

産婦人科領域における sparfloxacin (SPFX) の基礎的、臨床的検討

山元貴雄・保田仁介・金尾昌明・岡田弘二

京都府立医科大学産婦人科学教室*

新しく開発されたピリドンカルボン酸系経口合成抗菌剤 sparfloxacin (SPFX) について産婦人科領域における感染症に対し基礎的、臨床的検討を行い、以下に示す成績を得た。

1. 基礎的検討として SPFX 200 mg 経口単回投与時の血清中濃度、性器組織内濃度を測定した。

末梢静脈血清中濃度は投与後 5 時間 2 分で 1.34 $\mu\text{g/ml}$ を示し、以後漸減したが、投与後 23 時間 55 分においても 0.35 $\mu\text{g/ml}$ の濃度を示した。

性器組織内濃度は投与後 5 時間 2 分で 1.26 から 1.47 $\mu\text{g/g}$ を示し、以後漸減し、23 時間 55 分で 0.24 から 0.43 $\mu\text{g/g}$ の濃度を示した。

2. 臨床例に対する検討では子宮内膜炎 8 例、卵管炎 2 例、バルトリン腺膿瘍およびバルトリン腺炎各 1 例の計 12 例の産婦人科領域感染症に本剤を投与した結果、有効 11 例、無効 1 例で有効率は 91.7% であった。

細菌学的効果は 9 株中 8 株消失、存続 1 株で消失率は 88.9% であった。

本剤投与による自覚的な副作用は全例に認められなかった。

Key words: Sparfloxacin, SPFX, 産婦人科領域感染症, 血清中濃度, 性器組織内濃度

Sparfloxacin (SPFX) は大日本製薬(株)で開発された新しいキノロン系経口抗菌剤であり、オキソキノリン骨格の 5 位にアミノ基、6 位と 8 位にフッ素、7 位に 3, 5-ジメチルピペラジニル基を有する^{1, 6)}。

本剤は *Streptococcus pneumoniae*, メチシリン耐性 *Staphylococcus aureus* を含むグラム陽性菌, *Pseudomonas aeruginosa*, *Serratia marcescens* を含むグラム陰性菌, ブドウ糖非発酵菌, 嫌気性菌, *Legionella*, *Mycoplasma*, *Chlamydia*, 結核菌, ならびに非定型抗酸菌などに広く抗菌作用を示す^{2-4, 6)}。

本剤は経口投与により腸管から速やかに吸収される。ヒトに本剤 200 mg を食後経口投与した際の薬物速度論的パラメーターは、 T_{max} , 5.17 h, C_{max} , 0.74 $\mu\text{g/ml}$, $T_{1/2}$ 15.38 h ならびに $AUC_{0-\infty}$ 17.78 $\text{h} \cdot \mu\text{g/ml}$ で、投与後 72 時間までに未変化体として投与量の約 10% が、グルクロン酸抱合体として約 26% が尿中に排泄される。また、連続投与による蓄積性は認められていない。以上のごとく本剤の特徴は抗菌スペクトラムの広さに加えて、血清中の濃度が長時間持続することであるとされている^{5, 6)}。

今回、われわれは産婦人科領域における本剤の臨床的有用性の検討を行う機会を得たのでその結果を報告す

る。

I. 血清中および各種組織移行性の検討

1. 方法

1) 血清中および性器組織内濃度

SPFX 投与後の血清中濃度および性器組織への移行性を検討する目的で、単純子宮全摘術施行症例に対し本剤を投与した。

投与方法は全例、本剤 200 mg の単回経口投与である。

術中、子宮動脈結紮時に子宮動脈血を採取すると同時に末梢静脈血も採取した。

検体採取時間は本剤投与後 4 時間 5 分から 23 時間 55 分までである。採取した血液は速やかに血清分離を行い濃度測定に供するまで -30°C にて凍結保存した。抽出した卵管、卵巣、子宮内膜、子宮体部筋層、子宮頸部および子宮腔部の各組織は採取後生理食塩水で洗浄し、血清と同様凍結保存した。

2) 濃度測定方法

血清中、性器組織内の SPFX の濃度は大日本製薬(株)総合研究所において *Escherichia coli* Kp 株を検定菌とする bioassay 法により行った。なお、測定限界値は

