

Temafloxacinに関する基礎的・臨床的検討

米津精文・山中吉隆・安永幸二郎

関西医科大学第一内科*

新しく開発されたニューキノロン系合成抗菌剤である temafloxacin(TMFX)につき基礎的・臨床的検討を行った。

1)臨床分離の諸種保存菌株に対する本剤のMICを測定し、ofloxacin(OFLX), ciprofloxacin(CPFX), tosufloxacin(TFLX)のそれと比較検討した。その結果、methicillin-susceptible *Staphylococcus aureus*, methicillin-resistant *S. aureus*に対するMIC₅₀, MIC₉₀は何れもOFLX, CPFXより優れていたが、TFLXより劣っていた。*Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Providencia rettgeri*, *Serratia marcescens*, *Pseudomonas aeruginosa*に対しては、それぞれOFLXと同等であるが、他の2剤より劣っていた。*Proteus mirabilis*, *Morganella morganii*に対しては最も劣っていた。

2)呼吸器感染症32例, 尿路感染症5例, 感染性腸炎1例, 皮膚感染症1例の計39例に、本剤を1日150~300mg, 4~14日間投与した。効果判定可能対象38例の中、3例に著効, 31例に有効, 3例にやや有効, 1例に無効の成績を得た。

3)副作用は39例の中に下痢1例, 発熱1例の計2例を認めた。臨床検査値異常は評価可能対象30例の中、好酸球増多と胆道系酵素値の上昇を各々2例認めた。

Key words: temafloxacin, ニューキノロン系合成抗菌剤, 抗菌力, 臨床的検討

Temafloxacin(TMFX)は米国アボット社で新しく合成開発されたアリルフロロキノロン誘導体で、グラム陽性菌・グラム陰性菌および嫌気性菌などに対し幅広い抗菌力を有し、特にグラム陽性菌・嫌気性菌に対する抗菌力は強く、さらにマイコプラズマ・クラミジア・抗酸菌・レジオネラなどに対しても非常に強い抗菌力を示すといわれている¹⁾。

今回、われわれはTMFXにつき基礎的・臨床的検討を行い、その有用性につき検討を行ったので報告する。

教室保存の標準菌株に対するTMFXならびに対照薬剤の最小発育阻止濃度(MIC)²⁾をTable 1に示した。本剤は、対照のピリドンカルボン酸系3薬剤[ofloxacin(OFLX), ciprofloxacin(CPFX), tosufloxacin(TFLX)]のMICと比較して、*Staphylococcus aureus*に対してはTFLXより劣るが、OFLX・CPFXより優れていた。グラム陰性菌に対しては、*Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Serratia marcescens* や *Pseudomonas aeruginosa* においてはCPFXより劣っていたが、おおむねOFLXと同等のMICであった。

諸種の臨床材料より分離されたmethicillin-susceptible *S. aureus* (MSSA) 29株, methicillin-resistant *S. aureus* (MRSA) 49株, *Escherichia coli* 53株, *Klebsiella*

pneumoniae 43株, *P. mirabilis* 57株, *P. vulgaris* 7株, *Morganella morganii* 26株, *Providencia rettgeri* 16株, *S. marcescens* 53株, *Pseudomonas aeruginosa* 50株を用いて、TMFXおよび対照薬剤のMICの分布、MIC₅₀, MIC₉₀をTable 2に示した。

MSSA, MRSAに対する本剤のMICは、TFLXよりほぼ1管劣るが、OFLX・CPFXよりほぼ1管優れていた。*E. coli*, *P. rettgeri*, *S. marcescens*, *P. aeruginosa*に対する本剤のMICはOFLXと同等で、CPFX・TFLXよりほぼ2管劣っていた。*K. pneumoniae*に対しては、OFLXと同等で、CPFX・TFLXよりほぼ1管劣っていた。*P. mirabilis*, *M. morganii*に対する本剤のMICはCPFXより3~4管、OFLX・TFLXよりほぼ1~2管劣っていた。

