

Temafloracinの基礎的および臨床的検討

大石 明・坂内通宏・石井昌俊・仲村秀俊
 青崎 登・吉松 博・奥井津二・勝 正孝
 国立霞ヶ浦病院内科*

Temafloracin (TMFX)の基礎的および臨床的検討を行い以下の知見を得た。

基礎的検討での本剤の抗菌力はグラム陽性菌(*Staphylococcus aureus*, MRSA, *Staphylococcus epidermidis*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus pneumoniae*, *Enterococcus faecalis*, *Enterococcus faecium*)およびグラム陰性菌(*Escherichia coli*, *Citrobacter freundii*, *Enterobacter cloacae*, *Klebsiella pneumoniae*, *Morganella morganii*, *Providencia rettgeri*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Pseudomonas aeruginosa*, gentamicin耐性*P. aeruginosa*, *Pseudomonas cepacia*, *Acinetobacter calcoaceticus* var *anitratus*, *Moraxella catarrhalis*, *Haemophilus influenzae*, ampicillin耐性*H. influenzae*, *Serratia marcescens*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Bacteroides fragilis*)についてのMICを他のニューキノロン系抗菌剤(ciprofloxacin, ofloxacin, tosufloxacin, lomefloxacin, fleroxacin, sparfloxacin)およびceftoram pivoxil, clavulanic acid/amoxicillin, minocyclineと比較検討した。グラム陽性菌と嫌気性菌に対してのみでなく、グラム陰性菌に対しても対照薬と同等またはそれ以上の抗菌力を示した。

臨床的検討では呼吸器感染症21例, 尿路感染症4例に本剤を1日600mg分2で1~14日間投与し, 著効12例, 有効12例, 無効1例(有効率は96%)であった。副作用は嘔吐を1例, 蕁麻疹を1例に認めた。明らかな臨床検査値の異常は認めず, 本剤は有用であり, かつ安全な抗菌剤であることが確認された。

Key words : temafloracin, ニューキノロン, MIC, 臨床試験

Temafloracin (TMFX)は米国アボット社で開発されたニューキノロンカルボン酸系合成抗菌薬である¹⁾。

TMFXは広い抗菌スペクトラムを有し, 特にグラム陽性菌および嫌気性菌に対し強い抗菌力を持つこと, 吸収が良好で組織への移行性もよく, 持続性があること, 中枢神経作用は非常に弱いことなどの特徴が認められている。

今回, 我々は本剤の基礎的および臨床的検討を行い, 若干の知見を得たので報告する。

I. 抗菌力

1. 測定菌株および測定方法

Staphylococcus aureus (20株), メチシリン耐性*S. aureus* (20株), *Staphylococcus epidermidis* (20株), *Streptococcus pyogenes* (20株), *Streptococcus pneumoniae* (20株), *Enterococcus faecalis* (20株), *Enterococcus faecium* (20株), *Escherichia coli* (20株), *Citrobacter freundii* (20株), *Enterobacter cloacae* (20株), *Klebsiella pneumoniae* (20株), *Morganella morganii* (20株), *Providencia rettgeri* (20株), *Proteus mirabilis* (20株),

Proteus vulgaris (20株), *Pseudomonas aeruginosa* (20株), gentamicin-resistant *P. aeruginosa* (20株), *Pseudomonas cepacia* (20株), *Acinetobacter calcoaceticus* var *anitratus* (20株), *Moraxella catarrhalis* (20株), *Haemophilus influenzae* (20株), ampicillin (ABPC) resistant *H. influenzae* (8株), *Serratia marcescens* (20株), *Neisseria gonorrhoeae* (20株), *Bacteroides fragilis* (20株)は当院における臨床分離保存株を用い, 栄研化学株式会社戸田研究所感受性検査部にて, TMFXおよび対照薬ciprofloxacin (CPFX), ofloxacin (OFLX), tosufloxacin (TFLX), lomefloxacin (LFLX), fleroxacin (FLRX), sparfloxacin (SPFX), ceftoram pivoxil (CFTM-PI), clavulanic acid/amoxicillin (CVA/AMPC), minocycline (MINO)について, 接種菌量 10^6 にて日本化学療法学会標準法に従って感受性測定を行った。

II. 臨床的検討

1. 対象

平成2年8月から平成3年3月までに当院内科を受診し, 同意の得られた呼吸器感染症21例および尿路感

*〒300 土浦市下高津2-7-14

染症4例を対象とした。症例の内訳は急性気管支炎10例(内1例は急性咽喉炎を合併)、急性咽喉炎10例、急性扁桃炎1例、急性腎盂腎炎4例で、外来24例および入院1例であり、軽症21例で中等症は4例であった。性別は男性11例、女性14例で、年齢は17~75歳(平均39.6歳)であり、65歳以上は4例であった。

2. 方法

本剤を1日600mg分2で朝、夕食後に経口投与した。投与期間は4~14日間とした。

3. 効果判定基準

臨床症状、喀痰性状、喀痰量、起炎菌の推移、胸部レ線、検査値の推移を総合的に判断し、著効、有効、やや有効、無効の4段階にて判定した。

副作用については、中枢神経症状、アレルギー症状、消化器症状などに留意するとともに、一般血液(赤血球、ヘモグロビン、ヘマトクリット値、白血球数、血小板数など)、肝機能(GOT、GPT、ALPなど)、腎機能(BUN、クレアチニンなど)、尿検査などの諸検査を本剤投与前、投与後に実施し、異常値が認められた場合は可能な限り追跡し、その推移を検討した。

Ⅲ. 結 果

1. 抗菌力

グラム陽性菌、グラム陰性菌に対するMIC range, MIC₅₀およびMIC₉₀を対照薬とともにTable 1-1, 1-2,

2-1~2-4に示した。グラム陽性菌についてはTable 1-1, 1-2に示した如く、*S. aureus*ではTFLX, SPFXに次いで本剤はMINOとともにMIC₉₀が0.20μg/mlと優れていた。メチシリン耐性*S. aureus* (MRSA)では本剤の場合SPFX, TFLXに次いで優れておりMIC₉₀が0.39μg/mlであった。*S. epidermidis*でも同様にTFLX, SPFXに次いで本剤はMINOとともにMIC₉₀が0.39μg/mlと優れていた。*S. pyogenes*と*S. pneumoniae*ではcefteram pivoxil (CFTM-PI)およびCVA/AMPCには劣るもののニューキノロンの中では本剤はTFLX, SPFXに次いでMIC₉₀が0.78μg/mlと優れていた。*E. faecalis*に対するMICでは、本剤はCVA/AMPC, TFLX, SPFXに次いでCPFXとともにMIC₉₀が1.56μg/mlと優れていた。*E. faecium*では本剤はSPFXに次いでCPFX, TFLXと同等の抗菌力を示した。