*〒602 京都市上京区河原町通広小路上ル梶井町 465

Table 1. Serum and tissue concentration of sparfloxacin after oral administration (200 mg)

| Case no. | Time | Serum ($\mu\text{g/ml}$) | | Tissue ($\mu\text{g/g}$) | | | | | |
|----------|-----------|----------------------------|----------------|----------------------------|-------|-------------|------------|--------------|------------------|
| | | peripheral vein | uterine artery | oviduct | ovary | endometrium | myometrium | cervix uteri | portio vaginalis |
| 1 | 4h 5min | 1.10 | 1.18 | 0.93 | 0.92 | 0.86 | 0.83 | 0.86 | 0.70 |
| 2 | 4h 38min | 1.17 | 1.25 | 1.28 | 1.22 | 1.39 | 1.24 | 1.40 | 1.24 |
| 3 | 5h 2min | 1.34 | 1.46 | | | 1.47 | 1.32 | 1.26 | 1.27 |
| 4 | 5h 3min | 0.60 | 0.69 | | | 0.46 | 0.43 | 0.36 | 0.51 |
| 5 | 5h 34min | 0.88 | 0.89 | | | 1.20 | 0.93 | 1.06 | 0.84 |
| 6 | 5h 35min | 0.95 | 1.07 | | | 0.98 | 0.90 | 0.86 | 0.99 |
| 7 | 6h 14min | 0.65 | 0.78 | 0.55 | 0.76 | 0.58 | 0.55 | 0.47 | 0.60 |
| 8 | 6h 32min | 0.66 | 0.81 | | | 0.79 | 0.75 | 0.86 | 0.96 |
| 9 | 7h 8min | 0.84 | 0.88 | 0.79 | 0.72 | 0.93 | 0.63 | 0.48 | 0.67 |
| 10 | 7h 10min | 1.08 | 1.06 | 0.82 | 0.94 | 1.30 | 1.27 | 1.10 | 1.08 |
| 11 | 7h 50min | 1.10 | 1.03 | | | 1.18 | 0.89 | 0.92 | 0.74 |
| 12 | 17h 10min | 0.38 | 0.37 | | | 0.37 | 0.35 | 0.37 | 0.32 |
| 13 | 17h 16min | 0.62 | 0.60 | 0.64 | 0.78 | 0.59 | 0.59 | 0.62 | 0.62 |
| 14 | 19h | 0.54 | 0.59 | | | 0.53 | 0.52 | 0.60 | 0.51 |
| 15 | 19h 2min | 0.34 | 0.46 | 0.34 | 0.48 | 0.35 | 0.32 | 0.31 | 0.35 |
| 16 | 23h 30min | 0.61 | 0.64 | 0.43 | 1.57 | 0.51 | 0.51 | 0.64 | 0.61 |
| 17 | 23h 45min | 0.45 | 0.46 | | | 0.42 | 0.35 | 0.48 | 0.43 |
| 18 | 23h 55min | 0.35 | 0.37 | | | 0.43 | 0.33 | 0.24 | 0.26 |