1990年5月より1991年3月までの間に、当科外来受診および入院した39例を対象として臨床評価を行った。対象の性別は、男性9例, 女性30例で、年齢分布は18歳~87歳に及び、平均年齢は54歳であった。疾患の内訳は、呼吸器感染症32例(急性扁桃炎2例, 急性気管支炎4例, 慢性気管支炎急性増悪5例, 気管支拡張症+感染7例, びまん性汎細気管支炎1例, 気管支喘息二次感染2例, 肺癌二次感染3例, 塵肺二次感

*〒570 守口市文園町1番地

染1例, 急性肺炎3例, 肺化膿症1例, マイコプラズマ肺炎2例, 肺結核1例), 尿路感染症5例(膀胱炎3例, 急性腎盂腎炎1例, 急性前立腺炎1例), 感染性腸炎1例, 皮膚感染症1例であった。

投与方法は, 1回150mgを1日1回食後投与した1例を除いて, すべて1日2回食後に内服にて投与した。投与期間は4~14日間である。効果判定は自他覚的所見ならびに検査成績の改善の度合いにより, 著効, 有効, やや有効, 無効の4段階に分けて判定した。

さらに, 自他覚的副作用の有無を観察するとともに, 本剤の投与前後に末梢血液像, 血液生化学的検査等を行い, 本剤の投与によると思われる異常の有無を検討した。

臨床効果判定対象は, 不能であった感染性腸炎1例を除く38例であった。各症例の成績はTable 3-1, 3-2に示した如くで, その38例の中, 著効3例, 有効31例, やや有効3例, 無効1例の成績を得た。無効1例は喉頭癌肺転移に併発した肺化膿症の例であった。

疾患群別の臨床効果ならびに有効率は, Table 4に示した如く, 呼吸器感染症では32例中, 著効2例, 有効27例, やや有効2例, 無効1例で, 有効率90.6%であった。尿路感染症では, 5例中, 著効1例, 有効3例, やや有効1例で, 有効率80%であった。皮膚感染症1例は有効であった。

細菌学的効果では, 38例中, 投与前に検出し得た推定起炎菌は17例より得た18株であったが, 菌の消長が確認し得た13株での消失率は92.3%であった(Table 5)。

自他覚的副作用の有無は全例で検討可能で, 臨床検査値の変動の判定可能症例は39例中30例(Table 6-1, 6-2)であったが, 副作用は下痢, 発熱を各々1例, 臨床検査値異常は好酸球増多と胆道系酵素値の上昇を各々2例に認めた。本剤は米国アボット社で新しく合成されたアリルフロロキノロン誘導体で, 幅広い抗菌スペクトルと良好な吸収および組織移行性, 約7時間と長い血中濃度半減期などを特徴としている。

本剤の抗菌力を検討するため, OFLX, CPFX, TFLXを対照薬として, 教室保存の各種臨床分離株に対するMICを測定した。その結果, 本剤はいずれの菌種に対しても良好なMICを示したが, 中でも近年臨床的に問題となっているMRSAに対しては, TFLXよりやや劣るもののOFLX, CPFXを上まわる抗菌力を示し, その他の菌種に対しても, 臨床の場で繁用されているOFLXとほぼ同等の成績を得た。さらに今回われわれは検討しなかったが, *Streptococcus pneumoniae*, *Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*など, 呼吸器感染症の重要な起炎菌種に対して既存の同系薬剤を上まわる抗菌力を示すことが報告されており, ま

Table 1. MICs of temafloxacin against standard strains

Strains	MIC ($\mu\text{g/ml}$)			
	temafloxacin	ofloxacin	ciprofloxacin	tosufloxacin tosilate
<i>Staphylococcus aureus</i> 209P JC-1	0.10	0.20	0.10	0.025
<i>Staphylococcus aureus</i> MS353	0.10	0.39	0.10	0.05
<i>Micrococcus luteus</i> ATCC9341	3.13	3.13	3.13	1.56
<i>Bacillus subtilis</i> ATCC6633	0.10	0.20	0.10	0.05
<i>Escherichia coli</i> NIHJ JC-2	0.10	0.10	0.025	0.025
<i>Escherichia coli</i> K-12 C-603	0.025	0.05	0.012	0.20
<i>Salmonella enteritidis</i> G14	0.10	0.20	0.05	0.20
<i>Enterobacter cloacae</i> 963	0.20	0.20	0.05	0.10
<i>Enterobacter aerogenes</i> ATCC13048	0.10	0.20	0.025	0.10
<i>Serratia marcescens</i> IAM1184	0.39	0.10	0.05	0.20
<i>Proteus vulgaris</i> OX-19	0.10	0.20	0.05	0.05
<i>Proteus vulgaris</i> HX-19	0.10	0.20	0.10	0.05
<i>Proteus mirabilis</i> IFO3849	0.39	0.10	0.10	0.10
<i>Morganella morganii</i> IFO3848	0.20	0.10	0.025	0.10
<i>Providencia rettgeri</i> IFO3850	0.20	0.20	0.025	0.10
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> IFO3445	3.13	1.56	0.39	0.39
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> NCTC10490	0.78	0.78	0.10	0.20
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> PA01	1.56	0.78	0.20	0.39

