

Temafloracinの臨床的検討

小山 優

東京共済病院内科*

新しく開発されたニューキノロン合成抗菌剤temafloxacinを急性扁桃腺炎3例, 咽頭炎3例, 急性気管支炎5例, 慢性気管支炎2例, 気管支拡張症1例, 急性膀胱炎1例, 急性腎盂腎炎1例計16例に投与し, 臨床的効果および安全性について検討した。投与方法は1回量150mgを1日2~3回, 投与期間は5~19日間であった。臨床効果は著効5例, 有効11例と全例に有効であった。本剤によると思われる副作用, 臨床検査値異常は認められなかった。

Key words : temafloxacin, 呼吸器感染症, 尿路感染症

Temafloracin(TMFX)は米国アボット社で創製された経口用のニューキノロン合成抗菌剤である。この度, 当院に於いて同意の得られた16例の中等度以下の呼吸器, 尿路感染症に本剤を使用する機会を得, その臨床効果ならびに安全性を検討したので報告する。

対象症例は1990年8月より1991年3月までに当院外来または入院中の中等度以下の呼吸器感染および尿路

感染症で, 24歳から80歳までの男性6例, 女性10例である。本剤の投与方法は1回150mgの1日2回(15例)と3回(1例)の食後30分経口内服であり, 投与期間は5日から19日間で, 総投与量は1.5gから6.3gであった。

各症例におけるTMFXの臨床効果ならびに細菌学的効果はTable 1-1, 1-2, 2に示す通りである。呼吸器感染症に対する本剤の効果は, 急性扁桃腺炎3例中2

Table 1-1. Clinical summary of temafloxacin treatment

Case no.	Age (yr)	Sex	Diagnosis underlying disease and complication	Temafloracin			Isolated organism species	Effect		Adverse effects
				dose (mg × times)	duration (days)	total dose (g)		clinical	bacteriological	
1	54	F	acute tonsillitis —	150 × 2	7	2.1	NF	excellent	unknown	—
2	60	F	acute tonsillitis —	150 × 2	19	5.7	<i>S. aureus</i> ↓ (-)	good	eradicated	—
3	46	F	acute tonsillitis —	150 × 2	5	1.5	NF	excellent	unknown	—
4	34	M	acute pharyngitis —	150 × 2	7	2.1	NF	excellent	unknown	—
5	30	M	acute pharyngitis —	150 × 2	5	1.5	NF	good	unknown	—
6	63	M	acute pharyngitis renal failure	150 × 2	7	2.1	<i>S. pneumoniae</i> ↓ (-)	excellent	eradicated	—
7	58	F	acute bronchitis —	150 × 2	7	2.1	NF	good	unknown	—
8	58	F	acute bronchitis hypertension	150 × 2	5	1.5	NF	good	unknown	—

NF: normal flora

Table 1-2. Clinical summary of terafloxacin treatment

Case no.	Age (yr)	Sex	Diagnosis underlying disease and complication	Terafloxacin			Isolated organism species	Effect		Adverse effects
				dose (mg × times)	duration (days)	total dose (g)		clinical	bacterio- logical	
9	55	M	acute bronchitis alcoholic hepatitis	150 × 2	7	2.1	NF	good	unknown	—
10	80	F	acute bronchitis cerebral arteriosclerosis	150 × 2	10	3.0	NF	good	unknown	—
11	24	M	acute bronchitis —	150 × 2	5	1.5	NF	good	unknown	—
12	62	M	chronic bronchitis old tuberculosis	150 × 3	14	6.3	NF	good	unknown	—
13	60	F	chronic bronchitis old tuberculosis	150 × 2	9	2.7	NF	good	unknown	—
14	72	F	bronchiectasis obsolete pulmonary tuberculosis	150 × 2	6	1.8	<i>P. aeruginosa</i> ↓ (-)	good	eradicated	—
15	75	F	acute cystitis —	150 × 2	6	1.8	<i>Streptococcus</i> sp. ↓ (-)	good	eradicated	—
16	80	F	acute pyelitis cerebral infarction	150 × 2	8	2.4	<i>P. mirabilis</i> <i>P. aeruginosa</i> <i>Enterococcus</i> sp. ↓ (-)	excellent	eradicated	—