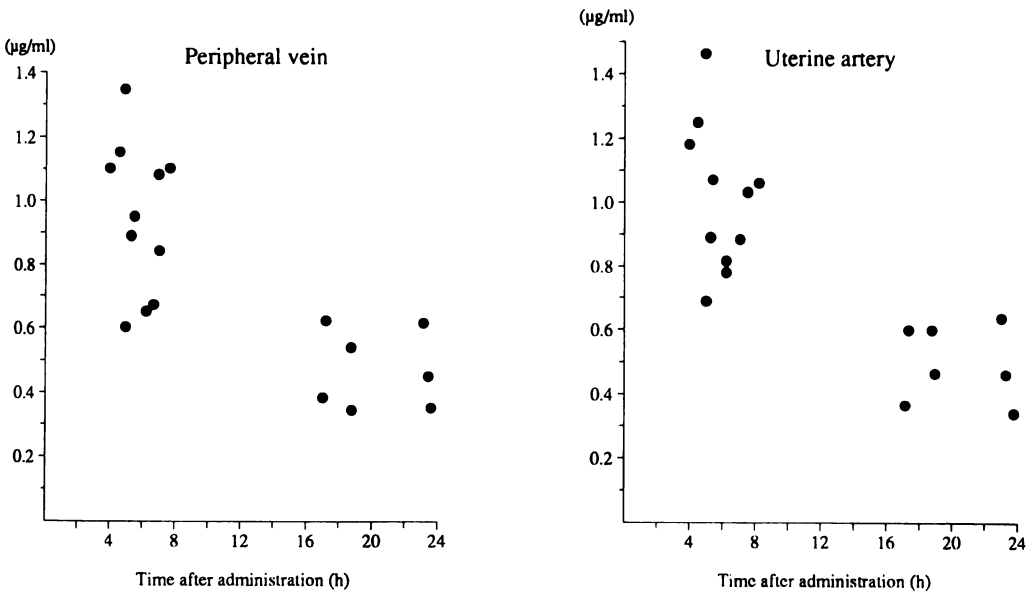


Fig. 1. Serum concentration of sparfloxacin after oral administration (200 mg)

0.01 $\mu\text{g/ml}$ or g である。

2. 結果

SPFX 200 mg 単回投与時における本剤の血清中ならびに性器組織内濃度の測定値をTable 1, Fig 1, 2 に示した。

末梢静脈血清中の SPFX 濃度は投与後 4 時間 5 分

1.10 $\mu\text{g/ml}$ 、4 時間 38 分で 1.17 $\mu\text{g/ml}$ 、5 時間 2 分で最高値の 1.34 $\mu\text{g/ml}$ を示し、以後漸減したが、23 時間 55 分でも、なお 0.35 $\mu\text{g/ml}$ の濃度を示した。一方、子宮動脈血清中濃度は投与後 4 時間 5 分で 1.18 $\mu\text{g/ml}$ 、4 時間 38 分で 1.25 $\mu\text{g/ml}$ 、5 時間 2 分で最高値の 1.46 $\mu\text{g/ml}$ を示し、以後漸減したが、23 時間

