

尿路・性器感染症に対する sparfloxacin の臨床的検討

小野寺昭一・清田 浩・後藤博一

川原 元・五十嵐宏・町田豊平

東京慈恵会医科大学泌尿器科学教室*

岡崎武二郎

東京都立台東病院泌尿器科

Sparfloxacin の尿路・性器感染症に対する臨床効果について検討した。対象は急性単純性膀胱炎 5 例、複雑性尿路感染症 4 例、急性細菌性前立腺炎 2 例、淋菌性尿道炎 20 例、淋菌性クラミジア性尿道炎 6 例、クラミジア性尿道炎 22 例、非淋菌性非クラミジア性尿道炎 32 例の計 91 例である。投与方法は全例 1 日 1 回投与とし、急性単純性膀胱炎には 50 mg、複雑性尿路感染症には 200 mg、急性細菌性前立腺炎には 100 mg、尿道炎には 100~300 mg を 3~14 日間投与した。UTI 薬効評価基準により 58 例が判定可能であった。急性単純性膀胱炎では著効 5 例、複雑性尿路感染症では著効 1 例、有効 2 例、急性細菌性前立腺炎では著効 2 例、淋菌性尿道炎では著効 9 例、有効 11 例、淋菌性クラミジア性尿道炎では著効 4 例、有効 2 例、クラミジア性尿道炎では著効 15 例、有効 7 例であり、いずれも 100% の有効率であった。主治医により判定された非淋菌性非クラミジア性尿道炎では、著効 24 例、有効 8 例で有効率は 100% であった。投与前に分離された淋菌 25 株について、本剤、enoxacin, ofloxacin, norfloxacin, ciprofloxacin の感受性を測定したが、本剤の MIC₉₀ は 0.0125 μg/ml であり、5 剤の中で一番強い抗菌力を示した。副作用として、軽度の下痢、全身発疹を各 1 例に認めた。

本剤は尿路・性器感染症に対して有用な薬剤であり、尿道炎に対する優れた効果は特記すべきものと考えられた。

Key words : Sparfloxacin, 尿路感染症, 尿道炎

Sparfloxacin (SPFX) は、大日本製薬(株)総合研究所で開発されたニューキノロン剤で、グラム陽性菌を始めグラム陰性菌、嫌気性菌などに対し幅広い優れた抗菌力を有し、とくにこれまでのニューキノロン剤では作用の弱かった *Mycoplasma spp.*, *Chlamydia trachomatis* (クラミジア) にも強い抗菌力を有するとされている¹⁾。体内動態の面では、血中消失半減期が約 16 時間と長いのが特徴であり、尿中には未変化体として約 10%、グルクロン酸抱合体として約 30% の計約 40% が排泄される²⁾。今回われわれは、尿路・性器感染症患者を対象として本剤の 1 日 1 回投与による治療効果について検討した。

I. 対象および方法

対象は、1988 年 6 月から 1989 年 12 月までの間に慈恵医大泌尿器科および関連施設の泌尿器科を受診した尿

路・性器感染症患者で、その内訳は、急性単純性膀胱炎 5 例、複雑性尿路感染症 4 例、急性細菌性前立腺炎 2 例、淋菌性尿道炎 20 例、淋菌性クラミジア性尿道炎 6 例、クラミジア性尿道炎 22 例、非淋菌性非クラミジア性尿道炎 32 例の計 91 例である。

投与方法は全例 1 日 1 回投与とし、急性単純性膀胱炎には 50 mg を 3 日間、複雑性尿路感染症には 200 mg を 5 日間、急性細菌性前立腺炎には 100 mg を 7 日間、尿道炎には 100~300 mg を 3 から 14 日間投与した。

効果判定は、非淋菌性非クラミジア性尿道炎を除いて、UTI 薬効評価基準第 3 版³⁾ および追補⁴⁾ にしたがって行った。非淋菌性非クラミジア性尿道炎の判定は、判定日 (7 日および 14 日) に尿道分泌物、分泌物中の多形核白血球、初尿中の多形核白血球がすべて正常化したものを著効、分泌物および初尿中の多形核白血球が完全に消失はしなくても尿道分泌物が消失したものを

