中川義久
川崎医科大学呼吸器内科*

ニューキノロン系の合成抗菌剤であるfleroxacinについて基礎的ならびに臨床的検討を行い、以下の成績を得た。

1) Fleroxacinのmethicillin-sensitive *Staphylococcus aureus* (MSSA), *Escherichia coli*, *Acinetobacter calcoaceticus*, *Serratia marcescens*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Morganella morganii* に対するMICは、若干tosufloxacin tosilate, ciprofloxacinに劣るものの、0.025~1.56 $\mu\text{g/ml}$ に分布し、ofloxacinとほぼ同等の抗菌力を示した。Methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* (MRSA), *Klebsiella* sp., *Enterobacter cloacae*, *Pseudomonas aeruginosa* に対しても、ほとんどの株が3.13 $\mu\text{g/ml}$ 以下のMICを示した。

2) 呼吸器感染症26例、尿路感染症1例の計27例に本剤1回100~200mg, 1日1~2回使用した結果、有効率は95.7%であった。副作用は4例にみられ、嘔気・嘔吐が2例に、腹部膨満感・不眠、腹部膨満感・嘔気が各1例にみられた。臨床検査値では1例にS-GPTの軽度上昇を認めた。

Key words : Fleroxacin, FLRX, 抗菌力, 呼吸器感染症

Fleroxacin (FLRX) は杏林製薬(株)中央研究所で開発されたニューキノロン系の合成抗菌剤で、キノロンカルボン酸を基本骨格として、1位にフルオロエチル基(C₂H₄F), 6位, 8位にフッ素原子を導入している。

本剤はグラム陽性菌及びグラム陰性菌に対し幅広い抗菌スペクトルを有しており¹⁾, かつ本剤を健康成人に経口投与した場合, 最高血中濃度は用量依存的に上昇し, 血中半減期が約10時間と既存の同系薬剤と比較して最も長く²⁾, またAUCも大きく良好なbioavailabilityが示唆されている。

今回私共は, このFLRXについて各種臨床分離株に対するMICを測定し, 併せて呼吸器感染症26例, 尿路感染症1例の計27例に本剤を使用して, その有効性ならびに安全性を検討したので報告する。

I. 研究方法

1) 抗菌力

使用菌株は教室保存の臨床分離株 *Escherichia coli*, *Klebsiella* sp., *Acinetobacter calcoaceticus*, *Pseudomonas aeruginosa* 各50株, methicillin-sensitive *Staphylococcus aureus* (MSSA) 34株, methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* (MRSA) 16株, *Enterobacter cloacae*, *Serratia marcescens*, *Proteus mirabilis* 各30株, *Proteus vulgaris* 20株, *Morganella morganii* 7株である。MICの測定は日本化学療法学会標準法に従い, 平板希釈法で行い, 接種菌量は10⁶ cells/mlとした。同時にtosufloxacin tosilate

(TFLX), ciprofloxacin (CPFX), ofloxacin (OFLX) のMICを測定し, 比較検討した。

2) 臨床的検討

対象は川崎医科大学呼吸器内科で本剤により治療を行った呼吸器感染症患者26例, 尿路感染症患者1例の計27例で, 男性15例, 女性12例, 年齢は17歳から71歳であった。

患者の内訳は急性気管支炎1例, 肺炎1例, 慢性気管支炎8例, 感染を伴う気管支拡張症7例, びまん性汎細気管支炎1例および下気道感染を伴った気管支喘息5例, 陈旧性肺結核2例, じん肺1例と急性膀胱炎1例である。

これらに対し, FLRXを1回100~200mg, 1日1~2回, 2~14日間投与し, 臨床的有用性を検討した。

臨床効果は喀痰性状, 咳嗽, 発熱などの臨床症状, 胸部X線所見, 白血球数, CRP値, 赤沈値の正常化ないし改善の程度ならびに喀痰中の起炎菌の消失の有無により, 著効(excellent), 有効(good), やや有効(fair)および無効(poor)の4段階に判定した³⁾。

さらに本剤投与中の自覚症状, 投与前後の臨床検査成績についても検討し, 安全性を評価した。

II. 成績

1) 抗菌力

各種臨床分離菌のMICのrangeおよびMIC₅₀, MIC₉₀をTable 1に示した。MSSA, *E. coli*, *A. calcoaceticus*, *S. marcescens*, *P. mirabilis*, *P. vulgaris*, *M. morganii* に対す