10^6 cells/ml

た本剤の喀痰中への移行は血漿中濃度との比が約1と良好であることから¹⁾、呼吸器感染症に対する本剤の有用性が期待された。実際、我々が行った臨床的検討においても、呼吸器感染症32例中、著効2例、有効27

例、やや有効2例、無効1例で有効率90.6%と優れた成績であり、基礎的検討の結果を裏付けるものであった。また尿路感染症、皮膚感染症など、その他の感染症においても、症例数は少なかつたもののほぼ満足できる

Table 2. *In vitro* activity of terafloxacin and other quinolones

Organism (no. of strains)	Drug	MIC ($\mu\text{g/ml}$)		
		range	MIC ₅₀	MIC ₉₀
Methicillin-susceptible <i>Staphylococcus aureus</i> (MSSA) (29)	terafloxacin	0.05 ~ 12.5	0.20	0.78
	ofloxacin	0.20 ~ 25	0.39	0.78
	ciprofloxacin	0.10 ~ 25	0.39	1.56
	tosufloxacin tosilate	0.05 ~ 12.5	0.10	0.20
Methicillin-resistant <i>Staphylococcus aureus</i> (MRSA) (49)	terafloxacin	0.10 ~ 100	12.5	25
	ofloxacin	0.20 ~ >100	25	50
	ciprofloxacin	0.10 ~ >100	50	100
	tosufloxacin tosilate	0.025 ~ >100	6.25	25
<i>Escherichia coli</i> (53)	terafloxacin	0.012 ~ 3.13	0.10	0.20
	ofloxacin	0.025 ~ 3.13	0.10	0.20
	ciprofloxacin	≤ 0.006 ~ 1.56	0.025	0.025
	tosufloxacin tosilate	≤ 0.006 ~ 0.78	0.025	0.05
<i>Klebsiella pneumoniae</i> (43)	terafloxacin	0.05 ~ 0.78	0.20	0.39
	ofloxacin	0.05 ~ 0.78	0.20	0.39
	ciprofloxacin	0.012 ~ 0.39	0.05	0.20
	tosufloxacin tosilate	0.012 ~ 0.39	0.05	0.10
<i>Proteus mirabilis</i> (57)	terafloxacin	0.20 ~ 0.78	0.39	0.78
	ofloxacin	0.05 ~ 0.39	0.10	0.20
	ciprofloxacin	0.025 ~ 0.39	0.025	0.20
	tosufloxacin tosilate	0.05 ~ 0.39	0.10	0.20
<i>Proteus vulgaris</i> (7)	terafloxacin	0.10 ~ 0.78	0.20	0.78
	ofloxacin	0.05 ~ 1.56	0.10	1.56
	ciprofloxacin	0.025 ~ 0.20	0.05	0.20
	tosufloxacin tosilate	0.05 ~ 0.39	0.20	0.39
<i>Morganella morganii</i> (26)	terafloxacin	0.20 ~ 6.25	0.39	0.78
	ofloxacin	0.05 ~ 0.78	0.10	0.20
	ciprofloxacin	0.012 ~ 0.20	0.025	0.05
	tosufloxacin tosilate	0.05 ~ 1.56	0.10	0.20
<i>Providencia rettgeri</i> (16)	terafloxacin	0.05 ~ 6.25	1.56	6.25
	ofloxacin	0.10 ~ 12.5	1.56	3.13
	ciprofloxacin	0.025 ~ 12.5	0.39	3.13
	tosufloxacin tosilate	0.05 ~ 6.25	0.39	1.56
<i>Serratia marcescens</i> (53)	terafloxacin	0.20 ~ 12.5	3.13	6.25
	ofloxacin	0.10 ~ 12.5	1.56	6.25
	ciprofloxacin	0.05 ~ 6.25	0.78	3.13
	tosufloxacin tosilate	0.05 ~ 3.13	0.78	1.56
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> (50)	terafloxacin	0.39 ~ 100	1.56	25
	ofloxacin	0.78 ~ 100	1.56	12.5
	ciprofloxacin	0.10 ~ 25	0.39	3.13
	tosufloxacin tosilate	0.20 ~ 100	0.78	6.25

