

抗ヘルペスウイルス外用剤

ゾビラックス®軟膏5%

Zovirax® Ointment 5%

規制区分:

指定医薬品

貯法: 室温保存(30℃以下)

使用期限: 包装に表示

アシクロビル軟膏

承認番号	21100AMZ00437000
薬価収載	1993年11月
販売開始	1994年2月
再審査結果	2003年3月

※【**禁忌**】(次の患者には投与しないこと)
本剤の成分あるいは塩酸バラシクロビルに対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

※1. 組成

本剤は、1g中にアシクロビル50mgを含有する軟膏剤である。

添加物としてマクロゴール300、マクロゴール1500を含有する。

2. 性状

白色の軟膏剤で、においはないか、又はわずかに特異なにおいがある。

【効能・効果】

単純疱疹

【用法・用量】

通常、適量を1日数回塗布する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

- (1) 本剤の投与は、発病初期に近いほど効果が期待できるので、早期に投与を開始することが望ましい。
- (2) 本剤を7日間使用し、改善の兆しが見られないか、あるいは悪化する場合には、他の治療に切り替えること。

※※2. 副作用

承認時までの調査症例301例中12例(3.99%)に臨床検査値の変動を含む副作用が報告された。その主なものは刺激感4例(1.33%)、及び痒痒2例(0.66%)であった。

(承認時)

使用成績調査3816例中、24例(0.63%)に臨床検査値の変動を含む副作用が報告された。その主なものは、接触皮膚炎6例(0.16%)、紅斑性発疹4例(0.10%)、痒痒4例(0.10%)であった。(再審査終了時)

次のような症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

	0.1%~1%未満	0.1%未満	頻度不明 ^(注)
皮膚	投与部位の刺激感、接触皮膚炎、痒痒、紅斑性発疹	投与部位の疼痛、皮膚乾燥	灼熱感、皮膚薄片剥離
過敏症			血管浮腫、蕁麻疹

注)自発報告または海外のみで認められている副作用については頻度不明とした。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[動物実験(ラット)の非標準的手法で器官形成期(妊娠9~11日目)に母動物に腎障害のあらわれる大量(200mg/kg/day以上)を皮下投与した実験では、胎児に頭部及び尾の異常が認められたと報告されている¹⁾。]

4. 小児等への投与

低出生体重児及び新生児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

5. 適用上の注意

投与経路: 眼科用として角膜、結膜に使用しないこと。

【薬物動態】

1. 吸収

健康成人の正常皮膚に本剤100mgを単回塗布又は1日5回5日間連続塗布した場合の血漿中及び尿中アシクロビル濃度は、いずれも検出限界以下(血漿中: <0.007µg/mL, 尿中: <0.11µg/mL)であった²⁾。

2. 代謝・排泄(参考)

ラットの正常皮膚に5-³H-アシクロビル軟膏50mgを単回塗布した後8時間の尿中放射活性回収率は、0.42%で経皮吸収性は低かったが、角質層下の表皮及び真皮中の推定アシクロビル濃度は57µg/cm³に達した。

【臨床成績】

国内延べ55施設において総計270例につき実施された臨床試験の結果^{3)~8)}

- (1) 単純疱疹に対する有効率は85.7%(222/259)であった。また、プラセボを対照とした比較試験によって本剤の有用性が認められた。
- (2) 小児37例における有効率は、97.3%であった。

※※【薬効薬理】

1. 抗ウイルス作用

- (1) アシクロビルのヘルペス群ウイルスに対するin vitroにおけるIC₅₀値は、単純ヘルペスウイルスI型0.01~1.25µg/mL、同II型0.01~3.20µg/mLであった^{9),10)}。
- (2) モルモットの背部に単純ヘルペスウイルスI型を接種し、48時間目より1日4回5日間塗布した実験では、平均病巣コア及びウイルス価の有意な低下がみられた¹¹⁾。

2. 作用機序^{12)~14)}

アシクロビルは単純ヘルペスウイルスI型、同II型感染細胞内に入ると、ウイルス誘導のチミジンキナーゼによりリン酸化され、その後細胞性キナーゼにより活性型のアシクロビル三リン酸(ACV-TP)になる。ACV-TPはウイルスDNAポリメラーゼの基質(dGTPと競合)として作用し、ウイルスDNAに取り込まれ、DNA鎖の伸長停止によりDNA合成を阻害する。アシクロビルは、正常細胞内取り込みは少なく、正常細胞内ではほとんどリン酸化を受けない。また細胞内α-DNAポリメラーゼに対する親和性が低いため、細胞毒性は低いことが認められている(単純ヘルペスウイルスI型: Vero細胞系での治療係数3000)。

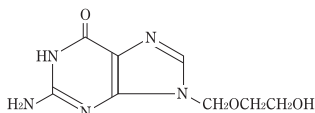
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アシクロビル(Aciclovir)

化学名：9-[(2-hydroxyethoxy)methyl]guanine

分子式：C₈H₁₁N₅O₃

分子量：225.21



性状：白色～微黄白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。ジメチルスルホキシドに溶けやすく、酢酸(100)にやや溶けにくく、水に溶けにくく、メタノール又はエタノール(95)に極めて溶けにくく、アセトン、1-プロパノール、ジエチルエーテル又はヘキサンにほとんど溶けない。希塩酸、希水酸化ナトリウム試液又はアンモニア試液に溶ける。

【包装】

ゾピラックス軟膏5%：チューブ入り5g×1，
チューブ入り5g×10

※※【主要文献】

- 1) Stahlmann, R., et al. : Infection, 15(4), 261(1987)
- 2) 新村真人ほか：臨床医薬, 6(1), 15(1990)
- 3) 新村真人ほか：臨床医薬, 8(2), 281(1992)
- 4) 新村真人ほか：臨床医薬, 8(2), 289(1992)
- 5) 森島恒雄ほか：臨床とウイルス, 20(3), 169(1992)
- 6) 早川謙一：新薬と臨床, 41(3), 483(1992)
- 7) 三島 豊ほか：医学と薬学, 27(2), 465(1992)
- 8) 新村真人ほか：臨床皮膚科, 46(6), 489(1992)
- 9) Al-Hasani, A. M., et al. : J. Antimicrob. Chemother., 18(Suppl. B), 113(1986)
- 10) McLaren, C., et al. : Am. J. Med., 73(1A), 376(1982)
- 11) Park, N. H., et al. : Arch. Dermatol., 116, 672(1980)
- 12) Elion, G. B., et al. : Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 74, 5716(1977)
- 13) Furman, P. A., et al. : J. Virol., 32, 72(1979)
- 14) Furman, P. A., et al. : Antimicrob. Agents Chemother., 20, 518(1981)

※※【資料請求先】

グラクソ・スミスクライン株式会社
〒151-8566 東京都渋谷区千駄ヶ谷4-6-15
カスタマー・ケア・センター
TEL：0120-561-007(9:00~18:00/土日祝日を除く)
FAX：0120-561-047(24時間受付)

 GlaxoSmithKline

製造発売元

グラクソ・スミスクライン株式会社

東京都渋谷区千駄ヶ谷4-6-15

<http://www.glaxosmithkline.co.jp>

6ZQ0124

®登録商標