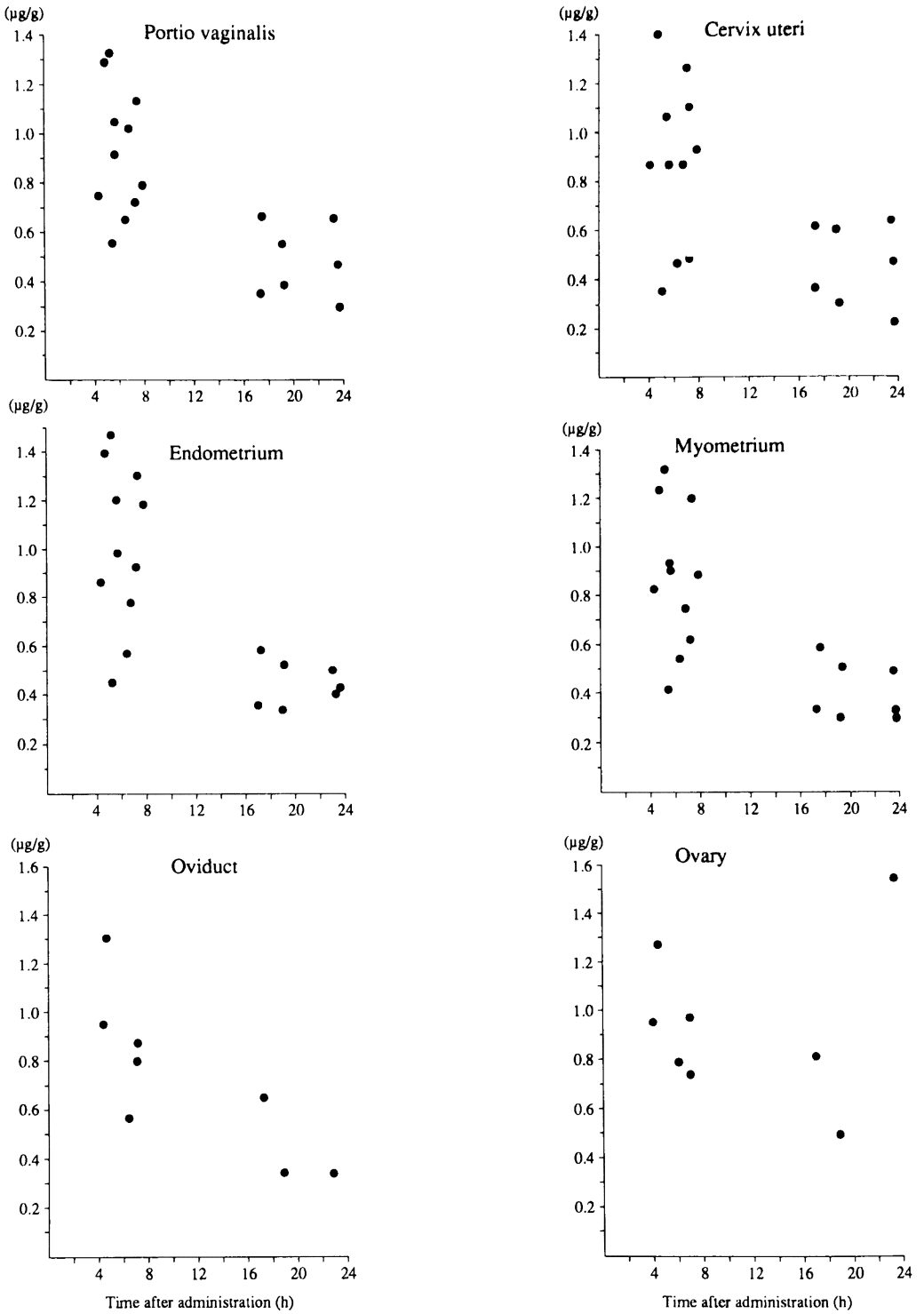


Fig. 2. Tissue concentration of sparfloxacin after oral administration (200 mg)

Table 2. Clinical effects of sparfloxacin

| Case no. | Age (yrs) | Diagnosis | Isolated organisms | Daily dose (mg×times) | Duration (days) | Total dose (g) | Bacteriological effect | Clinical effect | Side effect |
|----------|-----------|---------------------|--|-----------------------|-----------------|----------------|------------------------|-----------------|-------------|
| 1 | 16 | endometritis | CNS | 100×2 | 7 | 1.4 | eradicated | good | — |
| 2 | 27 | endometritis | <i>B. adolescentis</i> | 100×2 | 7 | 1.4 | eradicated | good | — |
| 3 | 41 | endometritis | <i>E. coli</i> | 100×2 | 8 | 1.6 | eradicated | good | — |
| 4 | 17 | endometritis | <i>E. coli</i> | 100×2 | 8 | 1.6 | replaced | good | — |
| 5 | 26 | endometritis | <i>S. morbillorum</i> <i>C. perfringens</i> | 100×2 | 7 | 1.4 | unknown | good | — |
| 6 | 40 | endometritis | <i>P. putida</i> | 100×2 | 7 | 1.4 | unknown | good | — |
| 7 | 21 | endometritis | <i>E. coli</i> <i>E. faecalis</i> | 100×2 | 7 | 1.4 | unknown | good | — |
| 8 | 23 | endometritis | <i>E. coli</i> <i>E. faecalis</i> | 100×2 | 3 | 0.6 | decreased | poor | — |
| 9 | 23 | salpingitis | — | 100×2 | 7 | 1.4 | unknown | good | — |
| 10 | 36 | salpingitis | — | 100×2 | 7 | 1.4 | unknown | good | — |
| 11 | 42 | Bartholin's abscess | <i>P. indolicus</i> <i>E. corrodens</i> | 100×2 | 7 | 1.4 | eradicated | good | — |
| 12 | 47 | bartholinitis | <i>V. parvula</i> | 100×2 | 7 | 1.4 | eradicated | good | — |

CNS : coagulase-negative staphylococci

55分でも、なお0.37 μg/mlの濃度を示した。子宮動脈血清中濃度は末梢静脈血清中濃度と極めて類似した濃度推移を示した。

性器組織内濃度は各組織とも4時間38分から5時間2分で最高値が認められ、その濃度は1.27から1.47 μg/gであった。以後漸減するも、投与後23時間55分でも0.24から0.43 μg/gの濃度を示した。

II. 臨床例に対する検討

1. 投与対象

平成元年2月から12月までの間に京都府立医科大学附属病院産婦人科を受診した患者のうち、種々の感染症を有する12例を対象とした。感染症の内訳は、子宮内膜炎8例、卵管炎2例、バルトリン腺膿瘍およびバルトリン腺炎各1例である。

