

抗真菌剤

ペキロン[®]クリーム 0.5%

Pekiron[®] Cream

アモロルフィン塩酸塩クリーム

貯 法：室温保存
使用期限：外箱、直接の容器に表示

承認番号	21900AMX01732000
薬価収載	2007年12月
販売開始	1994年 2月
再審査結果	2001年 3月

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

販売名	ペキロンクリーム0.5%
有効成分	アモロルフィン塩酸塩
含量(1g中)	5.575mg(アモロルフィンとして5mg)
添加物	ステアリン酸ポリオキシル40、ステアリルアルコール、流動パラフィン、白色ワセリン、カルボキシビニルポリマー、エデト酸ナトリウム水和物、フェノキシエタノール、pH調整剤
剤形	均一なクリーム剤
色調	白色
におい	わずかに特異なにおい

【効能・効果】

下記の皮膚真菌症の治療

- 白癬：足白癬、手白癬、体部白癬、股部白癬
- 皮膚カンジダ症：指間びらん症、間擦疹(乳児寄生菌性紅斑を含む)、爪囲炎
- 癬風

【用法・用量】

1日1回患部に塗布する。

【使用上の注意】

1. 副作用

総症例4,472例中、76例(1.70%)に副作用が認められ、主な副作用は接触皮膚炎34例(0.76%)、発赤11例(0.25%)、癢痒11例(0.25%)であった。

使用成績調査症例で15歳未満の小児使用例175例中、5例(2.86%)に副作用が認められ、副作用は接触皮膚炎3例(1.71%)、紅斑1例(0.57%)、投与部位発赤1例(0.57%)であった。(再審査終了時)

	0.1~5%未満	0.1%未満
皮膚	局所の刺激感、接触皮膚炎、発赤、癢痒、紅斑	糜爛、疼痛

2. 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使用すること。[妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。]

3. 適用上の注意

投与部位：眼科用として角膜、結膜には使用しないこと。

【薬物動態】

1. 吸収・排泄

健康成人被験者5名の背部(15×20cm)にアモロルフィン塩酸塩1%クリーム3g(アモロルフィンとして30mg)を塗布したとき、塗布後48時間までのいずれの測定時においても、すべての被験者で血清、尿中にはアモロルフィンが検出されなかった¹⁾。

2. 皮膚浸透性

(参考)ラットの背部皮膚面にアモロルフィン塩酸塩0.5%クリーム100mgを塗布したとき、塗布後24時間で角質層から基底層に至る表皮及び真皮、皮下組織への浸透、拡散が認められた²⁾。

【臨床成績】

1. 臨床効果

二重盲検比較試験を含む総計1,109例について実施された1日1回塗布による臨床試験の概要は次のとおりである。

疾患名		有効率
白癬	足白癬	79.1% (265/335)
	手白癬	83.3% (50/ 60)
	体部白癬	85.3% (168/197)
	股部白癬	91.9% (136/148)
	計	83.6% (619/740)
皮膚カンジダ症	指間びらん症	92.7% (51/ 55)
	間擦疹	86.2% (94/109)
	乳児寄生菌性紅斑	96.8% (30/ 31)
	爪囲炎	77.8% (28/ 36)
	計	87.9% (203/231)
癬風		92.8% (128/138)

2. 皮膚刺激性

パッチテスト研究班の基準に基づき、健康成人でアモロルフィン塩酸塩0.5%クリーム及び基剤を用いた単純パッチテスト及び光パッチテストの結果では、皮膚刺激性は認められず、再感作試験でも陰性であった³⁾。

【薬効薬理】

1. 抗真菌作用

(1)アモロルフィン塩酸塩は皮膚糸状菌(*Trichophyton*属、*Microsporum*属、*Epidermophyton*属)、酵母類(*Candida*属)、黒色真菌(*Fonsecaea compactum*等)及び癬風菌(*Malassezia furfur*)に強い抗真菌作用を有した⁴⁾。

