

(新聞発表用)

輸 入

1	販 売 名	エムトリバカプセル 200mg
2	一 般 名	エムトリシタビン
3	申 請 者 名	日本たばこ産業株式会社
4	成 分 ・ 分 量	1 カプセル中にエムトリシタビン 200mg を含有する。
5	用 法 ・ 用 量	通常, 成人にはエムトリシタビンとして 1 回 200mg を 1 日 1 回経口投与する。なお, 投与に際しては必ず他の抗 HIV 薬と併用すること。
6	効 能 ・ 効 果	HIV-1 感染症
7	備 考	添付文書(案)を別紙として添付 本剤は核酸系逆転写酵素阻害剤である。 輸入先国名及び製造業社名: 米国 ギリアド・サイエンシズ社

2005年3月(案)

抗ウイルス化学療法剤

日本標準商品分類番号

87625

規制区分  
未

**エムトリバ®カプセル 200mg**  
**Emtriva® Capsules 200mg**  
 (エムトリシタビン)

承認番号	未
薬価収載年月	未
販売開始年月	未
国際誕生年月	2003年7月

貯法等：気密容器，室温保存

使用期限：2年（外箱及びラベルに表示の使用期限を参照のこと）


## 【警告】

B型慢性肝炎を合併している患者では，本剤の投与中止により，B型慢性肝炎が再燃するおそれがあるので，本剤の投与を中断する場合には十分注意すること。特に非代償性の場合，重症化するおそれがあるので注意すること。

## 【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】

有効成分 (1カプセル中)	エムトリシタビンとして 200 mg
添加物	クロスポビドン，ステアリン酸マグネシウム，セルロース，ポビドン カプセル本体にゼラチン，酸化チタン，青色2号
性状・剤形	キャップが青色不透明，ボディが白色不透明の1号硬カプセル剤
外形	
サイズ	長径約 19.3 mm，外径約 6.9 mm，重量 約 480 mg
識別コード	GILEAD-200mg

## 【効能・効果】

HIV-1 感染症

## 【用法・用量】

通常、成人にはエムトリシタビンとして1回 200 mg を1日1回経口投与する。なお、投与に際しては必ず他の抗 HIV 薬と併用すること。

### <用法・用量に関連する使用上の注意>

腎機能障害のある患者では本剤の血中濃度が増加するので、腎機能の低下に応じて、次の投与方法を目安とする（外国人における薬物動態試験成績による）。

クレアチンクリアランス (CLcr)	投与方法
50 mL/min 以上	本剤1カプセルを1日1回投与
30～49 mL/min	本剤1カプセルを2日間に1回投与
15～29 mL/min	本剤1カプセルを3日間に1回投与
15 mL/min 未満	本剤1カプセルを4日間に1回投与
血液透析患者	本剤1カプセルを4日間に1回投与 透析日に投与する場合は、透析後投与

## 【使用上の注意】

### 1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

腎障害のある患者[中等度及び重篤な腎機能障害のある患者では、本剤の血中濃度が増加する（「用法・用量に関連する使用上の注意」及び「薬物動態」の項参照）。]

### 2. 重要な基本的注意

(1) 本剤の使用に際しては、患者又はそれに代わる適切な者に次の事項についてよく説明し同意を得た後、使用すること。

- 1) 本剤は HIV 感染症の根治療法薬ではないことから、日和見感染症を含む HIV 感染症の進展に伴う疾病を発症し続ける可能性があるため、本剤投与開始後の身体状況の変化については全て担当医に報告すること。
- 2) 本剤の長期投与による影響については現在のところ不明であること。
- 3) 本剤による治療が、性的接触又は血液汚染等による他者への HIV 感染の危険性を低下させるかどうかは証明されていないこと。

(2) 本剤を含む核酸系逆転写酵素阻害薬の単独投与又はこれらの併用療法により、重篤な乳酸アシドーシス及び脂肪沈着による重度の肝腫大（脂肪肝）が、女性に多く報告されているので、乳酸アシドーシス又は肝細胞毒性が疑われる臨床症状又は検査値異常（アミノトランスフェラーゼの急激な上昇等）が認められた場合には、本剤の投与を一時中止すること。特に肝疾患の危険因子を有する患者においては注意すること。