2. 投与方法

SPFXの投与量は全例1日200 mgで、これを1日2回に分けて3～8日間投与した。1症例あたりの総投与量は0.6 g 1例、1.4 g 9例、1.6 g 2例であった。なお、本剤投与期間中に他の抗菌性薬剤の投与は行っていない。

3. 効果判定基準

著効：主要自他覚症状が3日以内に著しく改善し、治癒に至った場合

有効：主要自他覚症状が3日以内に改善傾向を示し、その後治癒に至った場合

無効：主要自他覚症状が3日を経過しても改善されない場合

なお、手術、切開等の外科的処置を併用した場合は著効とはせず、すべて有効と判定した。

4. 臨床成績

Table 2に本剤投与症例の年齢、診断名、分離菌、1日投与量、投与期間、総投与量、細菌学的効果、臨床効果ならびに副作用の有無を示し、Table 3に各症例を疾患群別に分類し、それぞれの有効率を示した。

Table 2, 3に示すごとく、産婦人科感染症12例に本剤の投与を行ったところ、子宮内膜炎8例では1例を除き全例有効であった。また、卵管炎2例、バルトリン腺膿瘍およびバルトリン腺炎の各1例はいずれも有効であった。すなわち、産婦人科感染症に対する本剤の有効率は91.7%と満足すべき成績を示した。

5. 分離菌別臨床効果

本剤の分離菌別臨床効果をTable 4に示した。

単独菌感染は6例で*E. coli* 2例ならびにcoagulase-

Table 3. Summary of clinical effects

| Type of infection | Diagnosis | No. of cases | Excellent | Good | Poor | Efficacy rate (%) |
|----------------------------|---------------------|--------------|-----------|------|------|-------------------|
| Intrauterine infection | endometritis | 8 | | 7 | 1 | 7/8 |
| Adnexitis | salpingitis | 2 | | 2 | | 2/2 |
| External genital infection | Bartholin's abscess | 1 | | 1 | | 1/1 |
| | bartholinitis | 1 | | 1 | | 1/1 |
| Total | | 12 | | 11 | 1 | 11/12 (91.7) |

Table 4. Clinical effects of sparfloxacin classified by causative isolates

| Isolates | | No. of cases | Clinical effect | | | Efficacy rate (%) |
|-------------------------|--|--------------|-----------------|------|------|-------------------|
| | | | excellent | good | poor | |
| Monomicrobial infection | CNS | 1 | | 1 | | |
| | <i>E. coli</i> | 2 | | 2 | | |
| | <i>P. putida</i> | 1 | | 1 | | |
| | <i>B. adolescentis</i> | 1 | | 1 | | |
| | <i>V. parvula</i> | 1 | | 1 | | |
| | sub-total | 6 | | 6 | | 6/6 |
| Polymicrobial infection | <i>E. coli</i> | 2 | | 1 | 1 | |
| | <i>E. faecalis</i> | | | | | |
| | <i>S. morbillorum</i> | 1 | | 1 | | |
| | <i>C. perfringens</i> | | | | | |
| | <i>P. indolicus</i> <i>E. corrodens</i> | 1 | | 1 | | |
| sub-total | 4 | | 3 | 1 | 3/4 | |
| Unknown | | 2 | | 2 | | 2/2 |
| Total | | 12 | | 11 | 1 | 11/12(91.7) |

negative staphylococci, *Pseudomonas putida*, *Veillonella parvula*, *Bifidobacterium adolescentis* 各1例であり、いずれも有効であった。

複数菌感染は4例であり、うち2例は好気性グラム陽性菌と好気性グラム陰性菌との複数菌感染であり、他の2例は嫌気性菌どうしによるものであった。臨床効果は、*E. coli* と *Enterococcus faecalis* の複数菌感染2例中1例を除き全例有効であり、有効率は75%であった。

起炎菌不明例は培養陰性の2例であり、これらに対しても全例有効であった。

6. 細菌学的効果

Table 5 に本剤の細菌学的効果を示した。培養陰性

例2例を除く10例から10菌種14株が分離可能であった。分離菌の内訳は好気性菌ではグラム陽性菌が2菌種3株、グラム陰性菌が2菌種5株、嫌気性菌は6菌種6株であった。