グラム陰性菌についてはTable 2-1~2-4に示した。*E. coli*に対してはCPFX, TFLX, SPFXに次いでOFLXとともにMIC₉₀が0.10μg/mlと非常に優れていた。*C. freundii*および*E. cloacae*に対するMICでは、CFTM-PI, CVA/AMPC, MINOで高値であったのに対し、他のニューキノロンと同様に低値を示し優れていた。*K. pneumoniae*および*M. morgani*に対しては本剤のMIC₉₀はそれぞれ0.39μg/mlと0.78μg/mlと他のニューキノロンおよびCFTM-PIと同等の優れたMICを示した。*P.*

Table 1-1. Antibacterial activity of temafloxacin and reference compounds against Gram-positive bacteria (10⁶ cells/ml)

Organism (no. of isolates)	Drug	MIC (μg/ml)		
		range	50%	90%
<i>S. aureus</i> (20)	temafloxacin	0.05~0.20	0.10	0.20
	ciprofloxacin	0.20~0.78	0.39	0.78
	ofloxacin	0.20~0.78	0.39	0.78
	tosufloxacin	0.05~0.10	0.05	0.10
	lomefloxacin	0.39~1.56	0.78	1.56
	fleroxacin	0.39~0.78	0.39	0.78
	sparfloxacin	0.05~0.20	0.05	0.10
	cefteram pivoxil	1.56~3.13	3.13	3.13
	clavulanic acid/amoxicillin	0.10~0.78	0.20	0.39
	minocycline	0.10~0.39	0.20	0.20
	MRSA (20)	temafloxacin	0.05~0.78	0.20
ciprofloxacin		0.20~3.13	0.39	1.56
ofloxacin		0.20~3.13	0.39	1.56
tosufloxacin		≤0.025~0.39	0.05	0.20
lomefloxacin		0.39~6.25	0.78	6.25
fleroxacin		0.39~6.25	0.78	3.13
sparfloxacin		≤0.025~0.20	0.10	0.20
cefteram pivoxil		1.56~>100	12.5	>100
clavulanic acid/amoxicillin		0.20~25	0.20	25
minocycline		0.05~0.78	0.05	0.78

Table 1-2. Antibacterial activity of temafloxacin and reference compounds against Gram-positive bacteria (10^6 cells/ml)

Organism (no. of isolates)	Drug	MIC ($\mu\text{g/ml}$)		
		range	50%	90%
<i>S. epidermidis</i> (20)	temafloxacin	0.1 ~ 0.39	0.20	0.39
	ciprofloxacin	0.2 ~ 0.78	0.39	0.39
	ofloxacin	0.39 ~ 1.56	0.39	0.78
	tosufloxacin	≤ 0.025 ~ 0.20	0.10	0.10
	lomefloxacin	0.78 ~ 3.13	0.78	1.56
	floxacin	0.39 ~ 3.13	0.78	0.78
	sparfloxacin	0.05 ~ 0.39	0.20	0.20
	cefteram pivoxil	0.39 ~ 12.5	1.56	12.5
	clavulanic acid/amoxicillin	0.39 ~ 100	0.20	6.25
	minocycline	0.10 ~ 25	0.20	0.39
<i>S. pyogenes</i> (20)	temafloxacin	0.39 ~ 0.78	0.78	0.78
	ciprofloxacin	0.39 ~ 1.56	0.78	1.56
	ofloxacin	0.78 ~ 1.56	1.56	1.56
	tosufloxacin	0.10 ~ 0.20	0.20	0.20
	lomefloxacin	1.56 ~ 6.25	6.25	6.25
	floxacin	1.56 ~ 12.5	6.25	6.25
	sparfloxacin	0.20 ~ 0.78	0.78	0.78
	cefteram pivoxil	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	clavulanic acid/amoxicillin	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	minocycline	0.10 ~ 12.5	0.20	12.5
<i>S. pneumoniae</i> (20)	temafloxacin	0.39 ~ 0.78	0.39	0.78
	ciprofloxacin	0.39 ~ 3.13	1.56	3.13
	ofloxacin	0.78 ~ 3.13	1.56	3.13
	tosufloxacin	0.10 ~ 0.20	0.20	0.20
	lomefloxacin	3.13 ~ 12.5	6.25	12.5
	floxacin	3.13 ~ 12.5	6.25	12.5
	sparfloxacin	0.20 ~ 0.39	0.39	0.39
	cefteram pivoxil	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	clavulanic acid/amoxicillin	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	minocycline	0.10 ~ 25	6.25	12.5
<i>E. faecalis</i> (20)	temafloxacin	0.39 ~ 1.56	0.78	1.56
	ciprofloxacin	0.39 ~ 1.56	0.78	1.56
	ofloxacin	0.78 ~ 3.13	1.56	3.13
	tosufloxacin	0.20 ~ 0.78	0.20	0.39
	lomefloxacin	3.13 ~ 6.25	3.13	6.25
	floxacin	1.56 ~ 6.25	3.13	6.25
	sparfloxacin	0.20 ~ 0.78	0.39	0.39
	cefteram pivoxil	0.39 ~ > 100	1.56	> 100
	clavulanic acid/amoxicillin	0.10 ~ 0.78	0.20	0.39
	minocycline	0.39 ~ 50	25	50
<i>E. faecium</i> (20)	temafloxacin	0.39 ~ 6.25	1.56	3.13
	ciprofloxacin	0.39 ~ 6.25	1.56	3.13
	ofloxacin	0.78 ~ 6.25	3.13	6.25
	tosufloxacin	0.20 ~ 3.13	0.78	3.13
	lomefloxacin	3.13 ~ 25	6.25	12.5
	floxacin	1.56 ~ 12.5	3.13	6.25
	sparfloxacin	0.20 ~ 1.56	0.39	0.39
	cefteram pivoxil	0.20 ~ > 100	> 100	> 100
	clavulanic acid/amoxicillin	0.05 ~ 25	6.25	12.5
	minocycline	0.20 ~ 25	6.25	25