Table 3-1. Clinical efficacy of temafloxacin

Case no.	Age (yr) Sex	Diagnosis	Underlying disease and complications	Dose and duration	Isolated organisms	Clinical effect	Bacteriological effect	Side effects	Remarks
1	18 F	acute tonsillitis	—	150 mg × 2 11 days	NT	good	unknown	—	
2	29 F	acute tonsillitis	—	150 mg × 2 7 days	NT	good	unknown	—	
3	21 F	acute bronchitis	—	150 mg × 2 6 days	<i>S. aureus</i>	excellent	eradicated	—	
4	23 F	acute bronchitis	—	150 mg × 2 7 days	normal flora	good	unknown	—	
5	78 F	acute bronchitis	hypertension	150 mg × 2 7 days	NT	good	unknown	—	
6	74 F	acute bronchitis	—	150 mg × 2 7 days	normal flora	good	unknown	—	
7	41 F	acute exacerbation of chronic bronchitis	Turner syndrome primary agammaglobulinemia	150 mg × 2 11 days	normal flora	good	unknown	—	
8	68 M	acute exacerbation of chronic bronchitis	diabetes mellitus	150 mg × 2 14 days	<i>S. pneumoniae</i> <i>H. influenzae</i>	good	eradicated	—	eo. †
9	71 F	acute exacerbation of chronic bronchitis	—	150 mg × 2 7 days	<i>H. influenzae</i>	good	eradicated	—	
10	71 F	acute exacerbation of chronic bronchitis	hypothyroidism hypertension chronic sinusitis	150 mg × 2 7 days	normal flora	good	unknown	—	
11	29 M	acute exacerbation of chronic bronchitis	congenital spherocytosis	150 mg × 2 8 days	<i>H. influenzae</i>	good	unknown	—	
12	62 F	bronchiectasis + infection	—	150 mg × 2 14 days	<i>S. aureus</i>	good	diminished	—	
13	64 F	bronchiectasis + infection	gastric ulcer cerebral thrombosis	150 mg × 2 12 days	<i>H. influenzae</i>	good	eradicated	—	
14	52 F	bronchiectasis + infection	—	150 mg × 2 7 days	normal flora	good	unknown	—	
15	73 F	bronchiectasis + infection	—	150 mg × 2 7 days	normal flora	good	unknown	—	
16	22 F	bronchiectasis + infection	allergic broncho-pulmonary aspergillosis	150 mg × 2 10 days	<i>S. pneumoniae</i>	good	unknown	—	
17	57 M	bronchiectasis + infection	—	150 mg × 2 10 days	normal flora	good	unknown	—	
18	65 F	bronchiectasis + infection	—	150 mg × 2 7 days	normal flora	good	unknown	—	
19	55 F	diffuse panbronchiolitis	—	150 mg × 2 7 days	<i>S. pneumoniae</i>	good	unknown	—	
20	55 F	bronchial asthma + infection	chronic hepatitis renal cyst	150 mg × 2 7 days	normal flora	good	unknown	—	
21	58 F	bronchial asthma + infection	—	150 mg × 2 7 days	NT	good	unknown	—	

