

外用抗菌剤

ゼビアックス[®]ローション2%

オゼノキサシン

I. 開発の経緯

ゼビアックス[®]ローション2%は、キノロン系合成抗菌化合物オゼノキサシン(図1)を有効成分とするローション製剤として、マルホ株式会社から発売された。

オゼノキサシンは、基本骨格に4-ピリドン-3-カルボン酸を有するキノロン系抗菌薬であり、従来のニューキノロン系抗菌薬に特徴的なキノリン環6位のフッ素原子が水素原子に置換した構造を有している。

マルホ株式会社は、本邦においてオゼノキサシンを有効成分とするローション製剤の開発を進め、国内臨床試験にて尋常性痤瘡および表在性皮膚感染症である毛包炎や毛瘡に対する有効性および安全性を確認した結果、2015年9月に製造販売承認を取得し、2016年1月に外用抗菌剤ゼビアックス[®]ローション2% (以下、ゼビアックスL)として発売するに至った。

II. 製剤の特徴

(1)1日1回、患部に適量を塗布することにより、ざ瘡(化膿性炎症を伴うもの)および表在性皮膚感染症に対して効果を示す。

(2)塗布後に垂れにくい製剤学的特性を有し、指先にとって塗布可能な粘性のあるローション剤である。

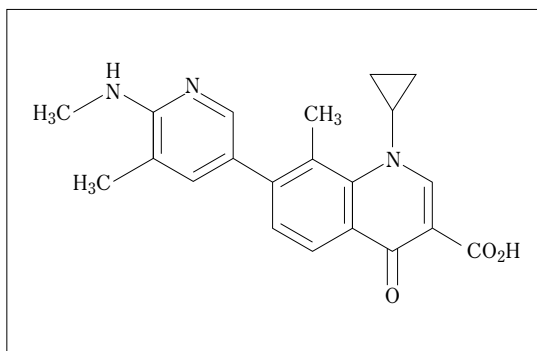
III. 薬理学的特徴

1. 作用機序

細菌のデオキシリボ核酸(DNA)複製に関与するDNAジャイレースやトポイソメラーゼIVに対して選択的に強い阻害作用を示し、抗菌作用を発揮する¹⁾。

2. 抗菌作用

尋常性痤瘡および表在性皮膚感染症の病態に関



アックス群との減少率の中央値の差に対するホッジス・レーマン推定値(95%信頼区間)は0.00%(−7.14~6.35%)で、95%信頼区間下限が非劣性限界値である−10.1%を上回り、ゼビアックス群のナジフロキサシン群に対する非劣性が検証できた(図2)。

2. 表在性皮膚感染症に対する多施設共同試験

毛包炎または毛瘡患者を対象にゼビアックスLを40例に1日1回(夜)、7日間、すべての皮疹(評価部位以外の皮疹を含む)に適量塗布し、有効性および安全性を検討した。最終評価時の有効率(著効、有効の割合)は70%(28/40例)で、皮膚所見合計スコアおよび皮膚所見各スコア(発赤、腫脹、紅色丘疹・膿疱)の平均値はいずれも経時的に減少した。治療開始日に*S. aureus*または*S. epidermidis*が検出された被験者のうち、最終評価時に菌陰性となった被験者は、*S. aureus*では5例中4例(80.0%)、*S. epidermidis*では20例中19例(95.0%)であった。最終評価時に*S. aureus*または*S. epidermidis*がそれぞれ1例ずつに検出されたが、生菌数はそれぞれ減少または不変であった。

V. 安全性

承認時までの臨床試験において、757例中35例(4.6%)に副作用が認められ、主な副作用は、適用部位そう痒感8例(1.1%)、適用部位乾燥8例(1.1%)、

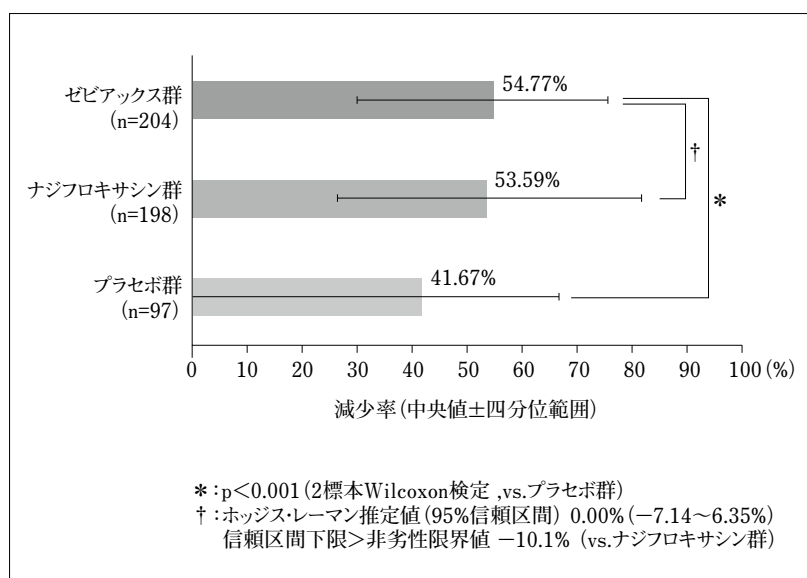


図2 最終評価時の炎症性皮疹数の減少率。

適用部位刺激感7例(0.9%)などであった。

VI. おわりに

以上、ゼビアックスLは、尋常性痤瘡および表在性皮膚感染症に対する有効性と安全性が確認されたことから、本邦での両疾患治療の選択肢の1つとして期待できる薬剤である。今後さらに、有効性および安全性に関する情報を集積し、本剤の尋常性痤瘡および表在性皮膚感染症の治療剤としての位置づけをより明確にする必要がある。

<文 献>

- 1) Lawrence L. E. et al. : J Antimicrob Chemother 48 : 195, 2001.
- 2) ゼビアックスローション2%医薬品インタビューフォーム(2016年6月改訂, 第3版)。
- 3) 川島 真ほか：臨床医薬 31 : 155, 2015.
- 4) 川島 真ほか：臨床医薬 31 : 279, 2015.