

benzoyl peroxide（JAN）  
**過酸化ベンゾイル**  
尋常性痤瘡治療剤

269

【基本電子添文】ベピオゲル・ローション2025年3月改訂，  
ウォッシュゲル2025年3月作成

【製品】 規制等：〔処方〕 《ベピオゲル2.5% 2014.12.26承認》  
ベピオ *Bepio* ゲル2.5%（15・30g） ウォッシュゲル5%（20g）  
ローション2.5%（15g）（マルホ）

【組成】 〔ゲル〕：2.5%，5%  
〔ローション〕：2.5%

【効能・効果】 尋常性痤瘡  
**効能関連注意**：結節及び嚢腫には，他の適切な処置を行う

【用法・用量】 1日1回，洗顔後塗布。〔5%〕5～10分後に洗い流す

【禁忌】 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【重要な基本的注意】 ①全身性の過敏反応や重度の皮膚刺激症状が認められた場合は中止する ②使用中に皮膚剥脱（鱗屑・落屑），紅斑，刺激感，腫脹等が現れることがある。紅斑や腫脹が顔面全体や頸部にまで及ぶ症例も報告されているので，観察を十分に行い，異常が認められた場合には中止するなど適切な処置を行う ③使用中には日光への曝露を最小限にとどめ，日焼けランプの使用，紫外線療法は避ける 【特定背景関連注意】 ①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 ②授乳婦：治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し，授乳の継続又は中止を検討する。母乳中への移行は不明である ③小児等 ④〔2.5%〕12歳未満の小児等を対象とした臨床試験は実施していない ⑤〔5%〕9歳未満の小児等を対象とした臨床試験は実施していない

【副作用】 次の副作用が現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中止するなど適切な処置を行う

その他の副作用 ①〔2.5%〕

|     | 5%以上                                                   | 5%未満                                                                                        | 頻度不明                                                         |
|-----|--------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------|
| 皮膚  | 皮膚剥脱（鱗屑・落屑）（15.3%），<br>紅斑（12.3%），刺<br>激感（11.4%），乾<br>燥 | 痒疹，接触皮膚炎<br>（アレルギー性接<br>触皮膚炎を含む），<br>皮膚炎，湿疹，蕁<br>麻疹，間擦疹，乾<br>皮症，脂腺機能亢<br>進，腫脹，ピリピ<br>リ感，灼熱感 | 汗疹，違和感，<br>皮脂欠乏症，ほ<br>てり，浮腫，丘<br>疹，疼痛，水<br>疱，びらん，皮<br>脂欠乏性湿疹 |
| その他 |                                                        | 口角炎，眼瞼炎，<br>白血球数減少，白<br>血球数増加，血小<br>板数増加，血中ビ<br>リルビン増加，<br>ALT増加                            | 血中コレステロ<br>ール減少，血中<br>尿素減少，AST<br>増加，呼吸困難<br>感               |

②〔5%〕

|     | 5%以上 | 5%未満                                                     | 頻度不明                                                                  |
|-----|------|----------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------|
| 皮膚  | 紅斑   | 皮膚剥脱（鱗屑・落屑），刺激感，痒疹，皮膚炎，接触皮膚炎（アレルギー性接触皮膚炎を含む），びらん，皮脂欠乏性湿疹 | 乾燥，湿疹，蕁麻疹，間擦疹，乾皮症，脂腺機能亢進，腫脹，ピリピリ感，灼熱感，汗疹，違和感，皮脂欠乏症，ほてり，浮腫，丘疹，疼痛，水疱    |
| その他 |      | AST増加                                                    | 口角炎，眼瞼炎，白血球数減少，白血球数増加，血小板数増加，血中ビリルビン増加，ALT増加，血中コレステロール減少，血中尿素減少，呼吸困難感 |

【適用上の注意】 薬剤使用時の注意 ①④〔2.5%〕本剤の有効成分濃度及び用法・用量は，5%製剤と異なることに注意する ⑤〔5%〕本剤の有効成分濃度及び用法・用量は，2.5%製剤と異なることに注意する ②他の外用剤と併用する場合は，皮膚刺激症状が増すおそれがあるため注意する ③漂白作用があるので，髪，衣料等に付着しないように注意する ④外用としてのみ使用する ⑤切り傷，すり傷，湿疹のある皮膚への塗布は避ける ⑥眼，口唇，鼻翼及び粘膜を避けながら，患部に塗布する。眼の周囲に使用する場合には眼に入らないように注意する。万一，眼に入った場合は直ちに水で洗い流す 【保存等】 〔2.5%〕凍結を避け，25℃以下に保存，〔5%〕室温保存。有効期間：〔ゲル〕24ヵ月，〔ローション〕22ヵ月