* 〒401-01 倉敷市松島577

Table 1. Susceptibility of clinical isolates to fleroxacin and related antibacterial agents

Organism	Drug	No. of strains tested	MIC ($\mu\text{g/ml}$)		
			range	MIC ₅₀	MIC ₉₀
MSSA	floxacin	34	0.18 - 0.78	0.39	0.39
	tosufloxacin tosilate		0.025 - 0.10	0.05	0.05
	ciprofloxacin		0.18 - 1.56	0.39	0.78
	ofloxacin		0.18 - 0.39	0.18	0.39
MRSA	floxacin	16	0.39 - 50	0.78	3.13
	tosufloxacin tosilate		0.05 - 6.25	0.05	0.18
	ciprofloxacin		0.39 - 100	0.39	3.13
	ofloxacin		0.39 - 25	0.39	0.78
<i>Escherichia coli</i>	floxacin	50	0.025 - 1.56	0.10	0.10
	tosufloxacin tosilate		0.025 - 1.56	0.025	0.05
	ciprofloxacin		0.025 - 0.78	0.05	0.05
	ofloxacin		0.025 - 0.78	0.05	0.10
<i>Klebsiella sp.</i>	floxacin	50	0.10 - 12.5	0.18	0.39
	tosufloxacin tosilate		0.025 - 3.13	0.05	0.10
	ciprofloxacin		0.025 - 6.25	0.05	0.18
	ofloxacin		0.025 - 12.5	0.10	0.39
<i>Acinetobacter calcoaceticus</i>	floxacin	50	0.10 - 1.56	0.39	0.78
	tosufloxacin tosilate		0.025 - 0.18	0.025	0.05
	ciprofloxacin		0.05 - 1.56	0.18	0.39
	ofloxacin		0.10 - 1.56	0.18	0.39
<i>Pseudomonas aeruginosa</i>	floxacin	50	0.10 - 12.5	1.56	6.25
	tosufloxacin tosilate		0.10 - 3.13	0.39	1.56
	ciprofloxacin		0.10 - 3.13	0.39	1.56
	ofloxacin		0.10 - 12.5	1.56	6.25
<i>Enterobacter cloacae</i>	floxacin	30	0.10 - 6.25	0.10	0.78
	tosufloxacin tosilate		0.025 - 1.56	0.025	0.18
	ciprofloxacin		0.025 - 3.13	0.05	0.39
	ofloxacin		0.05 - 3.13	0.10	0.39
<i>Serratia marcescens</i>	floxacin	30	0.10 - 1.56	0.18	0.18
	tosufloxacin tosilate		0.05 - 0.78	0.10	0.18
	ciprofloxacin		0.05 - 0.78	0.10	0.18
	ofloxacin		0.05 - 0.78	0.18	0.39
<i>Proteus mirabilis</i>	floxacin	30	0.10 - 0.39	0.18	0.39
	tosufloxacin tosilate		0.05 - 0.39	0.10	0.18
	ciprofloxacin		0.05 - 0.18	0.05	0.18
	ofloxacin		0.05 - 0.18	0.10	0.18
<i>Proteus vulgaris</i>	floxacin	20	0.10 - 0.18	0.10	0.10
	tosufloxacin tosilate		0.05 - 0.18	0.10	0.10
	ciprofloxacin		0.025 - 0.10	0.05	0.05
	ofloxacin		0.05 - 0.18	0.10	0.10
<i>Morganella morganii</i>	floxacin	7	0.05 - 0.10	0.05	0.10
	tosufloxacin tosilate		0.05 - 0.10	0.10	0.10
	ciprofloxacin		0.025 - 0.10	0.025	0.10
	ofloxacin		0.05 - 0.10	0.05	0.10

MSSA: methicillin-sensitive *Staphylococcus aureus*MRSA: methicillin-resistant *Staphylococcus aureus*

るMICは、若干TFLXやCPFXに劣るものの、0.025～1.56 $\mu\text{g/ml}$ に分布し、OFLXとほぼ同等の抗菌力を示した。MRSAに対しても、MIC₅₀は0.78 $\mu\text{g/ml}$ 、MIC₉₀は3.13 $\mu\text{g/ml}$ であった。また、*Klebsiella* sp. および *E. cloacae*のMIC₉₀はそれぞれ0.39 $\mu\text{g/ml}$ 、0.78 $\mu\text{g/ml}$ であり、*P. aeruginosa*のMIC₅₀は1.56 $\mu\text{g/ml}$ 、MIC₉₀は6.25 $\mu\text{g/ml}$ であり、OFLXとほぼ同等の成績であった。