(3) 本剤を含む抗 HIV 薬の多剤併用療法を行った患者で、免疫再構築症候群が報告されている。投与開始後、免疫機能が回復し、症候性のみならず無症候性日和見感染（マイコプラズマ、サイトメガロウイルス、ニューモシスチス等によるも

の)等に対する炎症反応が発現することがあるので、これらの炎症性の症状を評価し、必要時には適切な治療を考慮すること。

- (4) 核酸系逆転写酵素阻害薬 (NRTI) 3 剤のみを用いる一部の治療は、NRTI 2 剤に非核酸系逆転写酵素阻害薬又は HIV-1 プロテアーゼ阻害薬を併用する 3 剤併用療法と比べて、概して効果が低いことが報告されているので、NRTI 3 剤のみによる治療で効果が認められない場合には他の組み合わせを考慮すること。
- (5) 本剤の薬剤耐性を含むウイルス学的特性はラミブジンと類似しているため、本剤とラミブジンを含む製剤を併用しないこと。また、ラミブジンを含む抗 HIV 療法においてウイルス学的効果が得られず、HIV-1 逆転写酵素遺伝子の M184V/I 変異が認められた場合、ラミブジンを本剤に変更することのみで効果の改善は期待できない。
- (6) アジア系人種における本剤の薬物動態は十分検討されていないが、少数例の健康成人及び B 型慢性肝炎のアジア系人種において、C<sub>max</sub> の上昇を示唆する成績が得られているので、HBV 感染症合併患者を含め、副作用の発現に注意すること。
- (7) 抗 HIV 薬の使用により、体脂肪の再分布/蓄積があらわれることがあるので、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。
- (8) 本剤の外国での臨床試験において皮膚変色が発現し、その発現頻度は有色人種に高いことが示唆されている。その原因は現在のところ不明であり、外国の規制当局からの指示により、発現機序等について検討中である。

### 3. 副作用

外国における抗レトロウイルス薬による治療経験患者及び未治療患者を対象とした 2 つの比較試験において、本剤投与群の 580 例中 303 例 (52.2%) に副作用が認められた。主な副作用は下痢、浮動性めまい、悪心、腹痛、頭痛、不眠症、無力症等であった。

#### (1) 重大な副作用

##### 1) 乳酸アシドーシス (頻度不明<sup>注)</sup>)

乳酸アシドーシスがあらわれることがあるので、このような場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

注) 外国における集計対象外の臨床試験にて報告された副作用

#### (2) その他の副作用

下記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は適切な処置を行うこと。

種類 \ 頻度	2%以上	2%未満
胃腸障害	下痢(10.7%), 悪心(8.1%), 腹痛(6.0%), 消化不良(2.9%), 嘔吐(2.2%)	鼓腸, 便秘, 胃炎, 腹部膨満, 口臭, 口内乾燥, 胃腸障害
全身障害及び投与局所様態	無力症(4.8%), 疼痛(2.1%)	
神経系障害	浮動性めまい(9.3%), 頭痛(5.3%), 不眠症(5.0%), 異常な夢(3.1%), 錯覚(2.2%)	前庭障害, ニューロパシー, 傾眠, 末梢性ニューロパシー, 異常思考
精神障害		神経過敏, 不安, うつ病, リビド一減退, 感情不安定
皮膚及び皮下組織障害	発疹(3.8%)	皮膚変色, そう痒症, 皮膚乾燥, 多汗症, 脂漏, 帯状疱疹
代謝及び栄養障害	高脂血症(2.8%)	食欲不振, 後天性リポジストロフィー, 高コレステロール血症, 高血糖
筋骨格系及び結合組織障害		筋痛, 関節痛, 背部痛
臨床検査	AST(GOT)増加(3.1%), ALT(GPT)増加(2.9%), 血中アミラーゼ増加(2.4%), CK(CPK)増加(2.2%)	Al-P 増加
その他	白血球減少症(3.6%)	血管拡張, 感染, インフルエンザ症候群