*〒105 東京都港区西新橋 3-25-8

Table 1. Clinical summary of acute uncomplicated cystitis patients treated with sparfloxacin

Case no.	Age	Sex	Diagnosis	Treatment		Symptoms*	Pyuria*	Bacteriuria*			Evaluation**		Side effect
				dose mg×/day	duration (day)			species	count (CFU/ml)	MIC (μg/ml)	UTI	Dr	
1	52	F	AUC	50×1	3	#	#	<i>E. coli</i>	10 ⁴		excellent	good	
						-	-	GPR	<10 ⁴				
2	48	F	AUC	50×1	3	#	#	<i>E. coli</i>	10 ⁷	≤0.0125	excellent	good	
						-	-	-					
3	61	F	AUC	50×1	3	#	#	<i>E. coli</i>	10 ⁷	≤0.0125	excellent	good	
						-	-	-					
4	25	F	AUC	50×1	3	#	#	<i>E. coli</i>	10 ⁷	≤0.0125	excellent	good	
						-	-	CNS	<10 ⁴				
5	43	F	AUC	50×1	3	+	#	CNS	10 ⁴		excellent	good	-
						-	-	-					

AUC : acute uncomplicated cystitis

GPR : Gram-positive rod

CNS : coagulase-negative *Staphylococcus*MIC : inoculum size 10⁴ cells/ml* before treatment
after treatment** UTI : criteria proposed by the Japanese UTI Committee
Dr : doctor's evaluation

有効, その他は無効とした。

なお, 淋菌性尿道炎, 淋菌性クラミジア性尿道炎合わせて25例から分離された淋菌25株に対する本剤の最小発育阻止濃度(MIC)を測定したが, 測定方法はYeast Autolysate Supplementを添加した改良サイヤマーチン培地を用いた平板希釈法で行った。接種菌量は10⁶ CFU/mlとし, 37°C, 48時間のローソク培養法により培養を行い, 対照薬として, enoxacin (ENX), norfloxacin (NFLX), ofloxacin (OFLX), ciprofloxacin (CPFX)を用いた。

II. 成績

1. 臨床的検討

急性単純性膀胱炎5例においては全例UTI薬効評価基準による効果判定が可能であったが, 著効5例で全てに有効であった。分離起炎菌は4例が*Escherichia coli*で, 1例がcoagulase-negative *Staphylococcus* (CNS)であったが全例除菌された(Table 1)。複雑性尿路感染症4例においては1例で投与前の菌が陰性で, 3例においてのみ薬効評価可能であったが, 1例が著効, 2例が有効であった。起炎菌は3例とも*E. coli*

で, 全例除菌された(Table 2)。急性細菌性前立腺炎の起炎菌は2例とも*E. coli*であったが, 2例とも除菌され著効であった(Table 3)。

淋菌性尿道炎26例に対する本剤の効果は, Table 4に示した。本剤の1回投与量は100 mgが1例, 150 mgが12例, 200 mgが10例, 300 mgが3例であり, 投与期間は3日から9日であったが, 全例7日目には淋菌の消失がみられ, 各投与量, 投与期間による淋菌の消失率に差はみられなかった。この中で, 淋菌が単独で分離された20例のうち, 3日目で判定可能であった14例では, 13例が有効で1例が著効であった。7日目判定が行われた14例では, 著効8例, 有効6例であり, 最終判定による集計では著効9例, 有効11例であった。淋菌にクラミジアを合併した6例では, 3日目で判定可能な4例中4例が有効, 7日目で判定可能な5例中4例が著効, 1例が有効であり, 全例有効以上の成績であった。なお, 尿道分泌物や分泌物中の多形核白血球の改善の度合いについては, 投与量による差はみられなかった。

クラミジア性尿道炎22例に対する本剤の効果はTable 5に示した。1回投与量は, 100 mgが4例, 150 mgが10例, 200 mgが7例, 300 mgが1例で。

