

Pazufloxacinの試験管内抗菌力と臨床効果に関する検討

栗村 統・平本雄彦・中野喜久雄・富永直子
国立呉病院内科*

野崎公敏
国立呉病院放射線科

丸山泰助・古居 順
国立呉病院薬剤科

土井秀之・河野通子・下中秋子・近藤満子
国立呉病院臨床検査科

甲田徹三・市村 宏・田村偉久夫
国立呉病院臨床研究部

新ニューキノロン系抗菌薬であるpazufloxacin (PZFX)の試験管内抗菌力および臨床効果について検討した。

抗菌力は臨床分離株24菌種、378株についてPZFXの最小発育阻止濃度を測定し、同時に測定したofloxacin (OFLX), ciprofloxacin (CPFX), fleroxacin (FLRX)の抗菌力と比較検討した。グラム陽性菌については*Staphylococcus* spp. に対する抗菌力はPZFXが最も優れていた。*Streptococcus* spp. に対してPZFXの抗菌力はFLRXを除く他剤よりやや劣っていた。グラム陰性菌に対してはCPFXとほぼ同等の抗菌力を示し、OFLX, FLRXより優れていた。*Klebsiella pneumoniae*, *Xanthomonas maltophilia*に対してはPZFXの抗菌力が最も優れていた。

臨床的検討は本試験参加に同意の得られた症例で、肺炎1例、急性気管支炎3例について行なった。投与量は300mg/日2例、600mg/日2例で、1日2ないし3回、食後に投与した。投与日数は3~13日である。肺炎例および急性気管支炎の1例に無効、他の2例には有効であった。肺炎例より分離された*Streptococcus pneumoniae*は除菌できなかった。副作用および臨床検査値異常はみられなかった。

Key words : PZFX, 抗菌力, 臨床効果

Norfloxacinが実用に供されて以来、いわゆるニューキノロン系抗菌薬は、強力な抗菌力と、幅広い抗菌スペクトルを有するため、多くの分野の感染症に使用され、優れた効果をあげている。その後も新しいニューキノロン系抗菌薬の開発が相ついでいる。今回われわれは新たに開発されたpazufloxacin (PZFX)¹⁾の試験管内抗菌力と臨床効果について検討した。

国立呉病院で臨床材料から分離され、保存されている下記の24菌種、378株について検討した。Methicillin感受性*Staphylococcus aureus* (MSSA), methicillin耐性*S. aureus* (MRSA), Coagulase negative *Staphylococcus* (CNS), *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus agalactiae*, *Enterococcus faecalis*, *Escherichia coli*, *Cit-*

robacter freundii, *Klebsiella pneumoniae*, *Salmonella typhi*, *Salmonella* spp., *Shigella* spp., *Enterobacter cloacae*, *Proteus vulgaris*, *Proteus mirabilis*, *Morganella morganii*, *Hafnia alvei*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Xanthomonas maltophilia*, *Vibrio parahaemolyticus*, *Vibrio alginolyticus*, *Aeromonas hydrophila*, *Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*の各菌種である。その中で、*S. aureus*は分離後1年、*S. pneumoniae*ほか*Streptococcus* spp. および*H. influenzae*は分離後3カ月以内の株を使用した。その他の菌種は過去十数年間に分離され、保存されている株のなかから無作為に取り出して検討に供した。抗菌力は化学療法学会標準法²⁾に従い、平板希釈法によりMICを測定した。培地は感受性disc用培地(栄研)を使用し、血液寒天培地およ

びチョコレート寒天培地には3%の羊赤血球を加えた。接種菌量は 10^6 cfu/ml, 37°Cで培養し, 24時間および48時間後に集落の有無を観察した。同時に ofloxacin (OFLX), ciprofloxacin (CPFX), fleroxacin (FLRX) についても MIC を測定し, 比較検討した。