#### 4. 高齢者への投与

本剤の高齢者における薬物動態は検討されていない。本剤の投与に際しては、患者の肝、腎及び心機能の低下、合併症、併用薬等を十分考慮すること。

#### 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立されていない。]
- (2) 本剤服用中は授乳を中止させること。[HIV 感染女性患者は、乳児の HIV 感染を避けるため、乳児に母乳を与えないことが望ましい。]

#### 6. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない（18 歳未満の患者に対する使用経験がない）。

#### 7. 過量投与

本剤を過量投与した症例は報告されておらず、過量投与時に特有の徴候や症状は不明である。過量投与時には、本剤の副作用（「副作用」の項参照）について十分に観察を行い、必要に応じ一般的な対症療法を行うこと。本剤は血液透析により一部除去される（「薬物動態」の「5.腎不全患者」の項参照）。

## 【薬物動態】

### <外国人における成績>

#### 1. 吸収

HIV 感染患者 20 例に本剤 200 mg を 1 日 1 回反復投与した後の、定常状態のエムトリシタビンの平均血漿中濃度推移を図 1 に示す。

血漿中濃度は経口投与後 1~2 時間で  $C_{max}$  に達した。反復投与後の定常状態下での  $C_{max}$  (平均±標準偏差) は  $1.8 \pm 0.72 \mu\text{g/mL}$  で、24 時間後の AUC (平均±標準偏差) は  $10.0 \pm 3.12 \mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$  であった。

また、投与から 24 時間後の血漿中濃度トラフ値は平均  $0.09 \mu\text{g/mL}$  で、生物学的利用率の中央値は 92% (範囲 83.1~106.4%) であった。

なお、本剤の反復投与時の薬物動態は、25~200 mg の用量範囲で用量比例性が認められた。

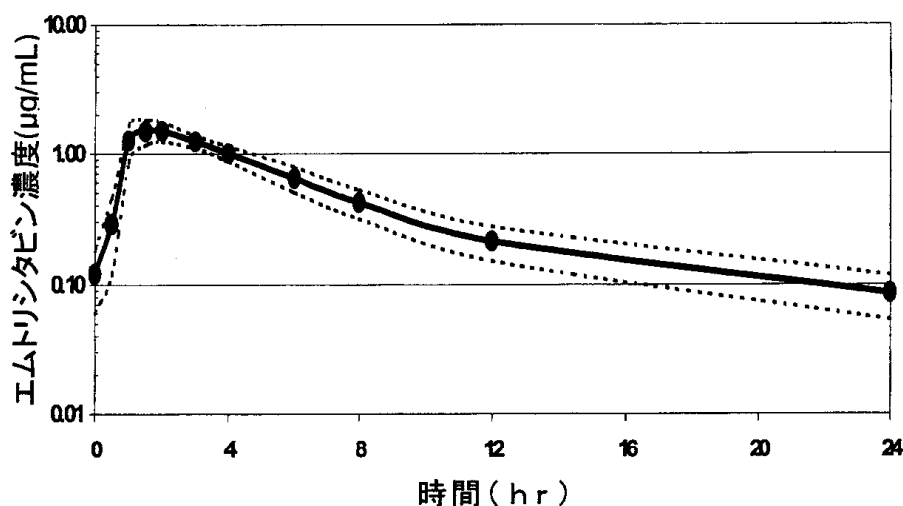


図 1. 本剤 200 mg を 1 日 1 回反復投与した後の定常状態でのエムトリシタビンの血漿中濃度推移 (平均±95%信頼区間, HIV 感染患者 20 例)

#### 2. 食事の影響

本剤を食事 (約 1,000 kcal の高脂肪食) と共に服用した時、 $C_{max}$  は 29%低下したが、AUC は影響を受けなかった。

#### 3. 分布

*In vitro* におけるエムトリシタビンのヒト血漿タンパク結合率は、0.02~200  $\mu\text{g/mL}$  の濃度範囲で 4%未満であった。最高血漿中濃度において、血中濃度に対する血漿中濃度の比の平均は 1.0、血漿中濃度に対する精液中濃度の比の平均は 4.0 であった。