Table 2. Clinical summary of complicated UTI patients treated with sparfloxacin

Case no.	Age	Sex	Diagnosis	Catheter (route)	UTI group	Treatment		Symptoms	Pyuria	Bacteriuria			Evaluation		Side effect
			underlying condition			dose mg/day	duration (day)			species	count (CFU/ml)	MIC (μ g/ml)	UTI	Dr	
1	57	F	CCP	-	G-3	200×1	5	-	#	<i>E. coli</i>	10 ⁴	≤0.0125	moderate	good	-
			ureteral stone					-	+	-	-				
2	73	F	CCC		G-4	200×1	5	#	#	<i>E. coli</i>	10 ⁷	≤0.0125	excellent	excellent	-
			neurogenic bladder					-	-	-	-				
3	80	F	CCC		G-4	200×1	5	#	#	<i>E. coli</i>	10 ⁴	≤0.0125	moderate	good	
			neurogenic bladder					-	±	-	-				
4	39	M	CCC			200×1	5	#	#	-	-	-		fair	
			ureteral stone					+	-	-	-				

CCP : chronic complicated pyelonephritis

CCC : chronic complicated cystitis

MIC : inoculum size 10⁶ cells/ml

Table 3. Clinical summary of acute bacterial prostatitis patients treated with sparfloxacin

Case no.	Age	Sex	Diagnosis	Treatment		Symptoms		Granulo-cytes (VB ₂)	Bacteriuria (VB ₂)			Evaluation		Side effect
				dose mg/day	duration (day)	fever	miction pain		species	count (CFU/ml)	MIC (μ g/ml)	UTI	Dr	
1	57	M	ABP	100×1	7	+	#	#	<i>E. coli</i>	10 ⁷	≤0.0125	excellent	good	-
						-	-	-	-					
2	53	M	ABP	100×1	7	#	#	#	<i>E. coli</i>	10 ⁴	≤0.0125	excellent	good	-
						-	-	-	-					

ABP : acute bacterial prostatitis

MIC : inoculum size 10⁶ cells/ml

投与期間は4日間投与が1例、7日間投与が11例、14日間投与が10例であったが、すべての症例で7日目にクラミジアが消失していた。これら22例の7日目判定では、著効8例、有効14例で全例有効以上であり、このうち14日間の投与後に判定できた10例はすべて著効であった。これらの最終判定による集計では、著効15例、有効7例であった。淋菌性尿道炎と同様に、各投与量による尿道分泌物や分泌物中の多形核白血球の改善の度合いに差はみられなかった。

非淋菌性非クラミジア性尿道炎に対する本剤の効果はTable 6に示した。1回投与量は100 mgが2例、150 mgが13例、200 mgが13例、300 mgが4例で、投与期間は5日間投与が1例、7日間投与が28例、14日

間投与が3例であった。全例7日目で判定可能であったが、著効24例、有効8例であり、14日目に判定された3例は著効であった。また、非淋菌性非クラミジア性尿道炎においても各投与量による有効率の差はみられなかった。

副作用として、全身発疹、下痢を各1例に認めた。全身発疹がみられたのは、クラミジア性尿道炎のNo. 2の症例であるが、本剤投与4日後に全身発疹があり、患者自身が服薬を中止した。7日目来院時、軽度の発疹が認められたため、抗アレルギー剤を投与し改善がみられた。下痢がみられた症例は、非淋菌性非クラミジア性尿道炎のNo. 31の症例で、本剤の服用開始10日後より軽度の下痢がみられたがとくに処置を必要とせず、投与

Table 4. Clinical summary of male gonococcal urethritis treated with sparfloxacin