【薬物動態】（\*：承認用法・用量は，1日1回，洗顔後塗布。〔5%〕5～10分後に洗い流す） ①血中濃度 ②〔2.5%〕尋常性痤瘡患者の顔面全体（眼囲及び口唇を除く）に本剤（ゲル）又はプラセボを各群9例に約0.5g塗布時\*の代謝物である安息香酸及び馬尿酸の薬物動態学的パラメータは次のとおり

|      |          | C <sub>max</sub><br>(μg/mL) | t <sub>max</sub><br>(h) | AUC <sub>0-t</sub><br>(μg・h/mL) |
|------|----------|-----------------------------|-------------------------|---------------------------------|
| 安息香酸 | 本剤（9例）   | 0.0197 ±<br>0.0063          | 2.6 ± 2.3               | 0.137 ±<br>0.122                |
|      | プラセボ（6例） | 0.0189 ±<br>0.0067          | 6.9 ± 8.7               | 0.072 ±<br>0.081                |
| 馬尿酸  | 本剤（7例）   | 0.2617 ±<br>0.1420          | 5.0 ± 9.1               | 2.724 ±<br>1.936                |
|      | プラセボ（8例） | 0.1969 ±<br>0.1370          | 0.6 ± 1.4               | 0.639 ±<br>1.206                |

定量下限未満（安息香酸：<0.01 μg/mL，馬尿酸：<0.1 μg/mL）は除く  
③〔5%〕尋常性痤瘡患者（男性）に本剤又はプラセボ（各8例）を顔面全体（眼囲及び口唇を除く）に1.0g，胸部に3.5g，背部に5.0g塗布\*し，10分後に洗い流したときの代謝物である安息香酸及び馬尿酸の薬物動態学的パラメータは次のとおり

|      |        | C <sub>max</sub><br>(μg/mL) | t <sub>max</sub><br>(h) | AUC <sub>0-t</sub><br>(μg・h/mL) |
|------|--------|-----------------------------|-------------------------|---------------------------------|
| 安息香酸 | 本剤（8例） | 0.02644 ±<br>0.00761        | 1.44 ± 1.21             | 0.188 ±<br>0.093                |

|     |          |                   |              |               |
|-----|----------|-------------------|--------------|---------------|
|     | プラセボ（6例） | 0.02178 ± 0.01393 | 8.37 ± 8.65  | 0.127 ± 0.201 |
| 馬尿酸 | 本剤（8例）   | 0.6473 ± 0.1343   | 19.50 ± 6.21 | 6.924 ± 2.277 |
|     | プラセボ（8例） | 0.7353 ± 0.3345   | 24.00 ± 0.00 | 4.955 ± 2.407 |

定量下限未満（安息香酸：＜0.01 μg/mL，馬尿酸：＜0.1 μg/mL）は除く

②〔2.5%〕吸収：ヒト正常皮膚を用いて<sup>14</sup>C-標識ゲルの皮膚透過性を検討した結果，24時間塗布時の累積透過量及び皮膚中放射能量を合わせた吸収率は塗布量の10%程度（*in vitro*） ③分布：ヒト正常皮膚に経皮投与時の皮膚内分布を検討した結果，表皮及び真皮中には過酸化ベンゾイル及び安息香酸が検出されたが，透過後はすべて安息香酸であることを確認（*in vitro*） ④代謝：塗布後，生体内（皮膚中及び血漿中）で速やかに安息香酸に変換される。安息香酸は，更に馬尿酸へ代謝される（*in vitro*） ⑤排泄：安息香酸は，ヒト及び主要な動物種において，ほぼすべてが尿中に排泄 【臨床成績】 有効性及び安全性に関する試験 ①〔2.5%ゲル〕a国内第Ⅱ/Ⅲ相臨床試験：顔面に尋常性痤瘡を有する患者404例を対象として，本剤（ゲル）又はプラセボを12週間全顔に塗布する二重盲検比較試験を実施 ⑦主要評価項目である最終評価時の炎症性皮疹数の減少率において，本剤群はプラセボ群と比較し統計的有意差（p＜0.001）が認められた

|               | 本剤<br>(203例) | プラセボ<br>(201例) | 差※（差の95%<br>信頼区間）      |
|---------------|--------------|----------------|------------------------|
| 炎症性皮疹数減少率（%）  | 72.73        | 41.67          | 25.72<br>(19.23～32.89) |
| 非炎症性皮疹数減少率（%） | 56.52        | 21.88          | 29.48<br>(21.38～37.59) |
| 総皮疹数減少率（%）    | 62.22        | 28.57          | 29.44<br>(22.73～36.46) |