PZFX, OFLX, CPFX および FLRX のグラム陽性球菌に対する MIC 分布を Table 1 に, 腸内細菌科に属する菌種に対する MIC 分布を Table 2 に, その他のグラム陰性菌に対する MIC 分布を Table 3 に示した。MSSA に対して PZFX の MIC は $0.2\mu\text{g/ml}$ から $3.13\mu\text{g/ml}$ に分布し, MIC_{50} は $0.39\mu\text{g/ml}$, MIC_{90} は $0.78\mu\text{g/ml}$ で耐性株はみられなかった。他の3剤もほぼ同様の MIC 分布を示したが, 15株中1株に耐性株がみられた。MRSA に対して PZFX の MIC は $1.56\mu\text{g/ml}$ から $25\mu\text{g/ml}$ に分布したが, 他の3剤の MIC はより耐性域に分布した。CNS に対して PZFX の MIC は $0.39\mu\text{g/ml}$ から $6.25\mu\text{g/ml}$ に分布し, MIC_{50} は $0.39\mu\text{g/ml}$, MIC_{90} は $6.25\mu\text{g/ml}$ にあり, 他の3剤よりやや優れた抗菌力を示した。*S. pneumoniae* に対して PZFX の MIC は $3.13\mu\text{g/ml}$ から $12.5\mu\text{g/ml}$ に分布し MIC_{50} は $6.25\mu\text{g/ml}$, MIC_{90} は $12.5\mu\text{g/ml}$ で, FLRX よりやや優れていたが, 他

の2剤よりはやや劣っていた。*S. pyogenes* に対して PZFX の MIC は $0.78\mu\text{g/ml}$ から $3.13\mu\text{g/ml}$ に分布し, MIC_{50} は $1.56\mu\text{g/ml}$ に, MIC_{90} は $3.13\mu\text{g/ml}$ にあり, OFLX とは同等, FLRX より優れていたが, CPFX よりはあきらかに劣っていた。*S. agalactiae* に対して PZFX の MIC は $3.13\mu\text{g/ml}$, $6.25\mu\text{g/ml}$ に分布し, MIC_{50} , MIC_{90} とも $3.13\mu\text{g/ml}$ にあり, FLRX より優れていたが, OFLX よりやや劣り, CPFX よりはあきらかに劣っていた。*E. faecalis* に対して PZFX の MIC は $1.56\mu\text{g/ml}$ から $3.13\mu\text{g/ml}$ に分布し MIC_{50} , MIC_{90} はともに $3.13\mu\text{g/ml}$ にあり OFLX, CPFX とほぼ同等で, FLRX よりやや優れていた。*E. coli* に対して PZFX の MIC は $0.025\mu\text{g/ml}$ から $0.39\mu\text{g/ml}$ に分布し, MIC_{50} は $0.025\mu\text{g/ml}$, MIC_{90} は $0.05\mu\text{g/ml}$ であった。最も強い抗菌力を示したのは CPFX であったが, MIC_{90} は $0.05\mu\text{g/ml}$ で PZFX と等しかった。OFLX, FLRX の抗菌力は PZFX よりは劣っていた。*C. freundii* に対して PZFX の MIC は $0.025\mu\text{g/ml}$ から $0.2\mu\text{g/ml}$ に分布し, MIC_{50} は $0.025\mu\text{g/ml}$, MIC_{90} は $0.1\mu\text{g/ml}$ で, CPFX よりやや劣っていたが, 他の2剤よりあきらかに優れていた。*K. pneumoniae* に対して PZFX の MIC は $0.05\mu\text{g/ml}$ から $0.39\mu\text{g/ml}$ に分布し,

Table 1. Susceptibility of clinical isolates to pazufloxacin, ofloxacin, ciprofloxacin and fleroxacin. gram-positive cocci
Inoculum size: 10^6 cfu/ml

