

Temafloracinの呼吸器感染症における臨床的検討

泉 三郎

富山県立中央病院内科*

Temafloracin(TMFX)を10例の呼吸器感染症患者に投与し、その臨床効果を検討した。その内訳は、中葉症候群が4例、気管支拡張症が4例、気管支拡張症と肺炎の併発が1例、扁桃炎が1例であった。結果は著効3例、有効5例、やや有効3例であり、無効症例はなかった。副作用としては神経症状が1例に認められたが、ごく軽微なもので治療に影響を与えるものではなかった。臨床検査値の異常は全例に認められなかった。以上の結果からTMFXは呼吸器感染症において極めて有効な抗菌剤と考えられた。

Key words : temafloracin, 呼吸器感染症, ニューキノロン剤

Temafloracin(TMFX)は、アボット社において既存のニューキノロン系薬剤よりも広範囲な抗菌スペクトルを持ち、吸収が良く、かつ持続性があり安全域の広い化合物の開発を目的として合成されたアリルフロキノロン誘導体である。化学的にはキノロン環の1位に2,4-ジフロロフェニル基、6位にフッ素原子、7位に3-メチルピペラジニル基を有する。その特徴としてはグラム陽性菌および陰性菌に広範なスペクトルを示し、グラム陽性菌および嫌気性菌に対しては既存薬剤より強く、グラム陰性菌に対しては同等の抗菌力を示す。経口投与において十分な血中濃度が得られ、各組織への移行も良好である。また、髄液内への移行はofloxacin (OFLX)よりも低い。動物実験において一般毒性、特殊毒性ともに既存の同系統の薬剤と同様の安全性が確認されている¹⁾。

今回のTMFXを呼吸器感染症患者に投与しその治療効果を検討する機会を得たのでその結果を報告する。

対象は富山県立中央病院内科外来へ通院した呼吸器感染症の患者10例である。年齢は32歳から83歳、男性4例、女性6例であった。疾患別の内訳としては中葉症候群4例、気管支拡張症4例、気管支拡張症と肺炎の合併1例、扁桃炎1例である。投与方法は、1例においてTMFXを1回150mg、1日2回(朝夕食後)の内服とし、残り9例はすべて1回300mgを1日2回(朝夕食後)の内服とした。投与日数は最短で6日間、最長で14日間、総投与量は2.1gから8.4gであった。

臨床効果の判定は、胸部レントゲン像、臨床検査所見、特に白血球数、血沈値、CRP値、その他起炎菌の推移を観察し、著効(excellent)、有効(good)、やや有効

(fair)、無効(poor)の4段階に判定した。

これらの症例一覧表をTable 1に示した。10例の呼吸器感染症患者にTMFXを投与した。臨床効果としては著効3例、有効5例、やや有効2例であり、無効例はなかった。以下、各疾患グループごとにその効果について述べる。

中葉症候群はそのオリジナルの形はBrockの論文で述べられているように中葉周囲のリンパ節が結核病変に侵されたものである²⁾。しかし、結核とは関係なくその解剖学的特性に由来すると考えられるものが外来の慢性気道感染症患者の中に非常に多い。今回の10例の中にこの中葉症候群が4例見られた。その臨床効果は著効2例、有効2例であった。

気管支拡張症は、中葉症候群とその病態の一部が重なるものであるが、外来における慢性気道感染症の中で一番多く見られる疾患である。気管支拡張症4例と気管支拡張症に肺炎が併発した1例を経験した。気管支拡張症の4例のうち3例が有効、1例がやや有効という結果であった。やや有効であった1例は49歳の女性で鼻に限局したウエジナー肉芽腫を基礎疾患に持ち、プレドニン10mg/日の内服を行っていた。気管支拡張症に肺炎を併発した1例は79歳の男性であり、喀痰からは*Klebsiella* sp.が検出されていたが、その臨床効果はやや有効というものであった。

扁桃炎の症例が1例あった。その効果は著効であり著しい臨床症状の改善が見られた。

喀痰の培養により検出された菌の内訳は、*Streptococcus pneumoniae* 3例、*Pseudomonas aeruginosa* 2例、*Staphylococcus aureus* 1例、*Klebsiella* sp. 1例、*Streptococcus pyogenes* 1例であった。*S. pneumoniae* に対して