2) 臨床的検討

FLRX投与症例の年齢、性、診断名、分離菌、投与量、投与日数、細菌学的効果、臨床効果および副作用を

Table 2-1、2-2にまとめて示した。

症例1の急性気管支炎の例は、本剤1回100mg、1日2回の投与を行ったが、2日間で服薬拒否され、効果判定からは除外した。

症例2の肺炎の例は、本剤1回200mg、1日2回を14日間投与した結果、有効であり、起炎菌の*Haemophilus influenzae*も消失した。

慢性気管支炎の症例3～10の8例では、本剤1回100～200mg、1日1～2回、6～13日間投与し、いずれも有効であった。細菌学的には、6症例6株(*H. influenzae* 2株、*S.*

Table 2-1. Clinical efficacy of fleroxacin

Case no.	Age (y) · Sex	Diagnosis	Underlying disease or complication	Isolated organism	Daily dose and duration	Evaluation		Side-effects
						bacteriological	clinical	
1	67 · M	acute bronchitis	none	ND	100 mg × 2 × 2	unknown	unevaluable	—
2	71 · M	pneumonia	bronchiectasis	<i>H. influenzae</i>	200 mg × 2 × 14	eradicated	good	—
3	69 · F	chronic bronchitis	hypertension	NF	200 mg × 2 × 7	unknown	good	—
4	67 · F	chronic bronchitis	none	<i>S. marcescens</i>	100 mg × 2 × 6	eradicated	good	—
5	59 · M	chronic bronchitis	none	β -streptococcus (A)	100 mg × 2 × 7	eradicated	good	—
6	70 · M	chronic bronchitis	diabetes mellitus angina pectoris	<i>P. aeruginosa</i>	200 mg × 1 × 13	decreased	good	—
7	68 · M	chronic bronchitis	none	<i>H. influenzae</i>	150 mg × 1 × 12	eradicated	good	—
8	56 · M	chronic bronchitis	chronic sinusitis	NF	200 mg × 1 × 12	unknown	good	—
9	55 · M	chronic bronchitis	chronic sinusitis	<i>H. influenzae</i>	200 mg × 2 × 7	eradicated	good	—
10	48 · M	chronic bronchitis	chronic sinusitis	<i>S. pneumoniae</i>	100 mg × 2 × 8	eradicated	good	—
11	58 · F	bronchiectasis	none	<i>P. aeruginosa</i>	100 mg × 2 × 14	persisted	good	—
12	58 · F	bronchiectasis	none	<i>P. aeruginosa</i>	100 mg × 2 × 14	persisted	good	—
13	34 · F	bronchiectasis	none	<i>S. aureus</i>	100 mg × 2 × 8	eradicated	good	—
14	35 · M	bronchiectasis	none	β -streptococcus (A) <i>E. coli</i>	200 mg × 1 × 7	eradicated	good	—

ND: not done, NF: normal flora

marcescens, β -streptococcus (A), *P. aeruginosa*, *Streptococcus pneumoniae*各1株)が分離され、*P. aeruginosa*は本剤投与により菌量減少が認められたのみであったが、他の5株は除菌された。

感染を伴う気管支拡張症の症例11~17の7例では、本剤1回100~200mg, 1日1~2回, 7~14日間投与し、全例に有効であった。細菌学的には、7症例9株(*P. aeruginosa* 4株, *H. influenzae* 2株, *S. aureus*, β -streptococcus (A), *E. coli*各1株)が分離され、*S. aureus*, β -streptococcus (A), *E. coli*, *H. influenzae*は除菌されたが、*P.*

aeruginosa 4株中1株は菌量が減少したものの、他の3株は本剤投与後も存続した。

症例18のびまん性汎細気管支炎の例では、本剤1回200mg, 1日2回, 7日間の投与により、臨床効果は有効であり、*P. aeruginosa*も消失した。

下気道感染を伴った気管支喘息の症例19~23の5例では、本剤1回150~200mg, 1日1~2回, 2~7日間投与した結果、有効2例、やや有効1例で、症例19および20では、嘔気、嘔吐のため、2日間で投薬を中止したため、効果判定からは除外した。細菌学的には、症例22で*S.*