Organism	Drug	MIC ($\mu\text{g/ml}$)		
		range	MIC_{50}	MIC_{90}
<i>Staphylococcus aureus</i> methicillin sensitive 15 strains	pazufloxacin	0.2~3.13	0.39	0.78
	ofloxacin	0.39~12.5	0.39	0.78
	ciprofloxacin	0.39~12.5	0.39	1.56
	floxacin	0.39~25	0.78	1.56
<i>Staphylococcus aureus</i> methicillin resistant 15 strains	pazufloxacin	1.56~25	12.5	25
	ofloxacin	6.25~100	25	100
	ciprofloxacin	12.5~>100	25	100
	floxacin	12.5~>100	50	>100
Coagulase-negative <i>Staphylococcus</i> 15 strains	pazufloxacin	0.39~6.25	0.39	6.25
	ofloxacin	0.39~12.5	0.78	12.5
	ciprofloxacin	0.2~12.5	0.39	12.5
	floxacin	0.78~50	0.78	25
<i>Streptococcus pneumoniae</i> 15 strains	pazufloxacin	3.13~12.5	6.25	12.5
	ofloxacin	1.56~6.25	3.13	3.13
	ciprofloxacin	1.56~12.5	3.13	6.25
	floxacin	6.25~25	12.5	25
<i>Streptococcus pyogenes</i> 15 strains	pazufloxacin	0.78~3.13	1.56	3.13
	ofloxacin	0.78~3.13	1.56	3.13
	ciprofloxacin	0.2~0.78	0.78	0.78
	floxacin	1.56~12.5	6.25	12.5
<i>Streptococcus agalactiae</i> 15 strains	pazufloxacin	3.13~6.25	3.13	3.13
	ofloxacin	1.56~3.13	1.56	1.56
	ciprofloxacin	0.78~1.56	0.78	0.78
	floxacin	6.25~25	6.25	6.25
<i>Enterococcus faecalis</i> 15 strains	pazufloxacin	1.56~3.13	3.13	3.13
	ofloxacin	1.56~3.13	3.13	3.13
	ciprofloxacin	0.78~3.13	3.13	3.13
	floxacin	3.13~6.25	6.25	6.25

MIC₅₀は0.05 μ g/ml, MIC₉₀は0.2 μ g/mlで最も優れていた。CPF_XのMIC₉₀は0.78 μ g/mlにあり, PZFXについて優れた抗菌力を示し, またOFLX, FLRXに比してPZFXはあきらかに優れていた。S. typhiに対してPZFXのMICは0.025 μ g/mlに集中し, CPF_Xよりやや劣っていたが, OFLX, CPF_Xよりあきらかに優れていた。S. typhi以外の Salmonella spp. に対してPZFXのMICは0.05 μ g/mlに集中し, CPF_Xよりやや劣っていたがOFLX, FLRXよりあき

らかに優れていた。

Shigella spp. に対してPZFXのMICは0.025 μ g/mlから0.1 μ g/mlに分布し, MIC₅₀, MIC₉₀ともに0.05 μ g/mlで, CPF_Xより劣っていたが, OFLX, FLRXよりやや優れていた。E. cloacaeに対してPZFXのMICは0.025 μ g/mlから0.39 μ g/mlに分布し, MIC₅₀は0.05 μ g/ml, MIC₉₀は0.2 μ g/mlで, CPF_Xとほぼ同等であったが, OFLX, FLRXよりあきらかに優れていた。P. vulgarisに対してPZFXのMIC

Table 2. Susceptibility of clinical isolates to pazufloxacin, ofloxacin, ciprofloxacin and fleroxacin. gram-negative bacilli