Table 2-1. Antibacterial activity of temafloxacin and reference compounds against Gram-negative bacteria (10^8 cells/ml)

Organism (no. of isolates)	Drug	MIC ($\mu\text{g/ml}$)		
		range	50%	90%
<i>E. coli</i> (20)	temafloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.20$	0.05	0.10
	ciprofloxacin	$\leq 0.025 \sim \leq 0.025$	≤ 0.025	≤ 0.025
	ofloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.10$	0.05	0.10
	tosufloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.05$	≤ 0.025	≤ 0.025
	lomefloxacin	0.05 \sim 0.20	0.10	0.20
	floxacin	0.05 \sim 0.20	0.05	0.10
	sparfloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.10$	≤ 0.025	0.05
	cefteram pivoxil	0.05 \sim 0.78	0.20	0.39
	clavulanic acid/amoxicillin	0.78 \sim 12.5	3.13	6.25
	minocycline	0.39 \sim 6.25	1.56	3.13
<i>C. freundii</i> (20)	temafloxacin	$\leq 0.025 \sim 1.56$	0.20	1.56
	ciprofloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.39$	0.05	0.20
	ofloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.78$	0.20	0.78
	tosufloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.39$	0.05	0.39
	lomefloxacin	0.05 \sim 3.13	0.39	0.78
	floxacin	$\leq 0.025 \sim 0.78$	0.20	0.39
	sparfloxacin	$\leq 0.025 \sim 1.56$	0.10	1.56
	cefteram pivoxil	0.20 \sim > 100	> 100	> 100
	clavulanic acid/amoxicillin	25 \sim 100	50	100
	minocycline	1.56 \sim 100	3.13	50
<i>E. cloacae</i> (20)	temafloxacin	0.05 \sim 1.56	0.10	0.39
	ciprofloxacin	$\leq 0.025 \sim 3.13$	0.05	0.20
	ofloxacin	$\leq 0.025 \sim 1.56$	0.10	0.39
	tosufloxacin	$\leq 0.025 \sim 1.56$	0.05	0.10
	lomefloxacin	0.05 \sim 6.25	0.20	0.39
	floxacin	0.05 \sim 6.25	0.10	0.39
	sparfloxacin	$\leq 0.025 \sim 1.56$	0.10	0.39
	cefteram pivoxil	0.05 \sim > 100	1.56	> 100
	clavulanic acid/amoxicillin	6.25 \sim 100	50	50
	minocycline	0.78 \sim 25	3.13	6.25
<i>K. pneumoniae</i> (20)	temafloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.39$	0.20	0.39
	ciprofloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.20$	0.10	0.10
	ofloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.20$	0.20	0.20
	tosufloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.10$	0.05	0.10
	lomefloxacin	0.20 \sim 0.78	0.20	0.39
	floxacin	0.10 \sim 0.20	0.20	0.20
	sparfloxacin	0.05 \sim 0.20	0.10	0.20
	cefteram pivoxil	0.20 \sim 0.39	0.39	0.39
	clavulanic acid/amoxicillin	1.56 \sim 25	1.56	3.13
	minocycline	0.78 \sim 6.25	1.56	3.13
<i>M. morgani</i> (20)	temafloxacin	0.20 \sim 6.25	0.39	0.78
	ciprofloxacin	$\leq 0.025 \sim 3.13$	≤ 0.025	0.10
	ofloxacin	0.05 \sim 3.13	0.10	0.20
	tosufloxacin	0.05 \sim 3.13	0.10	0.20
	lomefloxacin	0.10 \sim 12.5	0.20	0.39
	floxacin	0.05 \sim 12.5	0.10	0.78
	sparfloxacin	0.10 \sim 6.25	0.20	0.39
	cefteram pivoxil	0.05 \sim > 100	0.20	0.78
	clavulanic acid/amoxicillin	50 \sim > 100	100	> 100
	minocycline	0.78 \sim 25	3.13	25

Table 2-2. Antibacterial activity of temafloxacin and reference compounds against Gram-negative bacteria (10^6 cells/ml)

Organism (no. of isolates)	Drug	MIC ($\mu\text{g/ml}$)		
		range	50%	90%
<i>P. rettgeri</i> (20)	temafloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.78$	0.20	0.39
	ciprofloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.10$	≤ 0.025	0.10
	ofloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.39$	0.10	0.39
	tosufloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.20$	0.05	0.10
	lomefloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.78$	0.20	0.39
	fleroxacin	$\leq 0.025 \sim 0.39$	0.10	0.39
	sparfloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.39$	0.20	0.20
	cefteram pivoxil	$\leq 0.025 \sim 12.5$	0.05	3.13
	clavulanic acid/amoxicillin	12.5 ~ >100	50	100
	minocycline	0.39 ~ 50	6.25	25
<i>P. mirabilis</i> (20)	temafloxacin	0.20 ~ 0.78	0.39	0.78
	ciprofloxacin	0.05 ~ 0.20	0.10	0.10
	ofloxacin	0.10 ~ 0.39	0.20	0.20
	tosufloxacin	0.05 ~ 0.20	0.20	0.20
	lomefloxacin	0.20 ~ 0.78	0.39	0.39
	fleroxacin	0.20 ~ 0.39	0.20	0.20
	sparfloxacin	0.20 ~ 0.78	0.39	0.39
	cefteram pivoxil	0.05 ~ 3.13	0.10	0.20
	clavulanic acid/amoxicillin	0.78 ~ 100	0.78	1.56
	minocycline	6.25 ~ >100	50	100
<i>P. vulgaris</i> (20)	temafloxacin	0.10 ~ 0.78	0.20	0.78
	ciprofloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.20$	0.05	0.10
	ofloxacin	0.05 ~ 0.39	0.10	0.20
	tosufloxacin	$\leq 0.025 \sim 0.20$	0.10	0.20
	lomefloxacin	0.10 ~ 0.78	0.20	0.78
	fleroxacin	0.05 ~ 0.39	0.10	0.39
	sparfloxacin	0.05 ~ 0.78	0.20	0.78
	cefteram pivoxil	0.10 ~ 0.78	0.20	0.39
	clavulanic acid/amoxicillin	0.78 ~ 50	6.25	25
	minocycline	3.13 ~ 25	6.25	12.5
<i>P. aeruginosa</i> (20)	temafloxacin	0.39 ~ 6.25	1.56	3.13
	ciprofloxacin	0.10 ~ 1.56	0.20	0.78
	ofloxacin	0.39 ~ 6.25	1.56	3.13
	tosufloxacin	0.10 ~ 1.56	0.39	0.78
	lomefloxacin	0.78 ~ 12.5	1.56	6.25
	fleroxacin	0.39 ~ 6.25	1.56	3.13
	sparfloxacin	0.39 ~ 3.13	1.56	3.13
	cefteram pivoxil	100 ~ >100	>100	>100
	clavulanic acid/amoxicillin	100 ~ >100	100	>100
	minocycline	12.5 ~ >100	25	50
<i>P. aeruginosa</i> (20) (GM ^r)	temafloxacin	0.20 ~ 6.25	1.56	6.25
	ciprofloxacin	0.05 ~ 0.78	0.39	0.78
	ofloxacin	0.78 ~ 6.25	1.56	3.13
	tosufloxacin	0.20 ~ 1.56	0.78	1.56
	lomefloxacin	0.39 ~ 12.5	3.13	6.25
	fleroxacin	0.78 ~ 6.25	3.13	3.13
	sparfloxacin	0.20 ~ 3.13	1.56	3.13
	cefteram pivoxil	25 ~ >100	>100	>100
	clavulanic acid/amoxicillin	100 ~ >100	>100	>100
	minocycline	12.5 ~ >100	50	>100