NF: normal flora

例に著効，1例有効である。症例2は扁桃腺炎の他覚所見の改善に日数を要したが，解熱効果，臨床検査値は順調に改善し臨床効果は有効であった。急性咽頭炎3例に対しては著効2例，有効1例である。急性気管支炎の4例では，全例に有効であった。症例10はlomefloxacinにて臨床症状の改善が得られず本剤に変更した，この前投薬の影響で本剤投与前の臨床検査値の細菌感染所見は少なかった。慢性気管支炎の2例はいずれも陳旧性肺結核を基礎疾患とした症例であったが，いずれも有効であった。症例12は薬剤名は不明であるが，他院よりの前投薬があり本剤投薬前の臨床検査値は感染所見が少なかった。気管支拡張症の1例も陳旧性肺結核を基礎疾患に持つ症例であるが臨床効果は有効であった。

尿路感染症の2例は急性膀胱炎と，脳梗塞のため長期床上生活で留置カテーテル使用中に発症した腎盂腎炎であるがいずれも有効以上であった。

細菌学的効果は呼吸器感染症では扁桃腺炎で*Staphylococcus aureus*，咽頭炎で*Streptococcus pneumoniae*，気管支拡張症で*Pseudomonas aeruginosa*が検出された

が，これらは全て除菌された。尿路感染症では*Streptococcus* sp.，*Proteus mirabilis*，*Enterococcus* sp.，*Pseudomonas aeruginosa*が検出されたが，これらも全て除菌された。

以上の全症例において副作用，臨床検査値(Table 3)の異常変動は認められなかった。

TMFXは当院における各種細菌感染症に対し，呼吸器感染症では上気道感染症の6例に著効4例，有効2例と優れた臨床効果を示し，また呼吸器感染症に対してその有用性の判断の指標となる慢性気管支炎3例に対する効果も全例有効であった。尿路感染症に対しては著効が認められ，本剤の良好な尿中移行¹⁾が示唆された。この様に臨床効果は全例に有効であり，かつて我々の経験した同種ニューキノロン剤の臨床効果^{2,3)}と遜色なかった。細菌学的には呼吸器感染症で検出された細菌は常在菌が多く，起炎菌として同定されたものは少数ではあるがいずれも除菌され，また尿路感染症での検出菌も消失した。これは本剤がグラム陽性菌，グラム陰性菌に対して幅広い抗菌力を有するとの基礎的報告¹⁾を良く反映したのと言えよう。臨床的副作用お

Table 2. Clinical efficacy of temafloxacin

Diagnosis	No. of cases	Excellent	Good	Fair	Poor	Efficacy rate
Acute pharyngitis	3	2	1			
Acute tonsillitis	3	2	1			
Acute bronchitis	5		5			
Chronic bronchitis	2		2			
Bronchiectasis	1		1			
Acute cystitis	1		1			
Acute pyelonephritis	1	1				
Total	16	5	11			100%

Table 3. Laboratory findings in patients before and after administration of temafloxacin