(2)表在性皮膚真菌症の患者から分離された真菌の臨床分離株に対するMICは次のとおりである^{5)~6)}。

菌種	株数	MIC(μg/mL)
<i>Trichophyton rubrum</i>	112	≤0.0012~ 0.02
<i>Trichophyton mentagrophytes</i>	65	≤0.0012~ 0.08
<i>Microsporum canis</i>	3	0.005 ~ 0.01
<i>Epidermophyton floccosum</i>	2	≤0.0012~ 0.0024
<i>Candida albicans</i>	39	0.01 ~ 10
<i>Malassezia furfur</i>	28	0.31 ~ 1.25

(3)アモロルフィン塩酸塩は*T.mentagrophytes*に対して0.001 μg/mLの濃度で、また*C.albicans*では1 μg/mLの濃度で殺真菌作用を示した⁷⁾。

2. 実験的白癬治療効果

*T.mentagrophytes*によるモルモット実験的白癬モデルにアモロルフィン塩酸塩0.5%クリーム0.3gを感染後5日目から1日1回局所塗布した場合、無処置対照群では症状の増悪が認められるが、処置群では優れた治療効果を示した⁸⁾。

3. 作用持続性

感染防御試験において、モルモットの背部皮膚面にアモロルフィン塩酸塩0.5%クリームを塗布し、24、48、72時間後に *T.mentagrophytes* を接種した実験では、塗布72時間経過後においても優れた作用持続性が認められた⁹⁾。

4. 作用機序

アモロルフィン塩酸塩の作用機序は、エルゴステロール生合成経路上の2つの段階を選択的に阻害することにより、細胞膜の構造、機能を障害し抗真菌活性が発現される¹⁰⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

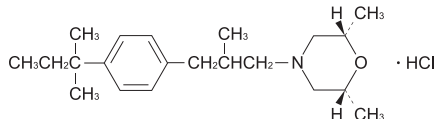
一般名：アモロルフィン塩酸塩(Amorolfine Hydrochloride)

化学名：(±)-cis-2,6-Dimethyl-4-[3-[4-(1,1-dimethylpropyl)phenyl]-2-methylpropyl]morpholine monohydrochloride

分子式：C₂₁H₃₅NO・HCl

分子量：353.98

構造式：



性状：本品は白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。

本品はメタノール又は酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けやすく、水又は無水酢酸に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

本品のエタノール(99.5)溶液(1→20)は旋光性を示さない。

融点：206～211℃

分配係数：

有機溶媒相	水相	分配係数
1-オクタノール	pH3.14 Britton-Robinson緩衝液	18
クロロホルム	pH3.14 Britton-Robinson緩衝液	619

(25℃)

有機溶媒(1-オクタノール又はクロロホルム)－水系(緩衝液 pH5.98、7.00)において、水相に分配しなかった。

【包装】

チューブ：10g×10、10g×50

【主要文献】

- 1) 第I相臨床試験(テイカ製薬社内資料)
- 2) 小室正勝他：薬物動態 9(4), 499(1994)
- 3) 川口新暉他：皮膚 33(5), 586,(1991)
- 4) 山口英世他：Jpn. J. Antibiotics, 44(9), 993(1991)
- 5) 山口英世他：Jpn. J. Antibiotics, 44(9), 1007(1991)
- 6) 山口英世他：Jpn. J. Antibiotics, 44(9), 1013(1991)
- 7) Polak, A., et al.: Recent Trends in the Discovery, Development and Evaluation of Antifungal Agents., J.R. Prous Science Publishers, 555(1987)
- 8) 山口英世他：Jpn. J. Antibiotics, 44(9), 1020(1991)
- 9) 山口英世他：Jpn. J. Antibiotics, 44(9), 1032(1991)
- 10) Polak, A., et al., Sabouraudia, 23, 433(1985)

※※※【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

テイカ製薬株式会社 営業推進グループ 学術課

〒930-0982 富山市荒川一丁目3番27号

TEL 076-431-1717 FAX 076-431-6707

※※

製造販売元

 **テイカ製薬株式会社**

富山市荒川一丁目3番27号