GM^r: gentamicin-resistant

Table 2-3. Antibacterial activity of temafloracin and reference compounds against Gram-negative bacteria (10^6 cells/ml)

Organism (no. of isolates)	Drug	MIC ($\mu\text{g/ml}$)		
		range	50%	90%
<i>P. cepacia</i> (20)	temafloracin	0.39 ~ 50	6.25	25
	ciprofloxacin	0.20 ~ 12.5	3.13	12.5
	ofloxacin	0.39 ~ 25	6.25	12.5
	tosufloxacin	0.10 ~ 12.5	1.56	6.25
	lomefloxacin	0.78 ~ 25	6.25	25
	floxacin	0.39 ~ 12.5	3.13	12.5
	sparfloxacin	0.10 ~ 12.5	3.13	12.5
	cefteram pivoxil	6.25 ~ > 100	25	100
	clavulanic acid/amoxicillin	> 100 ~ > 100	> 100	> 100
	minocycline	0.39 ~ > 100	6.25	> 100
<i>A. calcoaceticus</i> <i>var amitratus</i> (20)	temafloracin	≤ 0.025 ~ 6.25	0.10	3.13
	ciprofloxacin	0.05 ~ 12.5	0.39	3.13
	ofloxacin	0.10 ~ 12.5	0.20	3.13
	tosufloxacin	≤ 0.025 ~ 1.56	0.05	1.56
	lomefloxacin	0.20 ~ 25	0.78	12.5
	floxacin	0.10 ~ 12.5	0.39	6.25
	sparfloxacin	≤ 0.025 ~ 1.56	≤ 0.025	0.78
	cefteram pivoxil	1.56 ~ > 100	25	100
	clavulanic acid/amoxicillin	0.78 ~ 50	6.25	25
	minocycline	0.05 ~ 3.13	0.10	0.39
<i>M. catarrhalis</i> (20)	temafloracin	≤ 0.025 ~ 0.05	0.05	0.05
	ciprofloxacin	0.05 ~ 0.10	0.10	0.10
	ofloxacin	0.05 ~ 0.20	0.10	0.20
	tosufloxacin	≤ 0.025 ~ 0.05	≤ 0.025	≤ 0.025
	lomefloxacin	0.10 ~ 0.78	0.39	0.39
	floxacin	0.20 ~ 0.39	0.20	0.39
	sparfloxacin	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	cefteram pivoxil	0.20 ~ 1.56	0.78	1.56
	clavulanic acid/amoxicillin	0.05 ~ 0.20	0.20	0.20
	minocycline	0.10 ~ 0.20	0.10	0.20
<i>H. influenzae</i> (20)	temafloracin	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	ciprofloxacin	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	ofloxacin	≤ 0.025 ~ 0.10	≤ 0.025	0.10
	tosufloxacin	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	lomefloxacin	0.05 ~ 0.10	0.10	0.10
	floxacin	≤ 0.025 ~ 0.10	0.05	0.10
	sparfloxacin	≤ 0.025 ~ ≤ 0.025	≤ 0.025	≤ 0.025
	cefteram pivoxil	≤ 0.025 ~ 0.10	0.05	0.10
	clavulanic acid/amoxicillin	0.20 ~ 0.78	0.39	0.39
	minocycline	0.20 ~ 0.78	0.39	0.39
<i>H. influenzae</i> (8) (ABPC ^r)	temafloracin	≤ 0.025 ~ 0.39	≤ 0.025	0.39
	ciprofloxacin	≤ 0.025 ~ 0.10	≤ 0.025	0.10
	ofloxacin	≤ 0.025 ~ 0.20	0.05	0.20
	tosufloxacin	≤ 0.025 ~ 0.20	≤ 0.025	0.20
	lomefloxacin	0.05 ~ 0.39	0.10	0.39
	floxacin	0.05 ~ 0.39	0.10	0.39
	sparfloxacin	≤ 0.025 ~ 0.10	≤ 0.025	0.10
	cefteram pivoxil	≤ 0.025 ~ 0.10	0.05	0.10
	clavulanic acid/amoxicillin	0.39 ~ 1.56	1.56	1.56
	minocycline	0.10 ~ 1.56	0.78	1.56