本剤の細菌学的効果は14株中、消失8株、存続1株、不明5株で88.9%の効果を示した。なお、1例において *E. coli* から *E. faecalis* への菌交代が見られた。

7. 副作用ならびに臨床検査値異常

副作用については特に留意して観察を行い、また本剤投与前後に血液一般、腎機能および肝機能検査を実施し、臨床検査値異常の発現の有無を併せて検討した。

Table 6 に本剤投与前後の臨床検査値の変動を示し

Table 5. Bacteriological response to sparfloxacin

| Isolates | | No. of strains | Eradicated | Persisted | Unknown | Eradication rate(%) |
|------------------------|------------------------|----------------|------------|-----------|---------|---------------------|
| Gram-positive bacteria | CNS | 1 | 1 | | | |
| | <i>E. faecalis</i> | 2 | | 1 | 1 | |
| | sub-total | 3 | 1 | 1 | 1 | 1/2 |
| Gram-negative bacteria | <i>E. coli</i> | 4 | 3 | | 1 | |
| | <i>P. putida</i> | 1 | | | 1 | |
| | sub-total | 5 | 3 | | 2 | 3/3 |
| Anaerobes | <i>B. adolescentis</i> | 1 | 1 | | | |
| | <i>S. morbillorum</i> | 1 | | | 1 | |
| | <i>C. perfringens</i> | 1 | | | 1 | |
| | <i>P. indolicus</i> | 1 | 1 | | | |
| | <i>E. corrodens</i> | 1 | 1 | | | |
| | <i>V. parvula</i> | 1 | 1 | | | |
| | sub-total | 6 | 4 | | 2 | 4/4 |
| Total | | 14 | 8 | 1 | 5 | 8/9 |

Table 6. Laboratory findings before and after treatment with sparfloxacin

| Case no. | RBC (10 ⁴ /mm ³) | | WBC (/mm ³) | | Platelet (10 ⁴ /mm ³) | | Hb (g/dl) | | Ht (%) | | S-GOT (KU) | | S-GPT (KU) | | Al-P (KAU) | | BUN (mg/dl) | | Creatinine (mg/dl) | |
|----------|---|-----|-------------------------|-------|--|------|-----------|------|--------|------|------------|----|------------|----|------------|-----|-------------|----|--------------------|-----|
| | B | A | B | A | B | A | B | A | B | A | B | A | B | A | B | A | B | A | B | A |
| 1 | 441 | 428 | 9100 | 6300 | 40.1 | 38.1 | 13.3 | 13.1 | 40.0 | 39.0 | — | 14 | — | 9 | — | 7.1 | — | 14 | — | 0.7 |
| 2 | 430 | 448 | 8000 | 6400 | 25.4 | 23.5 | 12.8 | 13.4 | 38.9 | 40.0 | — | 15 | — | 9 | — | 7.1 | — | 18 | — | 0.9 |
| 3 | 453 | 421 | 8300 | 4900 | 25.2 | 32.9 | 13.8 | 13.0 | 42.0 | 40.5 | — | 16 | — | 8 | — | 4.9 | — | 11 | — | 0.6 |
| 4 | 391 | 379 | 17500 | 6300 | 25.1 | 33.3 | 11.7 | 11.0 | 34.9 | 34.0 | 12 | 11 | 6 | 8 | 5.2 | 4.9 | 13 | 10 | 0.9 | 0.8 |
| 5 | 471 | 466 | 8300 | 5600 | 40.5 | 38.1 | 14.1 | 13.9 | 42.5 | 40.5 | — | 18 | — | 11 | — | 8.1 | — | 18 | — | 0.9 |
| 6 | 432 | 441 | 8800 | 6600 | 30.2 | 37.1 | 12.6 | 12.8 | 38.2 | 40.1 | — | 21 | — | 16 | — | 6.4 | — | 21 | — | 0.6 |
| 7 | 428 | 441 | 8000 | 7600 | 38.1 | 40.5 | 12.8 | 12.9 | 38.1 | 38.0 | — | 18 | — | 10 | — | 7.1 | — | — | — | — |
| 8 | 405 | 416 | 7500 | 10900 | 24.1 | 29.9 | 11.9 | 12.1 | 35.2 | 36.0 | — | 21 | — | 10 | — | 6.2 | — | 18 | — | 0.5 |
| 9 | 436 | 404 | 9700 | 7700 | 37.0 | 28.0 | 13.2 | 12.3 | 39.0 | 35.9 | — | 16 | — | 11 | — | 5.1 | — | 18 | — | 0.9 |
| 10 | 435 | 433 | 8400 | 6500 | 30.2 | — | 12.7 | 12.0 | 39.1 | 37.0 | 21 | 16 | 10 | 9 | 8.0 | 7.1 | 16 | 18 | 0.9 | 1.0 |
| 11 | 423 | 431 | 8400 | 5200 | 33.9 | 40.1 | 12.9 | 13.0 | 39.4 | 40.0 | — | 16 | — | 5 | — | 4.8 | — | 16 | — | 0.7 |
| 12 | 444 | 430 | 6600 | 5300 | 24.5 | 28.9 | 12.9 | 12.5 | 38.1 | 36.8 | — | 10 | — | 9 | — | 7.1 | — | 14 | — | 0.7 |

