

## Sparfloxacinの皮膚内移行の検討

山本康生・松本 茂・池田政身・小玉 肇  
高知医科大学皮膚科学教室\*

ヒト正常皮膚における sparfloxacin の血清内濃度に対する皮膚内濃度比（皮膚内移行）は 0.7 以上（ $n=5$ ）であった。

ラット正常皮膚での皮膚内移行は 0.5, 1, 2, 4, 6 時間後全て 1.0 以上（ $n=4$ ）であった。

**Key words** : Sparfloxacin, 皮膚内移行

Sparfloxacin (SPFX) は大日本製薬(株)にて新たに開発されたニューキノロン系合成抗菌剤であり、グラム陽性菌をはじめ、グラム陰性菌、嫌気性菌などに対し幅広い抗菌スペクトルを有し、とくに既存のニューキノロン剤では作用の弱かった肺炎球菌、マイコプラズマ、クラミジア、結核菌、非定型抗酸菌などに対しても強い抗菌作用を持つ<sup>1)</sup>。

今回、われわれはヒト正常皮膚およびラット正常皮膚への本剤の移行を検討したので報告する。

ヒトでは手術的で当科に入院した患者 5 例に術前に SPFX 200 mg を単回経口投与し、術中に採血、採皮した。なお、試験前に患者の同意を得た。

ラットでは、200 g 前後のウィスター系雄ラットの胃内に、SPFX 20 mg/kg を金属カテーテルにて投与し、0.5, 1, 2, 4, 6 時間後に各時間 4 匹を 1 群としてエーテル麻酔下に採血屠殺、背部を剃毛した後背皮を採取した。可及的すみやかに、血液は遠心後血清採取し、皮膚は脂肪組織を除去した後、 $-70^{\circ}\text{C}$  で凍結保存し、一括して大日本製薬(株)総合研究所にて *Escherichia coli* Kp 株を検定菌とした agar well dilution method による bioassay 法により血清内、皮膚内濃度を測定した。

結果は、Table 1, 2 に示す。ヒトでは測定時間が 1.5 時間から 3.3 時間にわたっており、血清内濃度に対する皮膚内濃度比（皮膚内移行）は 0.5 から 2.03 と幅はあるが、0.7 以上の良好な群<sup>2)</sup>に位置する。ラットに

おいても、皮膚内移行は 1.0 以上と良好であり、他のニューキノロン剤と同様である<sup>1)-6)</sup>。この皮膚内移行の良好な点、血中半減期が約 16 時間と長い点<sup>1)</sup>、黄色ブドウ球菌に対する MIC ( $10^6$  cells/ml) のピークが  $0.05 \mu\text{g/ml}$  にあり、MIC<sub>90</sub> が  $0.2 \mu\text{g/ml}$  である点<sup>1)</sup> より、黄色ブドウ球菌が主体をなす皮膚軟部組織感染症に対しては本剤 1 回 200 mg 1 日 1 回ないしは 1 回 100 mg 1 日 2 回投与で治療目的は達せられると考える。

## 文 献

- 1) 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 (2), Sparfloxacin (AT-4140), 岐阜, 1990
- 2) 山本康生, 玉木宏幸, 荒田次郎: 抗生物質と皮膚薬動力学。日皮会誌 96: 1456~1458, 1986
- 3) 山本康生, 池田政身, 荒田次郎: 皮膚科領域における DL-8280 の基礎的・臨床的検討。Chemotherapy 32 (S-1): 997~1000, 1984
- 4) 山本康生, 池田政身, 荒田次郎: 皮膚科領域における BAYo9867 (シプロフロキサシン) の基礎的・臨床的検討。Chemotherapy 33 (S-7): 966~969, 1985
- 5) 山本康生, 玉木宏幸, 池田政身, 荒田次郎: 皮膚科領域における NY-198 の基礎的・臨床的検討。Chemotherapy 36 (S-2) 1266~1269, 1988

Table 1. Concentration of sparfloxacin in human serum and skin after a single oral administration of 200 mg

No.	Sex	Age	Body weight (kg)	Time (h)	Concentration		
					skin ( $\mu\text{g/g}$ )	serum ( $\mu\text{g/ml}$ )	skin/serum
1	M	74	55.0	1.5	0.74	1.09	0.68
2	M	80	59.8	2	0.10	0.20	0.50
3	M	53	64.8	2.5	0.33	0.38	0.87
4	F	57	38.0	2.7	1.01	1.20	0.84
5	F	48	53.2	3.3	0.79	0.39	2.03

Table 2. Concentration of sparfloxacin in rat serum and skin after a single oral administration of 20 mg/kg

No.	Specimens	Time (h)				
		0.5	1	2	4	6
1	skin ( $\mu\text{g/g}$ )	0.35	1.58	1.74	1.29	1.17
	serum ( $\mu\text{g/ml}$ )	0.25	1.14	1.33	0.84	1.09
	skin/serum	1.40	1.39	1.31	1.54	1.07
2	skin ( $\mu\text{g/g}$ )	0.69	1.84	1.77	1.42	1.06
	serum ( $\mu\text{g/ml}$ )	0.46	1.49	1.75	1.02	1.02
	skin/serum	1.50	1.23	1.01	1.39	1.04
3	skin ( $\mu\text{g/g}$ )	0.41	0.79	1.54	1.83	0.81
	serum ( $\mu\text{g/ml}$ )	0.33	0.52	1.33	1.33	0.79
	skin/serum	1.24	1.52	1.16	1.38	1.03
4	skin ( $\mu\text{g/g}$ )	0.27	1.22	0.64	1.20	0.65
	serum ( $\mu\text{g/ml}$ )	0.28	1.36	0.55	0.85	0.54
	skin/serum	0.96	0.90	1.16	1.41	1.20

## PENETRATION OF SPARFLOXACIN INTO THE SKIN

Yasuo Yamamoto, Shigeru Matsumoto, Masami Ikeda and Hajime Kodama  
 Department of Dermatology, Kochi Medical School  
 Kohasu, Okoh-cho, Nankoku-city, Kochi 783, Japan

The human skin/serum concentration ratio of sparfloxacin (SPFX) after 200 mg oral administration was higher than 0.7 (n=5).

The ratio of SPFX (20 mg/kg) in rats was higher than 1.0 at 0.5, 1, 2, 4 and 6 hours after administration (n=4).