ABPC^r: ampicillin-resistant

*rettgeri*に対するMICは他のニューキノロン剤と同様に低値であり優れていた。また、*P. mirabilis*および*P. vulgaris*に対してはともにMIC₉₀は0.78μg/mlと他のニューキノロン剤およびCFTM-PIと同様に優れていた。*P. aeruginosa*およびGM抵抗性*P. aeruginosa*に対する本剤のMIC₉₀はそれぞれ3.13μg/mlと6.25μg/mlであり、CPFX, TFLXに次いで良好であった。*P. cepacia*に対する本剤のMIC₉₀は25μg/mlであり、他の対照薬と同様にそれほど良好な感受性を示さなかった。*A. calcoaceticus* var *anitratus*に対する本剤のMIC₉₀はCPFXおよびOFLXと同様に3.13μg/mlであり、MINO, SPFX, TFLXに次いで優れていた。*M. catarrhalis*では全ての対照薬とほぼ同等程度に優れていた。*H. influenzae*に対してのMICは他の対照薬と同様に特に優れMIC₉₀は≤0.025μg/mlであった。ABPC抵抗性*H. influenzae*に

対しては、MIC₉₀は0.39μg/mlであり、他のニューキノロンとほぼ同等に優れていた。*S. marcescens*に対してはMIC₉₀は12.5μg/mlと高値であった。*N. gonorrhoeae*に対しては本剤はCPFX, SPFXと並んでMIC₉₀は≤0.025μg/mlであり優れていた。*B. fragilis*に対しては本剤のMIC₉₀は1.56μg/mlであり、TFLX, SPFXとともに良好であった。

2. 臨床的検討

症例の一覧をTable 3-1, 3-2に示した。

症例の内訳は急性気管支炎10例(内1例は急性咽頭炎を合併)、急性咽頭炎10例、急性扁桃炎1例、急性腎盂腎炎4例の計25例であった。また、感染症の重症度は軽症21例と中等症4例であった。

臨床効果は25例中、著効12例、有効12例、無効1例であった。

Table 2-4. Antibacterial activity of temafloxacin and reference compounds against Gram-negative bacteria (10⁶ cells/ml)

Organism (no. of isolates)	Drug	MIC (μg/ml)		
		range	50%	90%
<i>S. marcescens</i> (20)	temafloxacin	0.39 ~ 12.5	3.13	12.53
	ciprofloxacin	0.10 ~ 6.25	0.78	6.25
	ofloxacin	0.20 ~ 12.5	1.56	6.25
	tosufloxacin	0.10 ~ 12.5	0.78	3.13
	lomefloxacin	0.39 ~ 50	3.13	12.5
	fleroxacin	0.20 ~ 25	1.56	6.25
	sparfloxacin	0.10 ~ 12.5	1.56	6.25
	cefteram pivoxil	0.78 ~ >100	6.25	>100
	clavulanic acid/amoxicillin	25 ~ >100	100	>100
	minocycline	0.78 ~ 50	6.25	6.25
<i>N. gonorrhoeae</i> (20)	temafloxacin	≤0.025 ~ 0.10	≤0.025	≤0.025
	ciprofloxacin	≤0.025 ~ 0.20	≤0.025	≤0.025
	ofloxacin	≤0.025 ~ 0.39	≤0.025	0.10
	tosufloxacin	≤0.025 ~ 0.10	≤0.025	0.05
	lomefloxacin	≤0.025 ~ 0.78	≤0.025	0.10
	fleroxacin	≤0.025 ~ 0.39	≤0.025	0.10
	sparfloxacin	≤0.025 ~ 0.05	≤0.025	≤0.025
	cefteram pivoxil	≤0.025 ~ 0.39	≤0.025	0.10
	clavulanic acid/amoxicillin	0.10 ~ 1.56	0.78	1.56
	minocycline	0.20 ~ 1.56	0.39	0.78
<i>B. fragilis</i> (20)	temafloxacin	0.78 ~ 3.13	1.56	1.56
	ciprofloxacin	3.13 ~ 12.5	6.25	6.25
	ofloxacin	1.56 ~ 6.25	3.13	3.13
	tosufloxacin	0.39 ~ 1.56	0.39	1.56
	lomefloxacin	6.25 ~ 12.5	6.25	12.5
	fleroxacin	6.25 ~ 25	6.25	12.5
	sparfloxacin	0.39 ~ 3.13	0.78	1.56
	cefteram pivoxil	3.13 ~ 50	25	25
	clavulanic acid/amoxicillin	0.20 ~ 3.13	0.39	1.56
	minocycline	1.56 ~ 6.25	1.56	3.13

(10⁶ cells/ml)

Table 3-1. Clinical summary of temafloracin

Case no.	Age (yr)	Sex	Diagnosis underlying disease and complication	Temafloracin			Isolated organism		Fever (°C)	WBC (/mm ³)	CRP	Effect		Adverse effect
				dose (mg × times)	duration (days)	total dose (g)	species	MIC (μg/ml)				clinical	bacterio- logical	
1	22	F	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	NF		38.7 ↓ 36.5	9200 ↓ 4800	2.04 ↓ 0.76	good	unknown	none
2	27	F	acute bronchitis acute pharyngitis none	300 × 2	7	4.2	NF		38.5 ↓ 36.5	5400 ↓ ↓	2.23 ↓ ↓	good	unknown	none
3	69	M	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	NF		36.2 ↓ ↓	4700 ↓ 3000	0.4 ↓ 0.25	good	unknown	none
4	56	F	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	NF		37.5 ↓ 36.3	6700 ↓ 4200	2.04 ↓ 0.25	good	unknown	none
5	25	F	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	NF		36.0 ↓ 36.1	7300 ↓ 8600	0.48 ↓ 0.25	good	unknown	none
6	60	M	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	ND		37.0 ↓ 36.3	7500 ↓ 8400	0.58 ↓ 0.25	good	unknown	none
7	69	M	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	NF		37.1 ↓ 36.0	7300 ↓ 5100	3.24 ↓ 0.87	good	unknown	none
8	35	F	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	<i>S. pneumoniae</i> ↓ (-)	0.78	39.2 ↓ 36.2	13600 ↓ 6500	8.69 ↓ 0.48	excellent	eradicated	none
9	49	F	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	<i>K. pneumoniae</i> ↓ (-)	0.2	36.7 ↓ 36.0	5000 ↓ 4200	2.02 ↓ 0.25	good	eradicated	none
10	75	F	acute bronchitis none	300 × 2	7	4.2	NF		37.1 ↓ 36.0	10600 ↓ 8100	2.02 ↓ 0.25	excellent	unknown	none
11	29	M	acute pharyngitis alcoholic liver disease	300 × 2	7	4.2	NF		38.7 ↓ 36.5	11100 ↓ 5600	2.74 ↓ 0.25	excellent	unknown	none
12	36	F	acute pharyngitis none	300 × 2	7	4.2	NF		38.0 ↓ 36.2	2700 ↓ 3200	0.86 ↓ 0.25	excellent	unknown	none
13	73	F	acute pharyngitis heart failure	300 × 2	7	4.2	NF		37.0 ↓ 36.3	11300 ↓ 9100	0.25 ↓ 3.23	poor	unknown	none
14	40	M	acute pharyngitis none	300 × 2	7	4.2	NF		36.0 ↓ 36.2	8000 ↓ 4800	1.07 ↓ 0.25	good	unknown	none