Table 2-2. Clinical efficacy of feroxacin

Case no.	Age (y) · Sex	Diagnosis	Underlying disease or complication	Isolated organism	Daily dose and duration	Evaluation		Side-effects
						bacteriological	clinical	
15	58 · F	bronchiectasis	none	<i>P. aeruginosa</i> <i>H. influenzae</i>	150 mg × 2 × 7	→ <i>p. aeruginosa</i>	good	—
16	64 · F	bronchiectasis	none	<i>P. aeruginosa</i>	200 mg × 1 × 7	decreased	good	—
17	67 · F	bronchiectasis	old pulmonary tuberculosis	<i>H. influenzae</i>	200 mg × 1 × 7	eradicated	good	—
18	18 · M	diffuse panbronchiolitis	none	<i>P. aeruginosa</i>	200 mg × 2 × 7	eradicated	good	—
19	47 · F	bronchial asthma with infection	none	NF	200 mg × 1 × 2	unknown	unevaluable	nausea vomiting
20	52 · F	bronchial asthma with infection	none	ND	200 mg × 1 × 2	unknown	unevaluable	nausea vomiting
21	58 · M	bronchial asthma with infection	none	NF	200 mg × 2 × 7	unknown	good	—
22	17 · M	bronchial asthma with infection	none	<i>S. aureus</i>	200 mg × 1 × 7	eradicated	good	—
23	52 · F	bronchial asthma with infection	none	NF	150 mg × 2 × 7	unknown	fair	nausea abdominal fullness
24	67 · M	old pulmonary tuberculosis with infection	duodenal ulcer	ND	200 mg × 2 × 7	unknown	good	—
25	85 · M	old pulmonary tuberculosis with infection	none	ND	200 mg × 1 × 5	unknown	unevaluable	insomnia abdominal fullness
26	52 · M	pneumoconiosis with infection	none	<i>P. aeruginosa</i>	200 mg × 1 × 5	persisted	good	—
27	68 · F	acute cystitis	articular rheumatism hypertension cardiac insufficiency	<i>E. coli</i>	200 mg × 2 × 7	eradicated	excellent	—

ND: not done, NF: normal flora

*aureus*が分離されたが、本剤投与後除菌された。

症例24, 25の下気道感染を伴った陳旧性肺結核の2例には、本剤1回200mg, 1日1~2回, 5~7日間の投与を行った。その結果、症例24は有効であったが、症例25は、不眠、腹部膨満感のため服薬拒否され、効果判定からは除外した。

症例26の下気道感染を伴ったじん肺の例では、本剤1回200mg, 1日1回, 5日間の投与により、臨床効果は有効で、*P. aeruginosa*は存続した。

症例27の急性膀胱炎の例では、本剤1回200mg, 1日2回, 7日間の投与により、著効を示し分離された*E. coli*も消失した。

以上27例での総合臨床成績は著効1例, 有効21例, やや有効1例, 判定不能4例で、有効率95.7%であった。

副作用は、嘔気・嘔吐が症例19, 20に、嘔気・腹部膨満感が症例23に、不眠・腹部膨満感が症例25に認められたが、いずれの症状も投与中止または終了後にすみやかに消失した。

本剤投与前後の臨床検査成績はTable 3に示したが、症例22で軽度のS-GPT上昇がみられたのみであった。

Ⅲ. 考 察

1977年にnorfloxacin (NFLX)が開発されて以来、OFLX, enoxacin (ENX), CPMXなど新しいキノロン剤があいついで開発、登場してきているが、これらはいずれも既存のキノロン剤に比しグラム陰性桿菌類に対する抗菌力が飛躍的に増強されている。しかもnalidixic acid (NA)やpipemidic acid (PPA)がほとんど無効であった*S. aureus*や*Streptococcus*などグラム陽性球菌群、さらに緑膿菌にまで抗菌スペクトルが拡大されている⁴⁾。

今回検討を行ったFLRXも、各種臨床分離株に対するMICをみると、MSSA, *E. coli*, *A. calcoaceticus*, *S. marcescens*, *P. mirabilis*, *P. vulgaris*, *M. morgani*に対して極めて優れた抗菌力を有していた。さらに最近、重要な院内感染菌として問題になっているMRSA⁵⁾に対しても、FLRXは優れた抗菌力を有していた。また*Klebsiella* sp. や*P. aeruginosa*に対しても、ほとんどの株が3.13 μg/ml