中央値。※：ホッジス・レーマンの推定値

①副作用発現頻度は本剤群で37.3%（76/204例）。主な副作用は皮膚剥脱19.1%（39/204例），適用部位紅斑13.7%（28/204例），適用部位刺激感8.3%（17/204例），適用部位瘙痒感3.4%（7/204例）及び接触皮膚炎2.5%（5/204例） ⑥国内第Ⅲ相臨床試験：顔面に尋常性痤瘡を有する患者231例を対象として，本剤（ゲル）を52週間全顔に塗布する長期投与試験（非盲検試験）を実施 ⑦総皮疹数は12週後まで経時的に減少し，その後も増加することなく最終評価時まで推移 ①副作用発現頻度は49.4%（114/231例）。主な副作用は適用部位刺激感19.0%（44/231例），皮膚剥脱18.2%（42/231例），適用部位紅斑13.9%（32/231例），適用部位乾燥13.0%（30/231例），適用部位瘙痒感6.1%（14/231例），接触皮膚炎3.0%（7/231例） ②〔2.5%ローション〕国内第Ⅲ相臨床試験：顔面に尋常性痤瘡を有する患者222例を対象として，本剤（ローション）又はプラセボを12週間全顔に塗布する二重盲検比較試験を実施 ①a主要評価項目である治療開始12週後の総皮疹数の減少率において，本剤群はプラセボ群と比較し統計的有意差（p＜0.0001）が認められた

|  | 本剤<br>(109例) | プラセボ<br>(113例) | 差（差の95%<br>信頼区間） |
|--|--------------|----------------|------------------|
|--|--------------|----------------|------------------|

|               |       |       |                        |
|---------------|-------|-------|------------------------|
| 総皮疹数減少率（%）    | 63.02 | 26.54 | 36.48<br>(26.28～46.68) |
| 炎症性皮疹数減少率（%）  | 71.35 | 36.72 | 34.63<br>(24.84～44.42) |
| 非炎症性皮疹数減少率（%） | 57.04 | 22.14 | 34.90<br>(22.89～46.92) |

混合効果モデル（MMRM：mixed effects model for repeated measures）による最小二乗平均

⑥副作用発現頻度は本剤群で11.9%（13/109例）。副作用は適用部位紅斑4.6%（5/109例），適用部位瘙痒感，適用部位乾燥2.8%（3/109例），接触皮膚炎1.8%（2/109例），適用部位刺激感，皮膚剥脱0.9%（1/109例） ③〔5%ゲル〕国内第Ⅲ相臨床試験：顔面に尋常性痤瘡を有する患者248例を対象に，本剤又はプラセボを1日1回12週間，顔面全体（眼囲及び口唇を除く）に適量塗布し，5～10分後に洗い流す二重盲検比較試験を実施 ①a主要評価項目である治療開始12週後の総皮疹数の減少率※<sup>1</sup>において，本剤群とプラセボ群の間には統計的な有意差が認められた

|               | 本剤<br>(120例) | プラセボ<br>(128例) | 群間差<br>(本剤群-プラセボ群)                              |
|---------------|--------------|----------------|-------------------------------------------------|
| 総皮疹数減少率（%）    | 55.90        | 43.85          | 12.05<br>[3.70～20.39]<br>p=0.0048※ <sup>2</sup> |
| 炎症性皮疹数減少率（%）  | 61.84        | 47.29          | 14.55<br>[4.21～24.89]                           |
| 非炎症性皮疹数減少率（%） | 52.87        | 41.66          | 11.21<br>[1.94～20.47]                           |

最小二乗平均値，群間差は最小二乗平均値 [95%信頼区間]。

※<sup>1</sup>：投与群，評価時点及び交互作用（投与群と評価時点）を説明変数とし，被験者内誤差の分散共分散構造に無構造を仮定したmixed-effects model for repeated measuresにより算出。※<sup>2</sup>：有意水準両側5%

⑥副作用発現頻度は本剤群で15.8%（19/120例）。主な副作用は，本剤群で適用部位紅斑5.8%（7/120例），適用部位刺激感4.2%（5/120例） 【薬効薬理】 ①作用機序 ①a抗菌作用：本剤は強力な酸化剤で，分解により生じたフリーラジカル（酸化ベンゾイルラジカルやフェニルラジカルなど）が細菌の膜構造，DNA・代謝などを直接障害して，アクネ菌や黄色ブドウ球菌などに対する抗菌作用を示す ①b角層剥離作用：閉塞した毛漏斗部において，角層中デスモソームの増加を是正することにより，角質細胞同士の結合が弛み，角層剥離を促進 ②抗菌作用：尋常性痤瘡の病態に関与しているアクネ菌，表皮ブドウ球菌及び黄色ブドウ球菌に対して抗菌活性を示した（*in vitro*） ③角層剥離作用 ①a実験的ウサギ面皰モデルで，角質細胞同士の結合を弛めて角層剥離を促し，毛漏斗部の角層肥厚を改善 ①b〔5%〕ウサギで，本剤は短時間（5分間）の反復塗布により，角層剥離作用を示した

【性状】 過酸化ベンゾイルは白色の粉末である。クロロホルムに溶けやすく，ジエチルエーテルに溶けにくく，エタノール（99.5）に極めて溶けにくく，水にほとんど溶けない