NT: not tested

Table 3-2. Clinical efficacy of terafloxacin

Case no.	Age (yr) Sex	Diagnosis	Underlying disease and complications	Dose and duration	Isolated organisms	Clinical effect	Bacteriological effect	Side effects	Remarks
22	66 F	lung cancer + infection	—	150 mg × 2 7 days	<i>S. pneumoniae</i>	good	eradicated	—	
23	76 M	lung cancer + infection	—	150 mg × 2 7 days	NT	fair	unknown	—	
24	53 M	lung cancer + infection	carcinomatous pleurisy	150 mg × 2 7 days	<i>M. catarrhalis</i>	good	eradicated	—	
25	87 M	pneumoconiosis + infection	diabetes mellitus	150 mg × 2 14 days	<i>P. aeruginosa</i>	good	unknown	—	
26	67 F	acute pneumonia	radiation pneumonia post op. adenocystic carcinoma in left mandible	150 mg × 2 14 days	NT	fair	unknown	—	
27	38 F	acute pneumonia	myasthenia gravis post op. malignant thymoma	150 mg × 2 11 days	<i>P. aeruginosa</i>	good	eradicated	—	
28	58 F	acute pneumonia	—	150 mg × 2 6 days	normal flora	good	unknown	—	eo. ↑
29	57 M	lung abscess	post op. laryngeal cancer tracheostomy metastatic lung cancer prostate hypertrophy	150 mg × 2 4 days	<i>S. aureus</i> *	poor	unknown	diarrhea	ALP↑ γ-GTP↑ LAP↑
30	37 F	mycoplasmal pneumonia	—	150 mg × 2 14 days	normal flora	excellent	unknown	—	
31	25 F	mycoplasmal pneumonia	—	150 mg × 2 10 days	NT	good	unknown	—	
32	86 M	pulmonary tuberculosis	hypertension ischemic heart disease	150 mg × 2 14 days	normal flora	good	unknown	—	
33	62 F	pyelonephritis	chronic hepatitis	150 mg × 2 11 days	<i>E. coli</i>	good	eradicated	—	
34	42 F	cystitis	—	150 mg × 2 4 days	normal flora	good	unknown	—	
35	53 F	cystitis	—	150 mg × 2 11 days	<i>E. coli</i>	good	eradicated	—	
36	56 F	cystitis	hyperlipidemia	150 mg × 1 8 days	normal flora	fair	unknown	—	
37	35 M	acute prostatitis	—	150 mg × 2 5 days	<i>E. coli</i>	excellent	eradicated	—	
38	70 F	acute enteritis	hypertension	150 mg × 2 7 days	normal flora	unknown	unknown	fever	ALP, γ-GTP CRP, ESR↑
39	60 F	carbuncle	sarcoidosis	150 mg × 2 7 days	<i>S. aureus</i>	good	eradicated	—	

NT: not tested *: observation after two days

成績を得た。副作用は下痢，発熱を各々1例に認めたが，いずれも重篤なものではなく，止瀉薬，解熱薬の投与により回復している。また臨床検査値異常は好酸球増多と胆道系酵素値の上昇を各々2例に認めたが，

いずれも軽度で臨床的には問題となるものではなかった。以上の結果より，本剤は呼吸器感染症を始めとする各種感染症に対して有用性の高い薬剤であると考えられた。

Table 4. Clinical efficacy of temafloxacin classified by diagnosis

Diagnosis	No. of cases	Clinical effect					Efficacy rate* (%)
		excellent	good	fair	poor	unknown	
acute tonsillitis	2		2				2/2
acute bronchitis	4	1	3				4/4
acute exacerbation of chronic bronchitis	5		5				5/5
bronchiectasis + infection	7		7				7/7
diffuse panbronchiolitis	1		1				1/1
bronchial asthma + infection	2		2				2/2
lung cancer + infection	3		2	1			2/3
pneumoconiosis + infection	1		1				1/1
acute pneumonia	3		2	1			2/3
lung abscess	1				1		0/1
mycoplasmal pneumonia	2	1	1				2/2
pulmonary tuberculosis	1		1				1/1
sub total	32	2	27	2	1		29/32 (90.6)
pyelonephritis	1		1				1/1
cystitis	3		2	1			2/3
acute prostatitis	1	1					1/1
sub total	5	1	3	1			4/5
acute enteritis	1					1	—
carbuncle	1		1				1/1
sub total	2		1			1	—
Total	39	3	31	3	1	1	34/38 (89.5)

