

貯法：室温保存
有効期間：3年

抗ヘルペスウイルス外用剤
アシクロビルクリーム

日本標準商品分類番号
87625

ゾビラックスクリーム5%

Zovirax Cream5%



承認番号 21700AMY00103
販売開始 2005年7月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分あるいはパラアシクロビル塩酸塩に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ゾビラックスクリーム5%
有効成分	Ig中 日局アシクロビル50mg
添加剤	プロピレングリコール、白色ワセリン、セトステア リルアルコール、流動パラフィン、自己乳化型モノ ステアリン酸グリセリン、ポリオキシエチレン(196) ポリオキシプロピレン (67) グリコール、ジメチル ポリシロキサン、ラウリル硫酸ナトリウム

3.2 製剤の性状

販売名	ゾビラックスクリーム5%
剤形・性状	白色のクリーム剤

4. 効能又は効果

単純疱疹

6. 用法及び用量

通常、適量を1日回数塗布する。

7. 用法及び用量に関連する注意

- 7.1 本剤の使用は、発病初期に近いほど効果が期待できるので、早期に使用を開始することが望ましい。
- 7.2 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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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使用すること。動物実験（ラット）の妊娠10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⁾。

9.7 小児等

低出生体重児及び新生児を対象とした臨床試験は実施していない。

11. 副作用

次の副作用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。

* 11.2 その他の副作用

	0.1%～1%未満	0.1%未満	頻度不明
皮膚	投与部位の刺激感、接触皮膚炎、掻痒、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			血管性浮腫、蕁麻疹

発現頻度にはゾビラックス軟膏5%に係る使用成績調査の結果を含む。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

本剤は特別に配合された基剤を含有しており、薄めたり、他剤を混合するための基剤として使用してはいけない。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 投与経路

眼科用として角膜、結膜に使用しないこと。

14.3 薬剤交付時の注意

- 14.3.1 治療終了後の未使用分は廃棄させること。
- 14.3.2 本剤の基剤として使用されている油脂性成分は、コンドーム等の避妊用ラテックスゴム製品の品質を劣化させ、破損する可能性があるため、これらとの接触を避けさせること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人の正常皮膚にアシクロビル製剤（ゾビラックス軟膏5%）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アシクロビル濃度は、いずれも検出限界（<0.007μg/mL）以下であった²⁾。

16.3 分布

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。

16.5 排泄

健康成人の正常皮膚にアシクロビル製剤（ゾビラックス軟膏5%）100mgを単回塗布又は1日5回5日間連続塗布した場合の尿中アシクロビル濃度は、いずれも検出限界（<0.11μg/mL）以下であった²⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

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（ゾビラックス軟膏5%）は以下のとおりであった^{3)~8)}。

- (1) 単純疱疹に対する有効率は85.7%（222/259例）であった。また、プラセボを対照とした比較試験におい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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

アシクロビルは、単純ヘルペスウイルスが感染した細胞内に入ると、ウイルス性チミジンキナーゼにより一リン酸化された後、細胞性キナーゼによりリン酸化され、アシクロビル三リン酸 (ACV-TP) となる。ACV-TP は正常基質であるdGTPと競合してウイルスDNAポリメラーゼによりウイルスDNAの3'末端に取り込まれると、ウイルスDNA鎖の伸長を停止させ、ウイルスDNAの複製を阻害する^{9)~12)}。

アシクロビルリン酸化の第一段階である一リン酸化は感染細胞内に存在するウイルス性チミジンキナーゼによるため、ウイルス非感染細胞に対する障害性は低いものと考えられる。

18.2 抗ウイルス作用

18.2.1 アシクロビルは、単純ヘルペスウイルス1型及び2型の*in vitro*における増殖を抑制し、IC₅₀はそれぞれ0.01~1.25µg/mL及び0.01~3.20µg/mLであった^{13),14)}。

18.2.2 モルモットの背部に単純ヘルペスウイルス1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、平均病巣スコア及びウイルス価の有意な低下がみられた¹⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

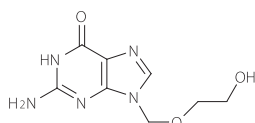
一般的名称：アシクロビル (Aciclovir)

化学名：2-Amino-9-[(2-hydroxyethoxy)methyl]-1,9-dihydro-6H-purin-6-one

分子式：C₈H₁₁N₅O₃

分子量：225.20

化学構造式：



性状：白色～微黄白色の結晶性の粉末である。
水に溶けにくく、エタノール (99.5) に極めて溶けにくい。
0.1mol/L塩酸試液又は希水酸化ナトリウム試液に溶ける。

20. 取扱い上の注意

冷所保存 (15°C以下) しないこと。

22. 包装

2g [1チューブ]

23. 主要文献

- 1) Stahlmann R, et al. : Infection. 1987 ; 15 : 261-262
- 2) 新村真人ほか：臨床医薬. 1990 ; 6 : 15-22
- 3) 新村真人ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 : 281-287
- 4) 新村真人ほか：臨床医薬. 1992 ; 8 : 289-297
- 5) 森島恒雄ほか：臨床とウイルス. 1992 ; 20 : 169-174
- 6) 早川謙一：新薬と臨床. 1992 ; 41 : 483-488
- 7) 三島 豊ほか：医学と薬学. 1992 ; 27 : 465-470
- 8) 新村真人ほか：臨床皮膚科. 1992 ; 46 : 489-498
- 9) St Clair MH, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1980 ; 18 : 741-745
- 10) Furman PA, et al. : J Virol. 1979 ; 32 : 72-77
- 11) Furman PA, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1981 ; 20 : 518-524
- 12) Miller WH, et al. : J Biol Chem. 1980 ; 255 : 7204-7207
- 13) Al-Hasani AM, et al. : J Antimicrob Chemother. 1986 ; 18 (Suppl. B) : 113-119
- 14) McLaren C, et al. : Am J Med. 1982 ; 73 (1A) : 376-379
- 15) Park NH, et al. : Arch Dermatol. 1980 ; 116 : 672-675

24. 文献請求先及び問い合わせ先

グラクソ・スミスクライン株式会社

東京都港区赤坂1-8-1

カスタマー・ケア・センター

TEL : 0120-561-007 (9:00~17:45/土日祝日及び当社休業日を除く)

FAX : 0120-561-047 (24時間受付)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

グラクソ・スミスクライン株式会社

東京都港区赤坂1-8-1

<http://jp.gsk.com>