B: before A: after

た。本剤投与を行った全例に自他覚的な副作用ならびに臨床検査値異常の発現は認められなかった。

Ⅲ. 考 察

産婦人科領域における細菌感染症で分離される菌とし

ては、グラム陽性菌では *E. faecalis* が最も多く、ついで *Streptococcus*, *Staphylococcus* が、グラム陰性菌では *E. coli* が最も多く、ついで *Enterobacter*, *Klebsiella*, *Pseudomonas*, *Serratia* で、嫌気性菌では *Bacteroides fragilis*, *Peptostreptococcus* 等である¹⁾。これらの感

染症に対して、ペニシリン、セフェム系の β -lactam系抗生剤が多く使用されてきたが、これら薬剤の使用頻度の増加に伴い耐性菌由来の感染症が増加してきたことも事実である^{8, 9)}。これら耐性菌に有効な多くの抗菌剤の開発、改良がなされ、中でもピリドンカルボン酸系薬剤の進歩には著しいものがある。1980年代以降 norfloxacin (NFLX), ofloxacin (OFLX), enoxacin (ENX), ciprofloxacin (CPFX), lomefloxacin (LFLX), tosufloxacin (TFLX) 等のニューキノロンと称される一連の抗菌剤が登場した¹⁰⁾。

今回検討を行った SPFX はニューキノロン剤の一つであり、その基礎的、臨床的検討成績は第38回日本化学療法学会西日本支部総会新薬シンポジウム⁹⁾において発表された。

この中で、臨床分離菌に対する本剤の MIC₉₀ 値は MRSA で 3.13 μ g/ml, *S. aureus* で 0.1 μ g/ml と優れた抗菌力を示す。また、セファロsporinナーゼ2産生 *E. coli* に対する MIC₉₀ 値は 0.78 μ g/ml, アミノグリコシド耐性 *P. aeruginosa* に対しては 0.39 μ g/ml と強い抗菌力を示す。また、*E. coli*, *K. pneumoniae*, *Proteus mirabilis* などのグラム陰性菌に対する MIC₉₀ はそれぞれ 0.05, 0.1, 0.39 μ g/ml と CPFX と同等ないし優れた抗菌力を示す。

今回、われわれは臨床的有用性に加え生殖器組織内濃度を検討したが、本剤 200 mg 1回投与における各組織内濃度は、投与後約5時間でピーク値 1.26~1.47 μ g/g を示し、その後漸減するも約24時間後においても 0.24~0.43 μ g/g の組織内濃度を示し、良好な移行性とともに持続性を示した。この組織内濃度は産婦人科領域感染症の主なる起炎菌である *E. coli*, *K. pneumoniae*, *P. mirabilis* の MIC₉₀ をほぼ24時間カバーしうる可能性を示唆する成績であった。

臨床例に対する検討では子宮内膜炎8例、卵管炎2例、バルトリン腺腫瘍、バルトリン腺炎各1例の計12例の感染症に本剤の投与を行った結果、有効11例、無効1例で有効率は91.7%と優れた成績であった。