Inoculum size: 10⁶ cfu/ml

Organism	Drug	MIC (μ g/ml)		
		range	MIC ₅₀	MIC ₉₀
<i>Escherichia coli</i> 15 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 0.39	0.025	0.05
	ofloxacin	0.025 ~ 1.56	0.1	0.2
	ciprofloxacin	\leq 0.0062 ~ 0.39	0.0125	0.05
	floxacin	0.05 ~ 1.56	0.1	0.2
<i>Citrobacter freundii</i> 15 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 0.2	0.025	0.1
	ofloxacin	0.05 ~ 0.78	0.1	0.39
	ciprofloxacin	\leq 0.0062 ~ 0.1	0.0125	0.1
	floxacin	0.05 ~ 0.78	0.1	0.39
<i>Klebsiella pneumoniae</i> 15 strains	pazufloxacin	0.05 ~ 0.39	0.05	0.2
	ofloxacin	0.2 ~ 1.56	0.2	1.56
	ciprofloxacin	0.05 ~ 0.78	0.1	0.78
	floxacin	0.2 ~ 3.13	0.39	1.56
<i>Salmonella typhi</i> 15 strains	pazufloxacin	0.025	0.025	0.025
	ofloxacin	0.025 ~ 0.1	0.05	0.05
	ciprofloxacin	\leq 0.0062 ~ 0.025	0.0125	0.025
	floxacin	0.05 ~ 0.1	0.1	0.1
<i>Salmonella</i> spp. 15 strains	pazufloxacin	0.05	0.05	0.05
	ofloxacin	0.1 ~ 0.2	0.2	0.2
	ciprofloxacin	0.025 ~ 0.05	0.025	0.05
	floxacin	0.2	0.2	0.2
<i>Shigella</i> spp. 15 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 0.1	0.05	0.05
	ofloxacin	0.025 ~ 0.2	0.1	0.2
	ciprofloxacin	\leq 0.0062 ~ 0.05	0.0125	0.025
	floxacin	0.05 ~ 0.2	0.1	0.2
<i>Enterobacter cloacae</i> 15 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 0.39	0.05	0.2
	ofloxacin	0.05 ~ 1.56	0.2	1.56
	ciprofloxacin	0.0125 ~ 0.39	0.05	0.39
	floxacin	0.1 ~ 1.56	0.2	1.56
<i>Proteus vulgaris</i> 15 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 0.78	0.025	0.39
	ofloxacin	0.1 ~ 3.13	0.2	1.56
	ciprofloxacin	0.025 ~ 0.78	0.05	0.39
	floxacin	0.1 ~ 3.13	0.2	1.56
<i>Proteus mirabilis</i> 15 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 0.2	0.05	0.1
	ofloxacin	0.2 ~ 0.39	0.2	0.39
	ciprofloxacin	0.025 ~ 0.39	0.05	0.2
	floxacin	0.2 ~ 0.78	0.2	0.39
<i>Morganella morganii</i> 15 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 0.05	0.025	0.05
	ofloxacin	0.1 ~ 0.2	0.1	0.2
	ciprofloxacin	0.0125 ~ 0.05	0.025	0.05
	floxacin	0.1 ~ 0.2	0.1	0.2
<i>Hafnia alvei</i> 14 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 0.78	0.05	0.05
	ofloxacin	0.05 ~ 1.56	0.1	0.2
	ciprofloxacin	0.0125 ~ 1.56	0.025	0.05
	floxacin	0.05 ~ 3.13	0.1	0.1

は0.025 μ g/mlから0.78 μ g/mlに分布し、CPFXと同等の抗菌力を示し、OFLX, FLRXよりあきらかに優れていた。*P. mirabilis*に対してPZFXのMICは0.025 μ g/mlから0.2 μ g/mlに分布し、MIC₅₀は0.05 μ g/ml, MIC₉₀は0.1 μ g/mlにあり、CPFX, OFLX, FLRXより優れていた。*M. morgani*に対してPZFXのMICは0.025 μ g/mlから0.05 μ g/mlに分布し、MIC₅₀は0.025 μ g/ml, MIC₉₀は0.05 μ g/mlにあり、CPFXとほぼ同様のMIC分布を示し、OFLX, FLRXよりあきらかに優れていた。*H. alvei*に対してPZFXのMICは0.025 μ g/mlから0.78 μ g/mlに分布し、MIC₅₀, MIC₉₀はともに0.025 μ g/mlにあり、CPFXとほぼ同等の抗菌力を示し、OFLX, FLRXよりあきらかに優れていた。*P. aeruginosa*に対してPZFXのMICは0.1 μ g/mlから3.13 μ g/mlに分布し、MIC₅₀は0.39 μ g/ml, MIC₉₀は1.56 μ g/mlで、CPFXのMIC分布とほぼ同様であった。OFLX, FLRXにはMICが12.5 μ g/mlを示す株がみられた。*X. maltophilia*に対してPZFXのMICは0.78 μ g/mlから6.25 μ g/mlに分布し、MIC₅₀は1.56 μ g/ml, MIC₉₀は3.13 μ g/mlにあり、他の3剤より優れていた。*V. parahaemolyticus*に対してPZFXのMICは0.2 μ g/mlから0.39 μ g/mlに分布し、MIC₅₀は0.2 μ g/ml