Case no.	Name	Age (y)	B W (kg)	Administration of sparfloxacin		Neisseria gonorrhoeae			Chlamydia trachomatis			Urethral discharge			PMNL in smear			First urine PMNL			Evaluation UTI ¹⁾		Side effect			
				daily dose (mg×/time)	duration (day)	0d	3d	7d	0d	3d	7d	0d	3d	7d	0d	3d	7d	0d	3d	7d	0d	3d		7d	3d	7d
1	K.K.	44	64	100×1	7	+	-	-	-	-	-	2+	+	-	+	+	-	+	-	-	M	E	-			
2	S.H.	52	60	150×1	7	+	-	-	-	-	-	3+	+	-	+	+	-	+	+	-	M	E	-			
3*	K.K.	39	50	150×1	7	+	-	-	+	-	-	2+	+	-	+	+	-	+	+	-	M	E(E)	-			
4	M.I.	32	82	150×1	7	+	-	-	-	-	-	3+	-	-	+	+	-	+	-	-	M	E	-			
5	Y.Y.	30	72	150×1	3	+	-	-	-	-	-	3+	+	-	+	+	-	+	-	-	M	M	-			
6	K.N.	36	81	150×1	3	+	-	-	-	-	-	3+	2+	-	+	+	-	+	+	-	M	M	-			
7	S.H.	52	60	150×1	3	+	-	-	-	-	-	3+	-	-	+	-	-	+	-	-	E		-			
8	T.K.	36	54	150×1	7	+	-	-	-	-	-	3+	2+	-	+	+	0	+	-	-	M	E	-			
9	M.O.	34	82	150×1	3	+	-	-	-	-	-	2+	-	-	+	+	-	+	+	-	M	M	-			
10	M.M.	29	70	150×1	7	+	-	-	+	-	-	3+	-	-	+	+	-	+	-	-	M	E(E)	-			
11	H.H.	51	72	150×1	7	+	-	-	-	-	-	2+	+	-	+	+	0	-	-	-	M	E	-			
12	K.O.	41	74	150×1	7	+	-	-	-	-	-	2+	+	-	+	+	-	+	-	-	M	E	-			
13*	Y.O.	39	78	150×1	3	+	-	-	+	-	-	3+	-	-	+	+	-	+	+	-	M		-			
14	K.S.	28	70	200×1	5	+	-	-	-	-	-	3+	-	-	+	+	-	+	-	-	M		-			
15	M.W.	26	63	200×1	7	+	-	-	-	-	-	3+	-	-	+	-	-	+	+	-	M	M	-			
16	T.M.	31	62	200×1	9	+	-	-	-	-	-	3+	-	-	+	+	+	+	+	+	M	M	-			
17	I.M.	45	65	200×1	7	+	-	-	+	+	-	3+	-	-	+	+	-	+	-	-	M	E(E)	-			
18	A.U.	23	65	200×1	7	+	-	-	-	-	-	3+	-	-	+	+	-	+	+	-	M	M	-			
19*	N.A.	20	50	200×1	7	+	-	-	+	-	-	2+	-	-	+	+	-	+	-	-	M(M)		-			
20	N.O.	42	58	200×1	3	+	-	-	-	-	-	2+	-	-	+	+	-	+	-	-	M		-			
21	S.O.	44	57	200×1	7	+	+	-	-	-	-	+	-	-	+	+	-	+	-	-	M	M	-			
22	T.K.	22	72	200×1	7	+	-	-	+	-	-	2+	-	-	+	-	-	+	-	-	E	E	-			
23	T.A.	46	57	200×1	7	+	-	-	-	-	-	2+	-	-	+	0	-	+	0	-	E		-			
24	H.K.	20	50	300×1	7	+	-	-	-	-	-	3+	+	-	+	+	+	+	-	+	M	M	-			
25	H.N.	58	72	300×1	7	+	+	-	-	-	-	+	-	-	+	-	-	-	-	-	E		-			
26	M.S.	47	80	300×1	7	+	-	-	-	-	-	2+	-	-	+	+	-	+	-	-	M		-			

* PPNG (penicillinase producing *Neisseria gonorrhoeae*)

PMNL : polymorphonuclear leukocyte

¹⁾ criteria proposed by the Japanese UTI Committee

E : excellent M : moderate d : day

() : evaluation to chlamydial urethritis at 7th day

終了後3日目に消失した。また、臨床検査値は検査し得た限りでは異常を認めなかった。

2. 基礎的検討

淋菌性尿道炎患者から分離された淋菌25株に対する本剤、ENX、NFLX、OFLX、CPFXのMICをTable 7に示した。本剤は淋菌に対しMIC₅₀でENX、NFLXより3管、CPFXより1管優れ、MIC₉₀でも同様に優れた抗菌力を示した。また、ペニシリン耐性淋菌(PPNG)に対しても、他剤に比し1~3管優れた抗菌力を示した。