#### 4. 代謝及び消失

*In vitro* 試験でエムトリシタピンはヒト CYP450 酵素を阻害しないことが示された。<sup>14</sup>C-エムトリシタピン投与後、投与量は尿中（86%）と糞便中（14%）に完全に回収された。投与量の 13%が 3 種の推定代謝物として尿中に回収された。エムトリシタピンの代謝は、チオール部分の酸化による 3'-スルホキシドジアステレオマーの生成（投与量の 9%）とグルクロン酸抱合による 2'-O-グルクロニドの生成（投与量の 4%）から成る。その他の代謝物は確認されていない。

エムトリシタピンの血漿中半減期は約 10 時間である。腎クリアランスが推定クレアチニンクリアランスを上回ったことから、糸球体濾過と尿細管への能動輸送の両方による排泄が示唆された。そのため同じく腎より排泄される他の化合物と競合する可能性がある。

#### 5. 腎不全患者

クレアチニンクリアランス (CLcr) 50 mL/min 未満の患者あるいは透析を必要とする末期腎不全患者では、腎クリアランスの低下によりエムトリシタピンの C<sub>max</sub> 及び AUC が増加した (表 1)。

表 1. 腎障害を有する患者における本剤の単回投与後の薬物動態パラメータ

CLcr (mL/min)	>80 (N=6)	50-80 (N=6)	30-49 (N=6)	<30 (N=5)	透析を必要とする末期腎不全患者 <30 (N=5)
投与前の CLcr 平均値 (mL/min)	107±21	59.8±6.5	40.9±5.1	22.9±5.3	8.8±1.4
C <sub>max</sub> (µg/mL)	2.2±0.6	3.8±0.9	3.2±0.6	2.8±0.7	2.8±0.5
AUC (µg-hr/mL)	11.8±2.9	19.9±1.1	25.1±5.7	33.7±2.1	53.2±9.9
CL/F (mL/min)	302±94	168±10	138±28	99±6	64±12
CL <sub>renal</sub> (mL/min)	213.3±89.0	121.4±39.0	68.6±32.1	29.5±11.4	—

平均値±標準偏差  
算出不能：—

また、エムトリシタピンの投与から 1.5 時間以内に血液透析を開始し、3 時間透析することによりエムトリシタピンの投与量の約 30%が除去された（血液流量 400 mL/min, 透析液流量 600 mL/min）。なお、腹膜透析によりエムトリシタピンが除去できるか否かは不明である。

## 6. 薬物相互作用

臨床使用量で血漿中に認められた濃度の14倍まで濃度を増加させても、エムトリシタビンはヒト CYP450 分子種 (CYP1A2, CYP2A6, CYP2B6, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6 及び CYP3A4) による *in vitro* 薬物代謝を阻害しなかった。エムトリシタビンはグルクロン酸抱合を担う酵素 (ウリジン-5'-ニリン酸グルクロニルトランスフェラーゼ) を阻害しなかった。これらの *in vitro* 実験結果及び確認されているエムトリシタビンの排泄経路を考慮すると、CYP450 を介するエムトリシタビンと他の薬剤との相互作用が生じる可能性は低い。

健康成人志願者を対象にエムトリシタビンとフマル酸テノホビル ジソプロキシル、インジナビル、サニルブジン及びジドブジンとの併用における薬物動態の評価を行った。併用薬がエムトリシタビンの薬物動態に及ぼす影響及びエムトリシタビンが併用薬の薬物動態に及ぼす影響について表 2, 3 に示す。

表 2. 併用薬投与時のエムトリシタビンの薬物動態パラメータ変化率

併用薬	併用薬の用量	エムトリシタビンの用量	例数	エムトリシタビンの薬物動態パラメータの変化率 (%) (90%信頼区間)		
				Cmax	AUC	Cmin
フマル酸テノホビル ジソプロキシル	300 mg 1日1回 7日間	200 mg 1日1回 7日間	17	⇔	⇔	↑20 (↑12~↑29)
インジナビル	800 mg 1回	200 mg 1回	12	⇔	⇔	—
サニルブジン	40 mg 1回	200 mg 1回	6	⇔	⇔	—
ジドブジン	300 mg 1日2回 7日間	200 mg 1日1回 7日間	27	⇔	⇔	⇔