NF: normal flora ND: not done

症例は1~10は急性気管支炎の症例である。症例1は咳嗽、喀痰の消失、解熱、白血球数の改善を認めたがCRPは2.04mg/dlから0.76mg/dlへと減少したものの正常化しなかったため有効とした。症例2は咽頭炎を合併していた。咳嗽、喀痰および咽頭痛の消失と解熱したことより有効とした。症例3では自覚症状の改善とCRPが0.40mg/dlから0.25mg/dl、血沈が27mm/hから4mm/hと改善したことより有効とした。症例4は咳

嗽、喀痰、および発熱などの自覚症状の消失と炎症反応の正常化を認め有効とした。症例5は臨床症状は改善し、白血球数は増加したが、CRPは正常化したので有効とした。症例6では咳嗽以外の臨床症状が改善し、CRPが正常化したので有効とした。症例7はCRPが3.24mg/dlから0.87mg/dlへ改善はしたものの正常化しなかったが、自覚症状の改善および白血球数の正常化を認めたので有効とした。症例8は自覚症状の改善

Table 3-2. Clinical summary of temafloxacin

Case no.	Age (yr)	Sex	Diagnosis underlying disease and complication	Temafoxacin			Isolated organism		Fever (°C)	WBC (/mm ³)	CRP	Effect		Adverse effect
				dose (mg × times)	duration (days)	total dose (g)	species	MIC (μg/ml)				clinical	bacterio- logical	
15	48	M	acute pharyngitis diabetes chronic hepatitis hypertension	300 × 2	7	4.2	NF		39.2 ↓ 36.3	5800 ↓ 6800	0.32 ↓ 0.25	excellent	unknown	none
16	16	M	acute pharyngitis none	300 × 2	7	4.2	NF		38.2 ↓ 36.4	4900 ↓ 5100	0.98 ↓ 0.4	excellent	unknown	none
17	41	F	acute pharyngitis none	300 × 1	1	0.3	<i>S. agalactiae</i> ↓ (-)	0.2	38.0 ↓ 36.2	7800 ↓ 5400	0.84 ↓ 0.25	excellent	eradicated	urticaria
18	17	M	acute pharyngitis none	300 × 2	14	8.4	<i>S. aureus</i> ↓ (-)	0.2	39.0 ↓ 36.2	6500 ↓ 5300	6.44 ↓ 0.35	excellent	eradicated	none
19	30	M	acute pharyngitis bronchial asthma	300 × 2	4	2.4	NF		37.2 ↓ 36.0	5300 ↓ 6100	0.56 ↓ 0.25	good	unknown	vomiting
20	40	M	acute pharyngitis none	300 × 2	7	4.2	NF		38.7 ↓ 36.2	10600 ↓ ↓	1.38 ↓ ↓	good	unknown	none
21	25	M	acute tonsillitis none	300 × 2	14	8.4	<i>S. pyogenes</i> ↓ (-)	0.2	38.4 ↓ 36.3	5500 ↓ 4300	2.05 ↓ 0.25	excellent	eradicated	none
22	32	F	acute pyelonephritis none	300 × 2	7	4.2	<i>E. coli</i> ↓ (-)	0.39	38.5 ↓ 36.0	5700 ↓ 4300	3.62 ↓ 0.44	good	eradicated	none
23	29	F	acute pyelonephritis none	300 × 2	7	4.2	<i>E. coli</i> ↓ (-)	0.2	39.1 ↓ 36.4	3300 ↓ 2900	1.07 ↓ 0.25	excellent	eradicated	none
24	19	F	acute pyelonephritis none	300 × 2	7	4.2	<i>S. epidermidis</i> ↓ (-)	ND	37.7 ↓ 36.2	5800 ↓ 6500	5.17 ↓ 0.34	excellent	eradicated	none
25	29	F	acute pyelonephritis none	300 × 2	7	4.2	ND		39.5 ↓ 36.2	9300 ↓ ↓	4.73 ↓ ↓	excellent	unknown	none

NF: normal flora ND: not done

解熱、起炎菌である*S. pneumoniae*の消失および炎症反応の明らかな改善から著効とした。症例9は自覚症状の著明な改善、CRPの正常化および起炎菌である*K. pneumoniae*の消失から有効とした。症例10は咳嗽、喀痰の消失、白血球数およびCRPの正常化から著効と判定した。

症例11～20には咽頭炎の症例が示されている。症例11は自覚症状の消失と炎症反応の著明な改善から著効とした。症例12は咽頭痛の消失、解熱、炎症反応の正常化が認められ著効とした。症例13では解熱を認めたものの咽頭痛は持続し、白血球数は正常化せず、CRPは陰性である0.25mg/dlから3.23mg/dlと増加しており無効とした。症例14では炎症反応は正常化したか咽頭痛は消失しきっていなかったため有効とした。症例15および16では解熱と咽頭痛の消失を認め炎症反応も正常化しており著効とした。また、症例17と症例18は解熱、咽頭痛の消失、炎症反応の正常化および起炎菌であるそれぞれ*S. agalactiae*と*S. aureus*の消失を認めたため著効とした。症例19は気管支喘息で通院中の患者に咽頭炎を合併したもので咽頭痛の消失、解熱、および炎症反応の正常化から有効とした。症例20は解熱と咽頭痛の消失を認めたが、炎症反応の消失が確認できなかったため有効と判定した。