RTI: respiratory tract infection UTI: urinary tract infection *: $\frac{\text{excellent} + \text{good}}{\text{No. of cases-unknown}}$

Table 5. Bacteriological efficacy of temafloxacin

Organism	No. of strains	Bacteriological effect			Eradication rate* (%)
		eradicated	diminished	unknown	
<i>Staphylococcus aureus</i>	4	2	1	1	2/3
<i>Streptococcus pneumoniae</i>	4	2	0	2	2/2
<i>Haemophilus influenzae</i>	4	3	0	1	3/3
<i>Escherichia coli</i>	3	3	0	0	3/3
<i>Pseudomonas aeruginosa</i>	2	1	0	1	1/1
<i>Moraxella catarrhalis</i>	1	1	0	0	1/1
Total	18	12	1	5	12/13 (92.3)

*: eradicated/No. of strains except "unknown"

Table 6-1. Laboratory findings before and after administration of temafloxacin

No.		H (g/dl)	WBC (/mm ³)	Eosino. (%)	GOT (IU)	GPT (IU)	ALP (IU)	γ-GTP (IU)	BUN (mg/dl)	Cr (mg/dl)
1	B	11.9	11,700	0	13	6	203	6	11	0.6
	A	11.6	3,000	0	—	—	—	—	—	—
2	B	13.7	14,900	0	25	28	142	44	14	0.6
	A	13.2	8,000	0	20	24	138	—	8	0.4
3	B	13.8	12,700	1	19	17	141	17	12	0.5
	A	12.3	7,100	0	23	20	117	23	13	0.5
4	B	12.5	5,800	2	12	3	100	11	6	0.5
	A	13.2	5,400	0	13	5	107	15	13	0.5
5	B	11.2	8,800	1	14	7	160	9	20	0.6
	A	11.2	7,100	0	15	5	148	8	20	0.6
6	B	13.4	4,400	4	19	14	154	21	10	0.6
	A	13.3	9,200	2	17	12	170	—	18	0.5
7	B	16.8	7,500	6	26	26	357	30	16	0.4
	A	15.8	7,700	1	22	18	322	27	11	0.4
8	B	14.1	9,800	1	17	11	122	16	20	0.6
	A	13.8	7,400	7	—	—	—	—	—	—
9	B	11.8	5,500	0	20	11	189	12	25	0.6
	A	11.5	5,100	3	—	—	—	—	—	—
10	B	12.4	8,000	2	16	9	169	15	12	0.5
	A	—	—	—	—	—	—	—	—	—
11	B	12.0	13,700	0.5	17	9	147	13	22	0.7
	A	12.0	9,600	2	20	10	141	11	—	—
12	B	12.9	4,800	2	15	10	190	12	21	0.7
	A	12.6	5,600	0	15	10	183	10	18	0.7
13	B	13.7	13,100	0	25	11	122	18	9	0.8
	A	14.1	6,700	1	24	11	183	22	17	0.6
14	B	11.2	7,000	0	14	8	219	15	—	—
	A	—	—	—	—	—	—	—	—	—
15	B	10.7	6,600	0	29	18	111	—	13	0.5
	A	9.8	7,100	1	19	10	110	16	12	0.5
16	B	13.4	12,800	0	11	16	108	16	14	0.6
	A	13.8	11,700	0	13	15	107	19	13	0.6
17	B	13.3	8,000	4	16	7	162	14	14	0.7
	A	13.5	5,500	6	18	12	160	21	12	0.7
18	B	14.4	7,900	0	27	15	215	20	10	0.5
	A	—	—	—	—	—	—	—	—	—
19	B	13.8	10,100	0	31	17	227	18	19	0.5
	A	—	—	—	—	—	—	—	—	—
20	B	12.9	8,900	1	23	20	365	81	15	0.7
	A	13.4	7,000	2	36	37	424	97	14	0.5