増加: ↑ 不変: ⇔ 算出不能: —

表 3. エムトリシタビン投与時の併用薬の薬物動態パラメータ変化率

併用薬	併用薬の用量	エムトリシタビンの用量	例数	併用薬の薬物動態パラメータの変化率 (%) (90%信頼区間)		
				Cmax	AUC	Cmin
フマル酸テノホビル ジソプロキシル	300 mg 1日1回 7日間	200 mg 1日1回 7日間	17	⇔	⇔	⇔
インジナビル	800 mg 1回	200 mg 1回	12	⇔	⇔	—
サニルブジン	40 mg 1回	200 mg 1回	6	⇔	⇔	—
ジドブジン	300 mg 1日2回 7日間	200 mg 1日1回 7日間	27	↑17 (↑0~↑38)	↑13 (↑5~↑20)	⇔

増加: ↑ 不変: ⇔ 算出不能: —



## 【臨床成績】

### <外国人における成績>

#### 1. 301A 試験:ジダノシン+エファビレンツ治療に本剤又はサニルブジンを併用した比較試験<sup>1)</sup>

抗レトロウイルス薬による治療を未経験の患者 571 例を対象に、本剤 (200 mg 1 日 1 回投与) と共にジダノシン及びエファビレンツを併用する療法と、サニルブジンと共にジダノシン及びエファビレンツを併用する療法とを 48 週間投与の多施設二重盲検試験で比較した。

患者の平均年齢は 36 歳 (範囲 18~69 歳), 85% が男性であり, 白人は 52%, アフリカ系アメリカ人は 16%, ヒスパニックは 26% であった。試験開始時の平均 CD4 リンパ球数は 318 cells/mm<sup>3</sup> (範囲 5~1,317 cells/mm<sup>3</sup>), 血漿中 HIV-1 RNA 量の中央値は 4.9 log<sub>10</sub> copies/mL (範囲 2.6~7.0 log<sub>10</sub> copies/mL), 血漿中 HIV-1 RNA 量が >100,000 copies/mL の患者は 38%, CD4 リンパ球数が <200 cells/mm<sup>3</sup> の患者は 31% であった。試験開始後 48 週の結果を表 4 に示す。

表 4. 301A 試験臨床試験結果 (48 週評価)

結果		本剤投与群 (N=286) (%)	サニルブジン投与群 (N=285) (%)
有効例 <sup>注 1)</sup>	HIV-1 RNA 量 < 400 copies/mL	81	68
	HIV-1 RNA 量 < 50 copies/mL	78	59
無効例 <sup>注 2)</sup>		3	11
死亡例		0	<1
有害事象による中止例		7	13
その他の理由による中止例 <sup>注 3)</sup>		9	8

注 1) 血漿中 HIV-1 RNA 量が <400 copies/mL (又は <50 copies/mL) に至り試験開始後 48 週まで維持していた症例

注 2) 血漿中 HIV-1 RNA 量が <400 copies/mL に至らなかった症例及び至った後に再上昇した症例

注 3) 患者追跡不能例, 患者申出による脱落例, 服薬不良例, プロトコール不遵守例など

試験開始後 48 週の CD4 リンパ球数の平均増加量は, 本剤投与群で 168 cells/mm<sup>3</sup>, サニルブジン投与群で 134 cells/mm<sup>3</sup> であった。また, 試験開始後 48 週までに CDC 分類 C 症状を新たに発現した症例は, 本剤投与群で 4 例 (1.4%), サニルブジン投与群で 7 例 (2.5%) であった。

2. 303 試験：安定した基礎療法（Stable Background Therapy）に本剤又はラミブジンを併用した比較試験<sup>2)</sup>

試験参加前にラミブジンを含む抗レトロウイルス薬の3剤併用療法（ラミブジン＋サニルブジン又はジドブジン＋プロテアーゼ阻害薬又は非核酸系逆転写酵素阻害薬）を12週間以上受けており、血漿中 HIV-1 RNA 量が <400 copies/mL の患者 440 例を対象に、ラミブジン（150 mg 1日2回投与）を継続する投与群、又はラミブジンを本剤（200 mg 1日1回投与）へ変更する投与群のいずれかに1:2の比率で患者を無作為に割り付けて、48週間投与の多施設非盲検試験で比較した。なお、すべての患者が各自の安定した基礎療法（Stable Background Therapy：サニルブジン又はジドブジン＋プロテアーゼ阻害薬又は非核酸系逆転写酵素阻害薬）を継続した。