分離菌別臨床効果では単独菌感染例6例全例有効、複数菌感染例4例中 *E. coli* と *E. faecalis* の複数菌感染例1例を除き有効であった。一方、細菌学的効果では *E. faecalis* の1株を除き全株消失し菌陰性化率は88.9%であった。

最後に副作用であるが、本剤投与に起因する自覚的な副作用、また臨床検査値異常の発現は全例に認められなかった。

以上の基礎的、臨床的検討から sparfloxacin は産婦

人科領域における感染症に対し有用な薬剤であると思われる。

文 献

- 1) Miyamoto T, et al. : Synthesis and structure-activity relationships of 5-substituted 6, 8-difluoroquinolones, including sparfloxacin, a new quinolone antibacterial agent with improved potency. *J Med Chem* 33 : 1645~1656, 1990
- 2) Nakamura S, Minami A, Nakata K, Kurobe N, Kono K, Fujimoto K, Nakamura M, Hashimoto M and Shimizu M : *In vitro* and *in vivo* antibacterial activities of AT-4140, a new broad-spectrum quinolone. *Antimicrob Agents Chemother* 33 : 1167~1173, 1989
- 3) Kojima T, Inoue M and Mitsunashi S : *In vitro* activity of AT-4140 against clinical bacterial isolates. *Antimicrob Agents Chemother* 33 : 1980~1988, 1989
- 4) Kojima T, Inoue M and Mitsunashi S : *In vitro* activity of AT-4140 against quinolone- and methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* : *Antimicrob Agents Chemother* 34 : 1123~1127, 1990
- 5) Kanamaru M, Nakashima M, Uematsu T and Takikuchi Y : Pharmacokinetics and safety of a new quinolone, AT-4140 in healthy volunteers. 28th Intersci Conf Antimicrob Agents Chemother, Los Angeles, Oct. 23~26, 1988
- 6) 第38回日本化学療法学会西日本支部総会。新薬シンポジウム, Sparfloxacin (AT-4140), 岐阜, 1990
- 7) 岡田弘二, 山元貴雄 : 産婦人科領域感染症。日本医師会雑誌 102 : NS 53~NS56, 1989
- 8) 岡田弘二, 山元貴雄 : 感染症の変貌と化学療法。化学療法の領域 1 : 51~55, 1985
- 9) 岡田弘二 : 産婦人科領域感染症, 難治感染症とその対策。p.99, メディカルジャーナル社, 東京, 1987
- 10) 岡田弘二, 山元貴雄 : ニューキノロンと感染症, 産婦人科領域。診断と治療 74 : 1381~1385, 1986

BASIC AND CLINICAL STUDIES ON SPARFLOXACIN (SPFX) IN OBSTETRICS AND GYNECOLOGY

Takao Yamamoto, Jinsuke Yasuda, Masaaki Kanao and Hiroji Okada
Department of Obstetrics and Gynecology
Kyoto Prefectural University of Medicine
Kawaramachi-Hirokoji, Kamigyo-ku, Kyoto 602, Japan

We carried out basic and clinical studies on sparfloxacin, a newly synthesized quinolone, and obtained the following results.

1) Concentrations of sparfloxacin were examined in serum and internal genital organs after an oral administration of 200 mg. The peripheral serum peak level was $1.34 \mu\text{g/ml}$ at 5 h 2 min and decreased to $0.35 \mu\text{g/ml}$ at 23h 55min after administration. Peak concentrations in tissue were $1.26-1.47 \mu\text{g/g}$ at 5 h 2 min and decreased to $0.24-0.43 \mu\text{g/g}$ at 23h 55min after administration.

2) In a clinical study, sparfloxacin was administered orally at a daily dose of 200 mg (twice a day) for 3 - 8 days to 12 patients with infections in the obstetrics and gynecology, such as endometritis (8 cases), salpingitis (2 cases), abscess (1 case) and acute infection (1 case) of Bartholin's gland.

- (1) The clinical results showed as good in 11 cases and poor in 1 case in efficacy. The efficacy rate was 91.7%
- (2) Bacteriologically, 14 organisms were isolated in 10 cases and the eradication rate was 88.9% (eradicated 8, persisted 1 and unknown 5 in cases).
- (3) No side effects and abnormal laboratory findings were observed in any of the cases treated with sparfloxacin.