III. 考 察

1984年にNFLXが臨床に供されて以来、ENX、OFLX、CPFXなどのニューキノロン剤の開発と各臨床科における普及には目覚ましいものがある。とくに、この系統の薬剤のグラム陽性菌、陰性菌に対する優れた

抗菌力と良好な組織移行性は、尿路・性器感染症に対して優れた治療効果をもたらし、現在では注射剤にも変わり得る薬剤として評価されている⁵⁾。Sparfloxacinは、最も新しいニューキノロン剤の1つであるが、抗菌力における特徴として、まず、グラム陽性球菌に対し従来のこの系統の薬剤であるCPFX、OFLX、NFLX、ENXよりも優れた抗菌力を示し⁶⁾、とくにMRSA(メチシリン耐性黄色ブドウ球菌)に対しては優れた抗菌力を示すとされている⁷⁾。グラム陰性桿菌に対してはCPFXと同等の抗菌力を示すが^{1), 6)}、尿道炎の病原体として重要な淋菌、クラミジアに対する抗菌力は、従来のニューキノロン剤に比し格段に優れたものとされている¹⁾。また、体内動態の面では、血中半減期が約16時間と長く²⁾、組織内移行も良好なため³⁾、1日1回の投与で従来の1日3回投与と同等の十分な治療効果が得られることが期待されている。こうしたsparfloxacinの抗

Table 5. Clinical summary of *Chlamydia trachomatis*-positive male non-gonococcal urethritis treated with sparfloxacin

Case no.	Name	Age (y)	BW (kg)	Administration of sparfloxacin		<i>Neisseria gonorrhoeae</i>			<i>Chlamydia trachomatis</i>			Urethral discharge			PMNL in smear			First urine PMNL			Evaluation		Side effect
				daily dose (mg×/time)	duration (day)	0d	7d	14d	0d	7d	14d	0d	7d	14d	0d	7d	14d	0d	7d	14d	7d	14d	
1	S.H.	43	85	100×1	7	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E		-			
2	M.N.	24	66	100×1	4	-	-	+	-	2+	-	+	+	+	-	+	-	M		raah			
3	K.Y.	32	60	100×1	7	-	-	+	-	2+	-	+	-	+	-	+	-	E		-			
4	S.S.	23	76	100×1	7	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E		-			
5	T.I.	24	70	150×1	7	-	-	+	-	2+	-	+	-	+	+	+	-	M		-			
6	Y.S.	39	61	150×1	7	-	-	+	-	+	-	+	-	+	+	+	-	M		-			
7	K.M.	46	70	150×1	14	-	-	+	-	+	-	+	+	-	+	-	-	M	E	-			
8	H.T.	27	65	150×1	7	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	-	-	E		-			
9	Y.F.	28	58	150×1	7	-	-	+	-	+	-	+	+	-	+	-	-	M		-			
10	O.K.	25	64	150×1	14	-	-	+	-	2+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-			
11	T.H.	26	68	150×1	14	-	-	+	-	2+	+	+	+	-	+	-	-	M	E	-			
12	M.M.	27	78	150×1	14	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-			
13	K.I.	35	61	150×1	14	-	-	+	-	2+	-	+	+	-	+	-	-	M	E	-			
14	T.I.	33	70	150×1	7	-	-	+	-	2+	-	+	-	+	-	+	-	E		-			
15	M.H.	40	55	200×1	14	-	-	+	-	2+	-	+	+	-	+	-	-	M	E	-			
16	T.K.	26	64	200×1	14	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-			
17	H.S.	48	60	200×1	7	-	-	+	-	+	-	+	+	+	-	+	-	M		-			
18	T.I.	33	70	200×1	14	-	-	+	-	+	-	+	-	+	+	-	-	M	E	-			
19	K.T.	31	62	200×1	14	-	-	+	-	2+	-	+	+	-	+	-	-	M	E	-			
20	T.T.	27	70	200×1	7	-	-	+	-	+	-	+	+	+	+	-	-	M		-			
21	D.S.	51	51	200×1	7	-	-	+	-	2+	-	+	+	+	+	-	-	M		-			
22	C.Y.	50	49	300×1	14	-	-	+	-	+	-	+	+	-	+	+	-	M	E	-			