患者の平均年齢は42歳（範囲22～80歳）、86%が男性であり、白人は64%、アフリカ系アメリカ人は21%、ヒスパニックは13%であった。試験開始時の平均 CD4 リンパ球数は 527 cells/mm<sup>3</sup>（範囲 37～1,909 cells/mm<sup>3</sup>）、血漿中 HIV-1 RNA 量の中央値は 1.7 log<sub>10</sub> copies/mL（範囲 1.7～4.0 log<sub>10</sub> copies/mL）であった。抗レトロウイルス薬による前治療の継続期間の中央値は 27.6 カ月であった。試験開始後 48 週の結果を表 5 に示す。

表 5. 303 試験臨床試験結果（48 週評価）

結果		本剤投与群 (N=294) (%)	ラミブジン投与群 (N=146) (%)
有効例 <sup>注1)</sup>	HIV-1 RNA 量 <400 copies/mL	77	82
	HIV-1 RNA 量 <50 copies/mL	67	72
無効例 <sup>注2)</sup>		7	8
死亡例		0	<1
有害事象による中止例		4	0
その他の理由による中止例 <sup>注3)</sup>		12	10

注1) 血漿中 HIV-1 RNA 量が <400 copies/mL（又は <50 copies/mL）に至り試験開始後 48 週まで維持していた症例

注2) 血漿中 HIV-1 RNA 量が <400 copies/mL に至らなかった症例及び至った後に再上昇した症例

注3) 患者追跡不能例、患者申出による脱落例、服薬不良例、プロトコール不遵守例など

試験開始後 48 週の CD4 リンパ球数の平均増加量は、本剤投与群で 29 cells/mm<sup>3</sup>、ラミブジン投与群で 61 cells/mm<sup>3</sup> であった。また、試験開始後 48 週までに CDC 分類 C 症状を新たに発現した症例は、本剤投与群で 2 例（0.7%）、ラミブジン投与群で 2 例（1.4%）であった。

3. 臨床薬理試験

2つの臨床試験で101例の患者に1日あたり25～400 mgのエムトリシタピンを単独療法として10～14日間投与し、エムトリシタピンの *in vivo* 活性を評価した。用量依存的な抗ウイルス作用が認められ、血漿中 HIV-1 RNA 量の試験開始時からの減少の中央値は、1日投与量 25 mg（1日1回投与）～400 mg（200 mg 1日2回投与）で 1.3～1.9 log<sub>10</sub> copies/mL であり、200 mg 1日1回投与で 1.6～1.9 log<sub>10</sub> copies/mL であった。

## 【薬効薬理】

### 1. 作用機序

エムトリシタビンは、シチジンの合成核酸誘導体であり、細胞内酵素によりリン酸化されエムトリシタビン 5'-三リン酸となる。エムトリシタビン 5'-三リン酸は HIV-1 逆転写酵素の基質であるデオキシシチジン 5'-三リン酸と競合すること、及び新生ウイルス DNA に取り込まれて DNA 鎖伸長を停止することにより、HIV-1 逆転写酵素の活性を阻害する。哺乳類の DNA ポリメラーゼ  $\alpha$ ,  $\beta$ ,  $\epsilon$  及びミトコンドリア DNA ポリメラーゼ  $\gamma$  に対するエムトリシタビン 5'-三リン酸の阻害作用は弱い。

### 2. 抗ウイルス作用 (*in vitro*)<sup>3)</sup>

ヒトリンパ芽球様細胞株、MAGI-CCR5 細胞株及び末梢血単核細胞を用いて、HIV-1 の実験室株及び臨床分離株に対するエムトリシタビンの *in vitro* での抗ウイルス活性を評価した。エムトリシタビンの 50% 阻害濃度 (IC<sub>50</sub> 値) は、0.0013~0.64  $\mu$ M (0.0003~0.158  $\mu$ g/mL) の範囲であった。