症例21～25には急性扁桃炎および急性腎盂腎炎の症例が提示されている。症例21は急性扁桃炎であり、解熱および咽頭痛の消失、炎症反応の正常化および起炎菌である*S. pyogenes*の消失を認め著効と判定した。症例22と症例23は*E. coli*による急性腎盂腎炎である。ともに起炎菌である*E. coli*は消失したが症例22ではCRPが完全には正常化していなかったため有効とし、症例23はCRPも正常化していたため著効とした。症例24は急性腎盂腎炎の一例であり、尿培養から分離された*S. epidermidis*は消失し、炎症反応も明らかに消失しており著効とした。症例25は起炎菌は明らかにならなかったが、臨床症状から急性腎盂腎炎と診断された一例であり、明らかな解熱と臨床症状の改善を

認めたため著効とした。

以上をまとめるとTable 4に示したように急性咽頭炎で有効率が90%であった以外は急性気管支炎、急性扁桃炎、急性腎盂腎炎ではいずれも100%の有効率を示し、全体での有効率は96%となった。

3. 副作用

今回我々が検討した25例において、自・他覚的な副作用は症例17に蕁麻疹が、症例19に嘔吐が認められたのみであった。症例17の蕁麻疹は1回の服用により出現したが他に解熱鎮痛薬も服用していたため必ずしも本剤による副作用とは断定できず、可能性は否定できないものと考えた。また、嘔吐を呈した症例19では以前から気管支拡張薬を服用していたが本剤の服用開始とともに嘔吐を起しており本剤による副作用と判断した。嘔吐は服用後10分程度で起こった。服用2回目までは起こったが以後は服用によっても同症状を起こさず4日間の服用を完了した。

臨床検査(Table 5)において、投与終了時に異常値(当院の正常域から少しでも外れた値は異常値と表現)を示した症例は投与後に採血を行い得た22例中6例にみられた。このうち症例7では表中に示していないが投与後の γ -GTPが102 IU/lと異常高値を示していたが投与前は139 IU/lと更に高値であり、投与後はむしろ低下していることから本剤とは無関係であると判断した。症例10では投与後の好酸球は7.5% (607/mm³)と高値を示したが、投与前で既に7.7% (816/mm³)を示しており本剤による副作用とは無関係であると判定した。症例11では投与前のs-GPT43 IU/lと γ -GTP 78 IU/lが投与後それぞれ58 IU/l、113 IU/lと上昇していた。しかし、s-GOTは投与前の異常値39 IU/lから投与後32 IU/lと正常値に改善しており、さらに投与後のALPには変動を認めなかったため両者とも本剤との因果関係は無いものと判断した。症例13では投与後の γ -GTPが58 IU/lと高値を示したが、投与前の値が55 IU/lとほとんど変動を認めていなかったため本剤投与との関係は否定された。症例15では投与後でs-

Table 4. Clinical effects of temafloxacin

Diagnosis	No. of cases	Clinical effects				Efficacy rate (%)
		excellent	good	fair	poor	
Acute bronchitis	10	2	8			100
Acute pharyngitis	10	6	3		1	90.0
Acute tonsillitis	1	1				1/1
Acute pyelonephritis	4	3	1			4/4
Total	25	12	12		1	96.0

Table 5. Laboratory findings in patients before and after administration of temafloxacin

Case no.	RBC ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	WBC ($/\text{mm}^3$)	Hb (g/dl)	Eosino (%)	Platelets ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	GOT (IU/l)	GPT (IU/l)	ALP (IU/l)	BUN (mg/dl)	S-Cr (mg/dl)	ESR [60 min]
1 B	505	9200	13.5	0.1	25.0	28	14	126	12	1.0	60
1 A	473	4800	12.5	0.1	43.6	29	29	121	10	0.9	25
2 B	495	5400	15.6	0.1	15.0	24	13	112	15	1.0	22
2 A											
3 B	423	4700	12.8	5.2	27.9	14	13	182	17	1.1	27
3 A	400	3000	12.2	1.7	18.1	16	11	191	19	1.1	4
4 B	379	6700	12.3	1.5	22.7	52	41	328	14	0.6	75
4 A	382	4200	12.4	1.7	28.9	22	12	215	16	0.6	76
5 B	463	7300	11.5	1.5	27.4	22	27	134	7	0.8	24
5 A	500	8600	12.0	1.6	34.0	18	27	166	10	0.8	21
6 B	483	7500	15.4	4.3	26.1	17	24	103	15	1.0	14
6 A	505	8400	16.0	4.6	25.6	22	27	108	14	1.1	4
7 B	419	7300	15.0	0	17.5	39	28	173	11	0.9	19
7 A	399	5100	14.4	1.0	22.2	30	21	164	10	0.9	11
8 B	473	13600	13.4	0	23.4	75	70	271	14	1.0	63
8 A	442	6500	12.3	1.0	37.6	22	23	231	10	0.8	54
9 B	433	5000	12.9	2.0	22.0	22	17	240	10	0.7	34
9 A	424	4200	12.7	1.0	19.8	24	18	216	12	0.8	14
10 B	441	10600	12.7	7.7	34.0	10	3	129	15	1.0	31
10 A	446	8100	12.8	7.5	33.9	13	6	108	15	0.9	13
11 B	483	11100	14.8	0.1	21.9	39	43	118	12	1.0	18
11 A	445	5600	13.4	1.7	26.0	32	58	114	16	0.8	17
12 B	430	2700	9.4	0.4	22.2	20	11	147	8	0.8	37
12 A	404	3200	9.0	1.2	23.6	6	6	123	12	0.7	36
13 B	472	11300	14.1	0.1	37.1	25	21	163	18	1.0	
13 A	460	9100	13.7	0.2	37.3	22	19	161	20	1.1	
14 B	481	8000	15.0	0.4	19.4	18	28	136	13	1.0	12
14 A	497	4800	15.1	2.5	20.7	22	33	127	16	1.1	9
15 B	448	5800	14.4	1.7	27.4	63	58	179	14	0.9	7
15 A	437	6800	14.1	1.9	23.9	37	51	173	14	1.0	8
16 B	510	4900	15.4	1.8	26.0	15	9	283	11	1.1	9
16 A	497	5100	14.8	2.6	24.8	14	7	225	13	0.9	12
17 B	424	7800	12.7	0	18.8	17	13	139	8	0.7	11
17 A	409	5400	12.2	0.2	23.7	10	6	133	10	0.6	14
18 B	526	6500	14.9	0.5	20.5	18	19	112	8	1.0	32
18 A	525	5300	14.9	0.9	23.4	26	33	110	10	0.9	35
19 B	567	5300	17.2	2.5	21.2	27	46	133	12	0.9	9
19 A	530	6100	16.4	2.2	28.2	26	47	142	12	1.1	6
20 B	468	10600	14.9	0	22.1	22	17	131	9	1.0	7
20 A											
21 B	465	5500	11.7	0.7	16.9	11	6	114	8	0.7	25
21 A	440	4300	11.8	0.7	19.5	9	5	96	9	0.8	6
22 B	430	5700	11.6	0.3	27.0	33	39	102	11	0.8	27
22 A	422	4300	11.3	0.1	34.6	30	42	103	12	0.9	15
23 B	442	3300	12.2	0	39.2	18	10	104	9	0.9	38
23 A	378	2900	10.5	0.2	44.2	10	6	92	10	0.9	14
24 B	443	5800	12.0	0.2	18.6	10	7	121	15	0.8	24
24 A	452	6500	12.5	0.4	26.9	17	12	116	10	0.9	18
25 B	417	9300	12.5	1.0	22.7	13	10	131	9	0.8	40
25 A											