Case no.		RBC ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	WBC (/mm ³)	Hb (g/dl)	Eosino. (%)	Platelets ($\times 10^4/\text{mm}^3$)	ESR [60 min]	CRP	GOT (IU/l)	GPT (IU/l)	ALP (IU/l)	BUN (mg/dl)	Cr. (mg/dl)
1	B	499	11400	16.2	1	16.8		3.3	31	23	226	11.6	0.7
	A	454	4600	14.6	0	16.0		0.2	37	26	211	13.9	0.8
2	B	418	10000	12.0	0	49.2	114	11.4	17	17	443	10.9	0.8
	A	426	4900	12.0	2	41.5	41	0.3	20	17	268	10.0	0.8
3	B	462	12200	14.1	2	25.9	12	9.2	14	9	163	13.2	0.7
	A	480	8400	14.6	4	28.3		0.1	11	8	167	14.4	0.7
4	B		9800	16.7	2	24.1	19	9.2	39	19	272	16.0	0.7
	A		6200	16.5	1	25.8	3	0.1	22	16	278	11.3	0.8
5	B	503	4700	15.1	1	14.6	10	1.5	20	9	131	10.5	1.1
	A	510	3000	15.6	0	19.1	12	0.3	19	17	134	9.7	1.0
6	B	445	6900	15.3	2	14.8	41	17.0	16	13	207	10.6	0.8
	A	447	5600	15.1	0	26.7	27	0.7	24	13	216	14.4	0.8
7	B	437	8100	13.6	4	27.2	22	6.1	18	13	226	19.3	0.7
	A	447	7500	13.4	6	22.7	12	0.1	16	13	250	24.5	0.7
8	B	500	9000	13.5	3	27.5	22	0.3	16	13	216	13.0	0.8
	A	506	7200	13.2	1	26.1	16	0.3	22	14	187	15.4	0.9
9	B	415	8400	14.2	0	22.5	26	4.1	44	27	233	13.1	0.9
	A	397	4700	13.7	7			0.2	41	34	241	16.5	0.7
10	B	401	4200	12.5	2	19.1	28	0.4	22	9	232	16.0	1.1
	A	383	4700	11.9	2	18.2	27	0.2	20	11	204	17.3	1.1
11	B	441	10700	14.8	1	22.5		3.3	20	18	261	14.2	0.8
	A	452	6600	15.0	1	28.1		0.1	19	17	282	18.1	0.7
12	B	443	5300	14.9	2	25.7	36	3.5	12	7	209	12.4	0.7
	A	473	6600	15.2	4	22.5	8	0.1	12	11	216	12.3	1.0
13	B	390	9500	12.7	4	24.7	42	9.2	22	19	244		
	A	400	4600	13.2	6	23.5	53	1.5	17	18	309	19.0	0.7
14	B	428	11000	12.3	2	33.5	91	2.5	10	13	238	11.3	0.8
	A	408	9100	11.9	0	29.4	94	0.6	14	8	214	10.9	0.7
15	B	398	4100	8.6			31	0.9	42	23	287	8.9	0.6
	A	392	3000	9.6	2	42.3		0.1	21	15	274	9.1	0.6
16	B	480	6500	14.6	0	11.1	15	4.5	13	7	238	15.3	0.9
	A	473	5300	14.6	0	13.7	11	0.9	11	7	206	11.1	0.7

B: before A: after

よび臨床検査値異常も認められず安全性の高い薬剤と考えられた。以上の結果より本剤は呼吸器および尿路感染症に対して、有用性の高い薬剤であると言えよう。

文 献

- 1) 中島光好, 植松俊彦, 長嶋 悟, 小菅和仁, 金丸光隆: Temafloracinの臨床第I相試験。Chemotherapy 41 (S-5): 242~259, 1993
- 2) 小山 優, 渡辺健太郎, 横沢光博: NY-198の臨床的検討。Chemotherapy 36(S-2): 560~564, 1988
- 3) 小山 優, 渡辺健太郎: T-3262の臨床的検討。Chemotherapy 36(S-9): 480~485, 1988
- 4) 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。Temafloracin(TA-167), 大分, 1991

Clinical study on temafloracin

Masaru Koyama

Department of Internal Medicine, Tokyo Kyosai Hospital
2-3-8 Nakameguro, Meguro-ku, Tokyo 153, Japan

In order to determine the clinical utility and safety profile of temafloracin (TMFX), a newly developed synthetic new-quinolone antibiotics it was administered to 16 patients with various infections in a dose of 150 mg b.i.d. or t.i.d. for 5 to 14 days. This series of patients consisted of 3 patients with acute tonsillitis, 3 with pharyngitis, 5 with acute bronchitis, 2 with chronic bronchitis, and 1 each with bronchiectasis, acute cystitis, and acute pyelonephritis. The test drug benefited all of the patients, the response being excellent in 5 patients and good in 11. No symptomatic adverse effect or abnormal laboratory data which seemed imputable to administration of the test drug were observed.