B: before A: after

Table 6-2. Laboratory findings before and after administration of temafloxacin

No.		H (g/dl)	WBC (/mm ³)	Eosino. (%)	GOT (IU)	GPT (IU)	ALP (IU)	γ-GTP (IU)	BUN (mg/dl)	Cr (mg/dl)
21	B	12.6	7,300	0	14	6	210	8	12	0.6
	A	12.2	6,500	1.5	14	9	196	11	13	0.5
22	B	12.3	7,500	0	10	4	195	38	18	0.5
	A	11.5	6,600	0	12	5	153	22	15	0.5
23	B	7.6	8,000	1	8	2	169	12	28	1.1
	A	8.1	9,200	1	—	—	—	—	—	—
24	B	13.2	7,200	0	18	19	166	37	17	0.8
	A	13.4	5,200	1	21	14	144	30	18	0.9
25	B	13.2	11,400	5.5	14	10	202	25	26	0.9
	A	11.3	5,100	2	18	11	193	10	18	0.9
26	B	11.1	4,800	1	21	11	169	13	—	—
	A	11.6	4,900	5	25	10	188	18	—	—
27	B	13.0	13,800	0	38	39	196	29	9	0.5
	A	13.9	13,900	0	28	22	286	26	13	0.5
28	B	12.2	6,200	1	18	6	228	12	10	0.7
	A	12.0	4,900	6	21	7	220	13	14	0.6
29	B	10.7	9,100	1	20	10	158	18	12	1.0
	A	9.9	6,500	0	22	18	270	90	23	1.0
30	B	11.1	8,000	2	27	39	219	93	7	0.5
	A	11.7	4,000	1	21	36	—	56	8	0.5
31	B	14.4	9,000	1	18	12	177	18	11	0.5
	A	13.4	5,000	5	15	14	167	14	9	0.5
32	B	10.4	5,000	6	16	9	111	24	—	—
	A	—	—	—	21	11	113	30	15	0.8
33	B	12.2	9,300	1	53	70	412	187	12	0.7
	A	12.5	7,100	2	15	13	179	55	19	0.6
34	B	13.3	5,600	1	11	10	85	—	20	0.5
	A	—	—	—	—	—	—	—	—	—
35	B	14.5	10,600	1	24	14	255	14	11	0.6
	A	13.9	6,400	1	25	14	218	15	—	—
36	B	13.8	8,600	1	22	14	262	—	12	0.7
	A	13.2	6,500	1	15	9	237	—	15	0.7
37	B	15.9	16,600	0.5	15	10	155	24	15	1.0
	A	15.0	5,000	3	21	15	125	—	20	0.9
38	B	12.4	9,700	1	15	11	179	27	11	0.7
	A	11.3	8,700	1	30	25	267	62	12	0.8
39	B	14.4	9,600	0	—	—	—	—	—	—
	A	14.0	8,300	1	14	12	124	14	18	0.7

B: before A: after

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

Laboratory and clinical studies on temafloracin

Seibun Yonezu, Yoshitaka Yamanaka and Kojiro Yasunaga
First Department of Internal Medicine, Kansai Medical University
1 Fumizono-cho, Moriguchi 570, Japan

We studied temafloracin (TMFX), a newly synthesized antibacterial agent which is a pyridonecarboxylic acid derivative, for its antibacterial activity *in vitro* and its clinical availability.

The following results were obtained;

1) Antibacterial activity *in vitro*

The MICs of TMFX against bacterial strains isolated from clinical foci were determined, and compared with those of ofloxacin (OFLX), ciprofloxacin (CPFX) and tosufloxacin (TFLX). The activity of TMFX against methicillin-susceptible and -resistant *Staphylococcus aureus* was superior to that of OFLX and CPFX, but inferior to that of TFLX. Against *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Providencia rettgeri*, *Pseudomonas aeruginosa* and *Serratia marcescens*, the antibacterial activity of TMFX was similar to that of OFLX, but inferior to that of CPFX and TFLX. However, against *Proteus mirabilis* and *Morganella morganii*, the activity of TMFX was lower than that of the other agents.

2) Clinical trial

The patients were treated with TMFX (150~300 mg/day) for 4~14 days. One of the cases was excluded from the efficacy assessment. Of the remaining 38 cases (32 of RTI, 5 of UTI and 1 of skin infection), 34 responded to the therapy.

Laboratory examination, carried out in 30 of 39 cases, revealed eosinophilia and elevations of ALP and γ -GTP in two patients each. Side effects were observed in two cases: diarrhea in one patient and fever in another.