は従来、ニューキノロン剤の抗菌力が弱いとされてきた³⁾。しかし、今回の著者らの経験した3例ではいずれもTMFXの内服後消失して培養されなかった。*P. aeruginosa*では1例で減少、1例で不変であった。*S. aureus*が検出された1例では内服後菌は減少した。*Klebsiella* sp.の1例では、内服後も菌は不変であった。*S. pyogenes*が検出された1例では内服後菌は消失した。

副作用としては、53歳の女性の気管支拡張症の症例において、ふらふら感、舌のしびれを訴えたが、治療には差し支えなく中断することなく終了した。症状は治療終了後消失した。臨床検査値ではTMFXの内服

後異常を示したものはなかった。以上のごとく、特に問題となるような副作用は経験しなかった。

今回、外来通院患者における呼吸器感染症の10例にTMFXを投与してその臨床効果を検討した。その結果、著効3例、有効5例と極めて良好な成績を示し、残る2例もやや有効で無効症例はなかった。従来ニューキノロン剤の抗菌力が弱いとされていた*S. pneumoniae*に対して極めて良好な成績を示した。副作用は1例に認められたが、ごく軽微なもので治療に対して影響は与えなかった。

Table 1. Results of a clinical investigation in respiratory infections treated with temafloxacin

Case no.	Age (y)	Sex	Diagnosis	Temafloxacin treatment			Isolated organism		Effect		Side effects
			underlying disease and complication	dose (mg × times)	duration (day)	total dose (g)	before after	MIC 10 ⁶ (μg/ml)	clinical	bacteriological	
1	83	M	middle lobe syndrome pulmonary emphysema	300 × 2	14	8.4	<i>S. aureus</i> ↓ <i>S. aureus</i>	0.20	good	decreased	—
2	59	F	middle lobe syndrome hypertension, fatty liver	300 × 2	14	8.4	<i>S. pneumoniae</i> ↓ normal flora	0.20	excellent	eradicated	—
3	80	F	middle lobe syndrome hyperthyroidism hypertension	150 × 2	7	2.1	(-) ↓ (-)	—	good	unknown	—
4	61	M	middle lobe syndrome cholelithiasis hypertension	300 × 2	7	4.2	<i>S. pneumoniae</i> ↓ (-)	0.39	excellent	eradicated	—
5	66	F	bronchiectasis thrombocytopenia	300 × 2	14	8.4	normal flora ↓ (-)	—	good	unknown	—
6	49	F	bronchiectasis wegener's granulomatosis	300 × 2	7	4.2	<i>P. aeruginosa</i> ↓ <i>P. aeruginosa</i>	0.78	fair	persisted	—
7	41	F	bronchiectasis hypertension	300 × 2	14	8.4	<i>S. pneumoniae</i> ↓ (-)	0.20	good	eradicated	—
8	53	F	bronchiectasis chronic paranasal sinusitis	300 × 2	14	8.4	<i>P. aeruginosa</i> ↓ <i>P. aeruginosa</i>	1.56	good	decreased	numbness of the tongue light-headedness
9	79	M	bronchiectasis pneumonia —	300 × 2	14	8.4	<i>Klebsiella</i> sp. ↓ <i>Klebsiella</i> sp.	1.56	fair	persisted	—
10	32	M	tonsillitis —	300 × 2	6	3.6	<i>S. pyogenes</i> ↓ (-)	0.39	excellent	eradicated	—

文 献

- 1) 那須 勝, 熊澤淨一: 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
- 2) Brock RC: Post-tuberculous bronchostenosis of

the middle lobe. *Thorax* 5: 5, 1950

- 3) 松本文夫: キノロンカルボン酸。感染症と抗生物質の使い方(改訂新版)。島田 馨編集, p.35~37, 文光堂, 東京, 1990

Clinical study of temafloxacin in respiratory tract infections

Saburo Izumi

Department of Internal Medicine, Toyama Central Prefectural Hospital
2-2-78 Nishi-nagae, Toyama 930, Japan

A clinical study of temafloxacin (TMFX), a newly developed quinolone, was conducted in 10 outpatients with respiratory infections (4 with middle-lobe syndrome, 3 with bronchiectasis, one with bronchiectasis complicated by pneumoia and one with tonsillitis). Clinical efficacy was excellent in three cases, good in five and fair in two. Numbness of the tongue and a light-headedness were noted in one female patient. Based on these results, TMFX is evaluated to be a useful antimicrobial agent in respiratory tract infections.