* post-gonococcal urethritis

¹⁾ criteria proposed by the Japanese UTI Committee²⁾ doctor's evaluation

菌と体内動態の特徴を考慮して今回われわれは、尿路・性器感染症を対象として、本剤の1日1回投与法による治療効果について検討した。急性単純性膀胱炎に対しては、評価可能な症例は5例と少なかったが、1日50mg、3日間の投与により優れた成績が得られた。複雑性尿路感染症、急性細菌性前立腺炎においても、200mgあるいは100mgの1日1回投与で全例有効以上の成績が得られた。今回のような少ない症例数で、尿路感染症あるいは前立腺炎に対する本剤の臨床評価を行うことは困難であるが、従来のこの系統の薬剤の臨床治療成績と比較すると^{9, 10)}、1回50mgから200mgの少ない投与量を1日1回投与することにより、従来の薬剤と同程度の効果が期待できると言えるであろう。尿道炎80例に対し本剤は、淋菌性尿道炎、淋菌性クラミジア性尿道炎、クラミジア性尿道炎、非淋菌性非クラミジア性尿道炎の何れにおいても有効以上の優れた成績を示した。従来、ニューキノロン剤は淋菌に対し非常に優れた抗菌力を示し、疫学的、治療学的に問題となっているPPNGに対しても良い治療効果が得られている¹¹⁾。一方、ク

ラミジアに対しては、OFLXを除いて¹²⁾、臨床的に治療効果が期待できる抗菌力が得られていないため、尿道炎に対する治療薬としては適応が制限されていた。しかし、本剤は淋菌に対し、MIC₉₀は0.0125 μg/ml、クラミジアに対してはMIC₉₀は0.063 μg/ml¹¹⁾と優れた抗菌力を示し、従来のニューキノロン剤とは異なった特徴を有している。この基礎的な抗菌力は今回われわれが行った臨床試験でも十分に反映され、1日1回の投与で全ての尿道炎症例に有効であった。尿道炎に対する本剤の1回投与量は、100mgから300mgまで4段階に分けて投与したが、1回100~200mgの投与で十分な効果が得られ、今回の結果からは、1回300mgの投与は必要ないものと思われた。副作用は、全身発疹と下痢がそれぞれ1例ずつみられたが重篤なものではなく、安全性に関して問題はないものと思われた。

以上より、sparfloxacinは尿路・性器感染症、とくに尿道炎の治療薬として、起炎微生物の種類を問わず優れた効果が期待できる薬剤であると思われた。

Table 6. Clinical summary of *Chlamydia trachomatis*-negative male non-gonococcal urethritis treated with sparfloracin

Case no.	Name	Age (y)	B W (kg)	Administration of sparfloracin		<i>Neisseria gonorrhoeae</i>			<i>Chlamydia trachomatis</i>			Urethral discharge			PMNL in smear			First urine PMNL			Evaluation		Side effect		
				daily dose (mg×/time)	duration (day)	0d	7d	14d	0d	7d	0d	7d	14d	0d	7d	14d	0d	7d	14d	0d	7d	14d		Dr ¹⁾	
																								7d	14d
1	K.M.	34	72	100×1	7	-	-	-	-	-	2+	-	+	+	+	-	+	-	G	E	-				
2	S.O.	24	60	100×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
3	Y.T.	29	52	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
4	Y.N.	37	58	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
5	S.S.	38	70	150×1	7	-	-	-	-	-	2+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
6	M.K.	31	70	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	+	+	-	+	-	G	E	-				
7	M.U.	25	77	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
8	S.S.	25	70	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
9	T.N.	55	48	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
10	Y.K.	45	54	150×1	7	-	-	-	-	-	2+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
11	T.I.	38	67	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	+	+	+	+	+	G	E	-				
12	T.N.	29	65	150×1	7	-	-	-	-	-	2+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
13	T.H.	63	64	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
14	S.I.	52	53	150×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	+	+	+	+	+	G	E	-				
15	T.I.	25	57	150×1	7	-	-	-	-	-	2+	-	+	+	+	+	+	+	G	E	-				
16	S.H.	41	62	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	G	E	-				
17	H.K.	51	64	200×1	14	-	-	-	-	-	2+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
18	K.N.	56	56	200×1	5	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
19	K.I.	35	61	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	+	-	-	-	-	G	E	-				
20	T.M.	37	66	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
21	T.T.	52	63	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
22	Y.M.	52	62	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	+	-	0	-	0	G	E	-				
23	T.Y.	38	75	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	0	+	0	+	0	E	E	-				
24	H.I.	41	55	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
25	K.H.	29	60	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
26	K.T.	38	60	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	-				
27	N.A.	32	67	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
28	T.Y.	24	70	200×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	+	+	+	+	+	G	E	-				
29	T.N.	54	65	300×1	14	-	-	-	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
30	T.N.	44	60	300×1	7	-	-	-	-	-	2+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
31	H.U.	44	70	300×1	14	-	-	-	-	-	+	-	+	-	+	-	+	-	E	E	-				
32	H.A.	33	56	300×1	7	-	-	-	-	-	+	-	+	-	-	-	-	-	E	E	diarrhea				