ml, MIC₉₀は0.39 μ g/mlにあり、他の3剤より優れていた。*V. alginolyticus*に対してPZFXのMICは0.0125 μ g/mlから0.78 μ g/mlに分布し、MIC₅₀は0.39 μ g/ml, MIC₉₀は0.78 μ g/mlにあり、他の3剤より優れていた。*A. hydrophila*に対してPZFXのMICは0.0125 μ g/mlから0.05 μ g/mlに分布し、MIC₅₀は0.0125 μ g/ml, MIC₉₀は0.025 μ g/mlで、CPFXよりやや劣っていたが、OFLX, FLRXより優れていた。*H. influenzae*に対するPZFXのMICは0.025 μ g/mlから1.56 μ g/mlに分布し、MIC₅₀は0.025 μ g/ml, MIC₉₀は0.05 μ g/mlで、CPFXよりやや劣っていたが、OFLX, FLRXより優れていた。*M. catarrhalis*に対してPZFXのMICは0.05 μ g/mlから0.78 μ g/mlに分布し、MIC₅₀, MIC₉₀はともに0.1 μ g/mlにあり、CPFXとほぼ同等の抗菌力を示し、OFLX, FLRXより優れていた。

概要をTable 4およびTable 5に表示した。対象は1992年11月から1993年1月の間に、国立呉病院を受診した呼吸器感染症の4例である。肺炎1例、急性気管支炎3例、全例男性で、年齢は48歳から74歳にわたった。肺炎例には基礎に肺気腫を伴う気管支喘息がある。投与前に喀痰培養を施行し得たのは3例で、肺炎例からS.

Table 3. Susceptibility of clinical isolates to pazufloxacin, ofloxacin, ciprofloxacin and fleroxacin. gram-negative bacilli
Inoculum size: 10⁶ cfu/ml

Organism	Drug	MIC (μ g/ml)		
		range	MIC ₅₀	MIC ₉₀
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> 15 strains	pazufloxacin	0.1 ~ 3.13	0.39	1.56
	ofloxacin	0.39 ~ 12.5	1.56	6.25
	ciprofloxacin	0.2 ~ 6.25	0.39	0.78
	fleroxacin	0.39 ~ 12.5	1.56	6.25
<i>Xanthomonas maltophilia</i> 15 strains	pazufloxacin	0.78 ~ 6.25	1.56	3.13
	ofloxacin	1.56 ~ 6.25	6.25	6.25
	ciprofloxacin	1.56 ~ 12.5	6.25	12.5
	fleroxacin	1.56 ~ 6.25	6.25	6.25
<i>Vibrio parahaemolyticus</i> 15 strains	pazufloxacin	0.2 ~ 0.39	0.2	0.39
	ofloxacin	0.2 ~ 1.56	0.39	1.56
	ciprofloxacin	0.1 ~ 1.56	0.2	0.78
	fleroxacin	0.2 ~ 0.78	0.39	0.78
<i>Vibrio alginolyticus</i> 12 strains	pazufloxacin	0.0125 ~ 0.78	0.39	0.78
	ofloxacin	0.05 ~ 3.13	1.56	1.56
	ciprofloxacin	0.0125 ~ 1.56	0.78	1.56
	fleroxacin	0.05 ~ 1.56	0.78	0.78
<i>Aeromonas hydrophila</i> 15 strains	pazufloxacin	0.0125 ~ 0.05	0.0125	0.025
	ofloxacin	0.025 ~ 0.1	0.05	0.05
	ciprofloxacin	\leq 0.0062 ~ 0.0125	0.0125	0.0125
	fleroxacin	0.025 ~ 0.05	0.05	0.05
<i>Haemophilus influenzae</i> 24 strains	pazufloxacin	0.025 ~ 1.56	0.025	0.05
	ofloxacin	0.025 ~ 0.78	0.05	0.1
	ciprofloxacin	0.0125 ~ 0.2	0.0125	0.05
	fleroxacin	0.05 ~ 3.13	0.1	0.2
<i>Moraxella catarrhalis</i> 13 strains	pazufloxacin	0.05 ~ 0.78	0.1	0.1
	ofloxacin	0.1 ~ 1.56	0.2	0.2
	ciprofloxacin	0.05 ~ 0.78	0.05	0.1
	fleroxacin	0.2 ~ 3.13	0.39	0.39