### 3. 薬剤耐性

*In vitro* においてエムトリシタビン耐性 HIV-1 株を得た。これらの分離株の遺伝子型解析により、エムトリシタビンに対する感受性の低下と、HIV-1 逆転写酵素遺伝子の M184V/I 変異との間に関連性が認められた。

エムトリシタビンを単独投与又は他の抗レトロウイルス薬と併用投与した患者より、エムトリシタビン耐性 HIV-1 株が検出されている。抗レトロウイルス薬による治療を未経験の患者を対象とした臨床試験では、ウイルス学的失敗が認められた患者の 35% から分離されたウイルスで、M184V/I 変異が認められた。

### 4. 交差耐性

これまでに一部の核酸系逆転写酵素阻害薬の間には交差耐性が認められている。エムトリシタビン耐性株 (M184V/I) はラミブジン及びザルシタビンに対して交差耐性を示したが、ジダノシン、サニルブジン、テノホビル、ジドブジン及び非核酸系逆転写酵素阻害薬 (デラビルジン、エファビレンツ及びネビラピン) に対しては感受性を維持した。アバカビル、ジダノシン、テノホビル及びザルシタビンにより *in vivo* で誘導された K65R 変異を有する HIV-1 分離株では、エムトリシタビンの阻害作用に対する感受性の低下が確認された。ジドブジン関連変異 (M41L, D67N, K70R, L210W, T215Y/F, K219Q/E) 又はジダノシン関連変異 (L74V) を有するウイルスは、エムトリシタビンに対する感受性を維持した。非核酸系逆転写酵素阻害薬耐性と関連づけられる K103N 変異を有する HIV-1 は、エムトリシタビンに対して感受性を示した。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

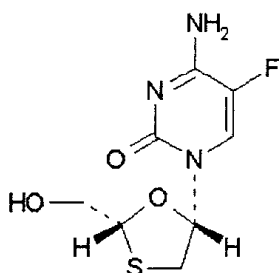
一般名：エムトリシタビン Emtricitabine

化学名：4-Amino-5-fluoro-1-[(2*R*,5*S*)-2-(hydroxymethyl)-1,3-oxathiolan-5-yl]pyrimidin-2(1*H*)-one

分子式：C<sub>8</sub>H<sub>10</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>S

分子量：247.25

化学構造式：



性状：白色～帯黄白色の粉末であり，水，メタノールに溶解やすく，アセトニトリルに溶けにくく，酢酸イソプロピルに極めて溶けにくい。

融点：約 155 °C

分配係数：-0.43（オクタノール/水）

### 【承認条件】

1. 本剤については，現在，国内外において臨床試験を実施中であることから，使用に当たっては，患者に対して本剤に関して更なる有効性・安全性のデータを引き続き収集中であること等を十分に説明し，インフォームドコンセントを得るよう，医師に要請すること。
2. 我が国における薬物動態試験については，進捗状況を定期的に報告するとともに，終了後速やかに試験成績及び解析結果を提出すること。また，海外において現在実施中又は計画中の臨床試験についても，終了後速やかに試験成績及び解析結果を提出すること。
3. 再審査期間が終了するまでの間，原則として国内の全投与症例を対象とした市販後調査を実施し，本剤の使用実態に関する情報（患者背景，有効性・安全性（他剤併用時の有効性・安全性を含む。）及び薬物相互作用のデータ等）を収集して定期的に報告するとともに，調査の結果を再審査申請時に申請書添付資料として提出すること。

### 【包装】

エムトリバ®カプセル 200 mg 30 カプセル/瓶

**【主要文献】**

- 1) Saag M.S. et al. : JAMA. 292 (2) 180, 2004
- 2) Benson C.A. et al. : AIDS. 18 (17) 2269, 2004
- 3) Schinazi R.F. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 36 (11) 2423, 1992

**輸入販売元**

日本たばこ産業株式会社

東京都港区虎ノ門二丁目 2 番 1 号

**提携先**

ギリアド・サイエンシズ社 (米国カリフォルニア州)