* post-gonococcal urethritis

1) doctor's evaluation

E: excellent

G: good

文 献

- 1) Nakamura S, et al.: *In Vitro* and *in vivo* antibacterial activities of AT-4140, a new broad-spectrum quinolone. *Antimicrob Agents Chemother* 33: 1167~1173, 1989
- 2) 中島光好, 金丸光隆, 植松俊彦, 滝口祥令: ピリドンカルボン酸系抗菌剤 sparfloracin の臨床第 I 相試験. *臨床医薬* 7 卷 8 号掲載予定
- 3) UTI 研究会 (代表: 大越正秋): UTI 薬効評価基準 (第 3 版). *Chemotherapy* 34: 408~441, 1986
- 4) UTI 研究会 (代表: 大越正秋): UTI 薬効評価基準 (第 3 版), 追補. 1989 年 5 月
- 5) 小野寺昭一. 他: 有熱性尿路感染症に対する経口

抗菌剤の適応に関する臨床的検討. *化学療法* の領域 5: 1039~1044, 1989

- 6) Kojima T, Inoue M and Mitsuhashi S: *In vitro* activity of AT-4140 against clinical bacterial isolates. *Antimicrob Agents Chemother* 33: 1980~1988, 1989
- 7) Kojima T, Inoue M and Mitsuhashi S: *In vitro* activity of AT-4140 against quinolone- and methicillin-resistant *Staphylococcus aureus*. *Antimicrob Agents Chemother* 34: 1123~1127, 1990
- 8) Nakamura S, Kurobe N, Ohue T, Hashimoto M and Shimizu M: Pharmacokinetics of a novel quinolone, AT-4140, in animals.

Table 7. Susceptibility of clinically isolated *Neisseria gonorrhoeae* to quinolones

Case no.	Name	MIC ($\mu\text{g/ml}$) against :				
		sparfloxacin	enoxacin	norfloxacin	ofloxacin	ciprofloxacin
1	K.K.	0.39	1.56	3.13	1.56	0.78
2	S.H.	0.0063	0.1	0.1	0.025	0.025
3*	K.K.	0.0031	0.025	0.025	0.0125	0.0125
4	M.I.	0.0008	0.0125	0.025	0.0125	0.0125
5	Y.Y.	0.05	0.39	0.78	0.2	0.2
6	K.N.	0.0063	0.1	0.1	0.025	0.025
7	S.H.	0.0063	0.1	0.1	0.05	0.05
8	T.K.	0.0063	0.05	0.05	0.025	0.025
9	M.O.	0.0016	0.025	0.05	0.0125	0.0063
10	M.M.	0.0031	0.05	0.05	0.0125	0.0063
11	H.H.	0.0063	0.1	0.1	0.025	0.0125
12	K.O.	0.0031	0.05	0.05	0.025	0.0125
13*	Y.O.	0.0063	0.05	0.05	0.025	0.0125
14	K.S.	≤ 0.0016	0.05	0.05	0.0031	0.0031
15	M.W.	0.0031	0.025	0.025	0.0125	0.0125
17	I.M.	0.0031	0.025	0.025	0.0063	0.0063
18	A.U.	0.0125	0.05	0.025	0.05	0.0125
19*	N.A.	0.0125	0.1	0.1	0.05	0.025
20	N.O.	0.0063	0.1	0.1	0.1	0.025
21	S.O.	0.0063	0.05	0.025	0.025	0.0125
22	T.K.	0.0063	0.025	0.0125	0.0125	0.0125
23	T.A.	0.0063	0.1	0.05	0.05	0.0125
24	H.K.	0.0016	0.025	0.05	0.0125	0.0125
25	H.N.	0.0063	0.05	0.1	0.025	0.0125
26	M.S.	≤ 0.0016	0.05	0.05	0.0063	0.0063
MIC ₅₀		0.0063	0.05	0.05	0.025	0.0125
MIC ₉₀		0.0125	0.1	0.1	0.1	0.05