*pneumoniae*が分離されたが、他の2例からは常在菌のみ検出された。PZFXの1日量として600mg 2例、300mg 2例、1日2ないし3回食後に経口的に投与した。投与日数は3日から13日に、総投与量は1.4gから4.2gにわたった。効果の判定は体温、咳嗽、喀痰量等臨床症状および末梢血中白血球数、CRP値、胸部X線像など検査成績の推移より、主治医が行った判定に従った。肺炎1例、および急性気管支炎3例中1例に無効、他の2例に有効であった。肺炎例より分離された*S. pneumoniae*は投与終了時にも検出された。臨床検査値の推移については3例で検討されたが、いずれの例にも検査値の異常化はみられなかった。

今回新しく開発されたニューキノロン系抗菌薬の一つであるPZFXの試験管内抗菌力と臨床効果について検討した。抗菌力はOFLX、CPFX、FLRXと比較したが、*Staphylococcus* spp. に関してはMRSAを含めてPZFXのMIC分布は4剤中最も低かった。しかし*E. faecalis*を除き他の*Streptococcus*に対する抗菌力はFLRXとともに他剤より劣る傾向がみられた。とくに*S. pneumoniae*に対してMIC₉₀は12.5μg/mlと高値を示した。腸内細菌科の菌種

に対しては、4剤とも強い抗菌力を示した。CPFXの抗菌力が最も優れていたが、PZFXもCPFXとほぼ同等の抗菌力を示した。*K. pneumoniae*に対する抗菌力はPZFXが最も優れていた。その他のグラム陰性菌に対しても*P. aeruginosa*を含めてPZFXの抗菌力は強く、*X. maltophilia*に対しては最も優れていた。*Staphylococcus* spp., *P. aeruginosa*他グラム陽性菌、グラム陰性菌にわたって優れた抗菌力が認められたことから、本剤は日和見感染を含めて広く細菌感染症に効果が期待出来るよう。しかし試験管内の成績ではあるが呼吸器感染症の主要菌種の一つである*S. pneumoniae*³⁾に対する抗菌力がやや弱かったことは、この菌種による疾患に対する効果に不安をおぼえる。臨床効果に関しては4例の呼吸器感染症について検討し、4例中2例で有効、2例で無効であった。例数が少ないため、本剤の有効性、有用性について云々することはできない。しかしながら*S. pneumoniae*が分離された肺炎症例に於いて、臨床効果、細菌学的効果がともに認められなかったのは、試験管内抗菌力が臨床面に反映したものと考えられ、多数の症例について詳しく検討される必要がある。