B: before A: after

GOTが37 IU/l, s-GPTが51 IU/l, γ -GTPが290 IU/lと異常値を示したが、投与前からs-GOTが63 IU/l, s-GPTが58 IU/l, γ -GTPが254 IU/lと異常を認めており、本剤投与との関係はないものと判定した。蕁麻疹のため1回で服薬を中止した症例17では特に検査値異常を呈さなかった。また、嘔吐を服用後に起こした症例19ではs-GPTとs-LDHの軽度高値を認めたが投与前値との変動は認めず新たな検査値異常とは判定しなかった。症例22でも同様に投与後にs-GPTが42 IU/lと異常高値を認めたが、投与前から39 IU/lであり、本剤投与の影響とは判定しなかった。

以上より、本剤投与後検査を行い得た22例には、本剤の投与により新たに出たと考えられる異常値はなかったことが確認された。

IV. 考 察

TMFXは広い抗菌スペクトラムを有し、特にグラム陽性菌および嫌気性菌に対し強い抗菌力を示すニューキノロンカルボン酸系の合成抗菌剤である。我々の臨床分離保存株に対する抗菌力測定の結果においても、本剤はグラム陽性球菌、グラム陰性菌および嫌気性菌に対して他のニューキノロン系抗菌薬と同等かそれ以上の抗菌活性を有していた。

特に*S. aureus*, MRSA, *S. epidermidis*, *S. pyogenes*に対するMICがTFMX, SPFXに次いで優れていたのみでなく、従来ニューキノロンの弱点の一つであった*S. pneumoniae*に対してもMIC₉₀が0.78 μ g/mlと低値であったことは特筆されるべきことと考えられた。

以上の*in vitro*の優れた抗菌活性は動物を用いた感染実験にも反映されており⁴⁾、今回の臨床例の検討においても確認された。特に、*S. pneumoniae*および*K. pneumoniae*による急性気管支炎、*S. agalactiae*および*S. aureus*による急性咽頭炎、*S. pyogenes*による急性扁桃炎、*E. coli*および*S. epidermidis*による急性腎盂腎炎がいずれもその菌に対する本剤のMICが低値であると

も*in vivo*効果とあいまって本剤で著効を呈しており注目される。

今回の我々の症例では、25例中24例で著効か有効であり有効率は96%と極めて優れていたことは、軽症例が21例あった結果である可能性は否定できない。しかし、抗菌活性は臨床的検討でも強力であることが示された。

また、本剤の経口吸収は良好であり、血中半減期(T_{1/2})は約7時間と長く¹⁾、1日2回の投与で優れた臨床効果を示したことから、使用しやすい薬剤と考えられる。

さらに、65歳以上の老人が4人いたにも関わらず、けいれんなどの中枢神経症状は認められず、可能性のある副作用として軽度の薬疹および嘔吐があったのみで、肝機能異常など臨床検査値異常も明らかなものは1例も認められなかったことから概ね安全な薬剤であることも示されたものと考えられる。今後、ますます、その有用性が確立されて行くものと思われ期待される薬剤である。

文 献

- 1) 那須 勝, 熊澤浄一: 第39回日本化学療法学会西日本支部総会, 新薬シンポジウム。Temafloxacin (TA-167), 大分, 1991
- 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) Chin N X, Figueredo V M, Novelli A, et al: *In vitro* activity of temafloxacin a new quinolone antimicrobial agent. Eur J Clin Microbiol Infect Dis 7: 58~63, 1988
- 4) 西野武志, 芝田和夫, 川井真好, 汐月紀子, 大槻雅子: Temafloxacinの*in vitro*および*in vivo*抗菌力。Chemotherapy 41 (S-5): 50~66, 1993

In vitro and *in vivo* clinical evaluation of temafloxacin

Akira Ohishi, Michihiro Sakauchi, Masatoshi Ishii, Hidetoshi Nakamura, Noboru Aosaki,
Hiroshi Yoshimatsu, Shinji Okui and Masataka Katsu
Department of Internal Medicine, Kasumigaura National Hospital,
2-7-14 Shimotakatsu, Tsuchiura 300, Japan

We carried out *in vitro* and *in vivo* studies on temafloxacin (TMFX), a newly-developed quinolone, and obtained the following results. The MICs of 488 clinical isolates of 25 species were compared with those of the other tested antibiotics, ciprofloxacin, ofloxacin, tosufloxacin, lomefloxacin, fleroxacin, sparfloxacin (SPFX), ceftam pivoxil (CFTM-PI), clavulanic acid/amoxicillin (CVA/AMPC) and minocycline (MINO).

Against Gram-positive cocci, the antibacterial activity of TMFX was higher than or almost equal to those of the other antibacterial agents examined. Against Gram-negative rods and cocci, the MICs of TMFX were lower than those of SPFX, CFTM-PI, CVA/AMPC and MINO, and equal to those of the other new quinolones tested.

In the clinical study, TMFX was given to 21 patients with respiratory infections and 4 with urinary tract infections. Clinical efficacy was excellent in 12, good in 12 and poor in 1, with an efficacy rate of 96.0%.

Side effects observed were urticaria in 1 and vomiting in 1, which disappeared while the agent was continued. There were no newly-developed abnormal findings in laboratory examinations.