* PPNG (penicillinase producing *Neisseria gonorrhoeae*)

Antimicrob Agents Chemother 34 : 89~93, 1990

- 9) 小野寺昭一, 町田豊平, 岡崎武二郎: AM-715 の基礎的, 臨床的検討。Chemotherapy 29 (S-4): 445~451, 1981
- 10) 小野寺昭一, 町田豊平, 鈴木博雄, 岸本幸一, 清田 浩, 後藤博一: 尿路性器感染症に対する AT

-2266 の基礎的, 臨床的検討。Chemotherapy 32 (S-3): 680~688, 1984

- 11) 小野寺昭一, 岡崎武二郎: 淋菌感染症-治療学的検討-。Prog Med 6 : 1335~1341, 1986
- 12) 熊本悦明, 他: 男子非淋菌性クラミジア性尿道炎に対する ofloxacin および doxycycline の治療効果。日本性感染症学会誌 1 : 67~74, 1991

CLINICAL EFFICACY OF SPARFLOXACIN IN GENITOURINARY TRACT INFECTIONS

Shoichi Onodera, Hiroshi Kiyota, Hirokazu Goto,
Motoshi Kawahara, Hiroshi Igarashi and Toyohi Machida
Department of Urology, The Jikei University School of Medicine
3 - 25 - 8 Nishi-shinbashi, Minato-ku, Tokyo 105, Japan

Takejiro Okazaki
Department of Urology, Tokyo Metropolitan Taito Hospital

We assessed the clinical efficacy of sparfloxacin (SPFX) in genitourinary tract infections. A total of 91 patients consisted of 5 cases with acute uncomplicated cystitis (AUC), 4 with complicated urinary tract infections (CUTI), 2 with acute bacterial prostatitis (ABP), 20 with gonococcal urethritis (GU), 6 with *Chlamydia trachomatis*-positive gonococcal urethritis (Chlamydia positive GU), 22 with *Chlamydia trachomatis*-positive non-gonococcal urethritis (Chlamydia positive NGU), and 32 with *Chlamydia trachomatis*-negative non-gonococcal urethritis (Chlamydia negative NGU). All patients were treated with once daily SPFX. The daily dose was 50 mg for AUC, 200 mg for CUTI, 100 mg for ABP and 100-300 mg for urethritis with regimens of 3-14 days. The clinical efficacy of SPFX in the 58 patients was judged by the criteria proposed by the Japanese UTI Committee. The clinical efficacy was excellent (E) in 5 cases for AUC, E in one and moderate (M) in 2 for CUTI, E in 2 for ABP, E in 9 and M in 11 for GU, E in 4 and M in 2 for Chlamydia positive GU, E in 15 and M in 7 for Chlamydia positive NGU, the efficacy rate being 100% for each disease. The clinical efficacy judged by the doctor in charge for Chlamydia negative NGU was E in 24 and good in 8, the efficacy rate being 100%. Twenty-five strains of *Neisseria gonorrhoeae* isolated before treatment had the most potent MIC₉₀ values of 0.0125 μ g/ml with SPFX as compared to those of enoxacin, ofloxacin, norfloxacin and ciprofloxacin. Adverse reactions observed were not serious (Ex. diarrhea and rash).

These results suggest that SPFX is a useful drug for the treatment of genitourinary tract infections and is characterized by excellent efficacy for urethritis.