Table 4. Clinical and bacteriological effects of pazufloxacin

Case no.	Age (yr)	Sex	Body weight (kg)	Diagnosis underlying disease	Administration			Isolated	Efficacy		Adverse reaction
					daily dose (mg)	duration (day)	total dose (g)		clinical	bacteriological	
1	74	M	45	pneumonia bronchial asthma pulmonary emphysema	200 × 3	3	1.4	<i>Streptococcus pneumoniae</i>	poor	unchanged	none
2	63	M		acute bronchitis none	150 × 2	13	3.9	normal flora	good	unknown	none
3	70	M		acute bronchitis none	100 × 3	7	2.1	normal flora	good	unknown	none
4	48	M	50	acute bronchitis none	200 × 3	7	4.2	not tested	poor	unknown	none

Table 5. Laboratory findings before and after pazufloxacin treatment

Case no.	RBC (10 ⁴ /mm ³)	WBC (/mm ³)	EOS (%)	PLT (10 ⁴ /mm ³)	s-GOT (IU/l)	s-GPT (IU/l)	γ-GTP (IU/l)	ALP (KAU)	T-Bil (mg/dl)	BUN (mg/dl)	s-Cr (mg/dl)	CRP (mg/dl)	
1	b	412	15100	0	16.7	7	13	27	5.8	0.9	19.8	0.8	7.0
	a	397	16700	0	23.6	17	32	46	7.9	0.5	9.3	0.7	12.1
2	b	432	10500	1.6	24.2	10	9	19	6.5	0.5	9.1	0.6	0.1
	a	445	8700	NT	22.9	10	10	23	6.6	0.6	13.8	0.7	0.2
3	b	429	8200	0.6	20.8	19	11	12	5.1	0.4	13.6	1.0	0.8
	a	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT
4	b	509	6900	0.6	19.6	12	13	11	4.8	0.8	16.1	0.7	0.1
	a	553	7400	NT	20.2	22	30	12	5.7	0.5	11.5	0.7	0.1

b: before, a: after, NT: not tested

文 献

- 1) 熊澤浄一, 小林宏行: 第42回日本化学療法学会総会, 新薬シンポジウム。T-3761, 福岡, 1994
- 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) 松本慶蔵: 気管支炎, 感染症学 基礎と臨床(上田 泰編) pp. 615~621, メジカルビュー社, 東京, 1982

Studies on antimicrobial activity and clinical effect of pazufloxacin

Osamu Kurimura, Takehiko Hiramoto, Kikuo Nakano and Naoko Tominaga

Department of Internal Medicine, Kure National Hospital

3-1 Aoyama-cho, Kure-shi 737, Japan

Kimitoshi Nozaki

Department of Radiology, Kure National Hospital

Taisuke Maruyama and Jun Furui

Department of Pharmacy, Kure National Hospital

Hideyuki Doi, Michiko Kono, Akiko Shimonaka and Mitsuko Kondo

Clinical Laboratory, Kure National Hospital

Tetsuzo Koda, Hiroshi Ichimura and Ikuo Tamura

Institute of Clinical Research, Kure National Hospital

Bacteriological and clinical studies on pazufloxacin (PZFX), a newly developed quinolone, were carried out and the following results were obtained. The antimicrobial activity of PZFX was measured against 378 clinically isolated strains of 24 species, and compared with those of ofloxacin (OFLX), ciprofloxacin (CPFX) and fleroxacin (FLRX). The activity of PZFX was the most potent against *Staphylococcus* spp., and was slightly inferior to the other drugs against *Streptococcus* spp. The antimicrobial activity of PZFX against gram-negative bacteria was almost equal to that of CPFX and superior to those of OFLX and FLRX. Against *Klebsiella pneumoniae* and *Xanthomonas maltophilia* the activity of PZFX was the most potent.

Daily doses of 300 mg and 600 mg were given orally 2 or 3 times to four patients with respiratory tract infection: one with pneumonia and 3 with acute bronchitis, for 3 to 13 days. Clinical response was good in 2 acute bronchitis cases and poor in the remaining 2 cases. *Streptococcus pneumoniae* isolated from the case with pneumonia was not eradicated. No adverse reactions were observed in any patients.