Table 3. Laboratory findings before and after treatment with fleroxacin

Case no.	Ht (%)		Hb (g/dl)		RBC ($\times 10^4/\text{mm}^3$)		WBC (/mm ³)		Eosino. (%)		S-GOT (IU)		S-GPT (IU)		Al-Pase (IU)		BUN (mg/dl)		Creatinine (mg/dl)	
	before	after	before	after	before	after	before	after	before	after	before	after	before	after	before	after	before	after	before	after
1	—	40.4	—	13.6	—	429	—	6400	—	3	10	16	10	17	69	64	11	14	0.9	0.9
2	31.7	32.3	10.6	10.5	337	344	5600	4200	17	12	31	37	35	48	82	61	15	16	0.7	0.7
3	39.3	38.8	12.6	12.9	425	428	5400	7000	5	0	14	14	9	7	66	65	26	16	0.7	0.8
4	42.1	42.4	14.4	14.4	482	479	7000	6800	2	3	14	12	17	9	71	67	22	14	0.6	0.6
5	40.5	41.2	13.6	14.1	419	427	11400	7700	37	23	17	18	30	24	53	53	9	10	1.0	1.1
6	40.0	36.6	12.6	11.9	431	412	8000	5700	5	5	13	11	8	9	81	70	13	14	0.8	0.6
7	42.8	41.2	13.7	14.2	431	434	5700	4100	4	5	34	25	33	17	62	63	16	12	0.8	0.7
8	43.6	42.7	14.3	13.7	447	441	8200	6000	2	5	11	11	8	7	59	51	17	17	0.9	0.8
9	38.7	42.2	13.1	13.8	438	480	9100	5100	3	0	12	13	16	14	80	54	21	19	0.8	0.9
10	47.5	46.2	16.1	15.6	494	482	5200	4800	3	0	20	20	20	16	78	75	—	15	—	1.0
11	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—
12	—	41.6	—	13.7	—	446	5200	9000	3	2	15	13	12	9	61	59	—	—	—	—
13	37.4	37.1	11.5	11.8	479	481	7500	7200	3	3	10	12	5	9	51	49	10	13	0.8	0.7
14	42.6	45.1	14.7	15.8	501	529	10500	5900	1	4	14	15	11	11	62	70	21	21	0.8	0.9
15	41.6	42.7	13.7	14.0	446	458	9000	5600	2	4	13	15	9	11	59	54	—	9	—	0.7
16	36.9	34.2	12.0	11.4	371	363	5500	4800	1	2	20	15	20	14	46	42	15	16	0.7	0.8
17	34.5	36.0	10.8	11.4	369	400	3900	4700	2	4	8	18	9	14	53	53	17	21	0.7	0.7
18	40.1	37.7	13.3	12.9	460	455	10600	6100	5	0	8	11	5	5	66	57	11	12	0.8	0.8
19	37.9	41.6	12.5	13.9	420	467	7400	8200	8	—	16	14	14	12	44	45	12	12	0.7	0.8
20	39.9	38.0	13.7	13.5	469	453	7400	3800	15	17	9	14	10	12	78	56	11	12	0.6	0.6
21	46.0	44.9	15.5	14.7	463	446	8300	5800	8	6	11	12	20	14	38	28	16	18	1.0	1.1
22	47.6	43.4	15.1	14.4	528	497	10500	8500	23	7	26	13	17	28	127	90	16	11	0.9	0.9
23	42.7	41.0	14.3	14.0	479	460	9300	8700	0	4	18	15	18	18	47	42	14	16	0.7	0.7
24	39.9	39.5	13.7	13.3	451	443	10900	7600	—	2	10	8	8	8	76	72	16	16	0.9	0.9
25	39.0	36.9	12.6	11.9	390	374	9300	9100	5	—	—	16	—	11	—	52	—	21	—	1.4
26	44.3	43.9	16.3	15.6	473	465	5300	6000	1	3	28	29	42	44	51	47	18	12	0.9	1.0
27	32.7	32.6	10.9	10.4	369	376	9700	8300	0	4	14	14	17	14	70	68	18	14	1.1	0.9

以下で発育が阻止された。

しかしFLRXは、現在でも市中肺炎の重要な起炎菌と考えられる*S. pneumoniae*に対する抗菌力が、他剤に比し比較的弱いので¹⁾、呼吸器感染症に使用する際注意が必要である。

今回27例の呼吸器感染症を主とする臨床的検討では、評価可能な23例中22例が有効以上の成績で有効率95.7%と極めて優れた成績であった。また細菌学的にも、*H. influenzae*, *S. marcescens*, β -streptococcus (A), *S. aureus*, *E. coli*は全株除菌され、比較的弱いと考えられる*S. pneumoniae*の1例も除菌された。しかし、*P. aeruginosa*は7株が分離されたが、除菌されたのは1回200mg 1日2回投与された1株のみで、1回200mg 1日1回投与の2株は減少したものの残り4株は治療後も存続した。*P. aeruginosa*感染に対しては、今後さらに投与量について検討する必要がある。

副作用は27例中4例に認められたが、臨床検査値の異常は1例に認められたのみであった。全国集計成績での副作用発現率は1182例中53例、4.5%であるが、投与量が増すにつれて増加する傾向があり、特に1日400mg以上で高率に認められている。FLRXの1日投与量は300mg以下が好ましいと考えられる。

ところで、ある種のニューキノロン剤では、フェンブフェンなど消炎鎮痛剤との併用による痙攣発作の誘発や、テオフィリンとの併用でその血中濃度を上昇させることが知られているが⁶⁾、FLRXは痙攣誘発発作も弱く、テオフィリンの血中濃度にもほとんど影響がなく、アルミゲルなど制酸剤による影響も少ない薬剤である¹⁾。

さらに、本剤の最も特徴的な点は血中半減期が約10時間と既存の同系薬剤に比べ長いことであり、1日1回投与でも十分な効果が期待される。二木ら⁷⁾の肺炎桿菌肺炎マウスに対する治療実験でも、1日1回投与で1日3

回投与と同等の成績が得られている。さらに用量比較試験でもFLRX 1日1回300mg投与でOFLX 600mg分3投与に優るとも劣らぬ成績が得られている¹⁾。

以上よりFLRXは呼吸器感染症に対して1日200~300mg 1回投与で十分な有用性が期待し得る薬剤であると考えられる。

文 献

- 1) 谷村 弘, 副島林造: 第37回日本化学療法学会西日本支部総会, 新薬シンポジウム. AM-833 (Fleroxacin), 和歌山, 1989
- 2) NAKASHIMA M, KANAMARU M, UEMATSU T, TAKIGUCHI A, MIZUNO A, ITAYA T, KAWAHARA F, OOE T, SAITOU S, UCHIDA H and MASUZAWA K: Clinical pharmacokinetics and tolerance of fleroxacin in healthy male volunteers. J Antimicrobial Chemotherapy 22, Suppl.D: 133~144, 1988
- 3) 副島林造: 本邦に於けるこれからの臨床評価のあり方—特に呼吸器感染症について—. 最新医学 44: 2481~2489, 1989
- 4) 副島林造, 梅木茂宣: 呼吸器感染症の展望. 感染症 17: 81~89, 1987
- 5) 中浜 力, 黒川幸徳, 藤井千穂, 副島林造: MRSA院内流行と呼吸器感染症. 最新医学 44: 2522~2530, 1989
- 6) 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
- 7) 二木芳人, 渡辺正俊, 田坂佳千, 角 優, 岸本寿男, 副島林造: 実験的マウス肺炎に対する Fleroxacin の治療効果について. Chemotherapy 38(S-2): 94~99, 1990

BASIC AND CLINICAL STUDIES ON FLEROXACIN

RINZO SOEJIMA, NIRO OKIMOTO, YOSHIHITO NIKI, JIRO HINO, MASARU SUMI and YOSHIHISA NAKAGAWA
Division of Respiratory Diseases, Department of Medicine, Kawasaki Medical School,
577 Matsushima, Kurashiki 701-01, Japan

We performed laboratory and clinical studies on fleroxacin, a new quinolone, with the following results.

1. The MICs of fleroxacin against methicillin-sensitive *Staphylococcus aureus* (MSSA), *Escherichia coli*, *Acinetobacter calcoaceticus*, *Serratia marcescens*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris* and *Morganella morganii* were 0.025–1.56 $\mu\text{g/ml}$, which were inferior to those of tosfloxacin tosilate and CFX and almost equal to those of OFLX. The peak MICs against methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* (MRSA), *Klebsiella* sp., *Enterobacter cloacae* and *Pseudomonas aeruginosa* were less than 3.13 $\mu\text{g/ml}$.

2. Twenty-six patients with respiratory tract infections and one with acute cystitis were treated with fleroxacin at 100–200 mg, once or twice daily. The clinical efficacy rate was 95.7%.

As side effects, nausea and vomiting were observed in two patients, nausea and abdominal fulness were observed in one patient, and insomnia and abdominal fulness in another. Slight elevation of S-GPT was also noted in one patient.