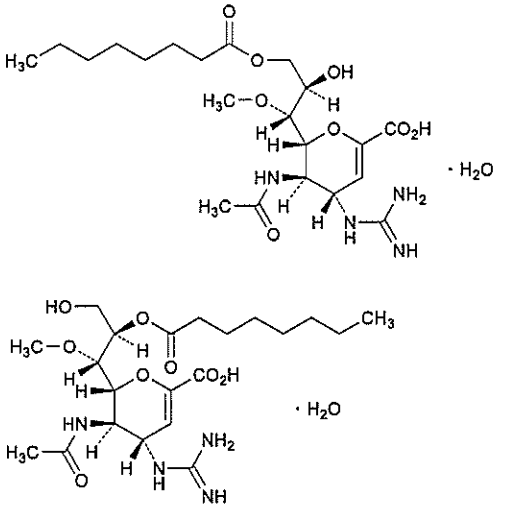
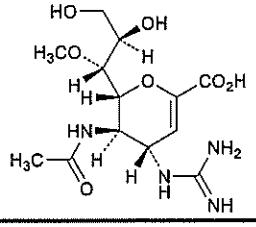
目次

1.　構造式及び主薬理作用 3
2.　申請効能又は効果、用法及び用量 4

化合物一覧

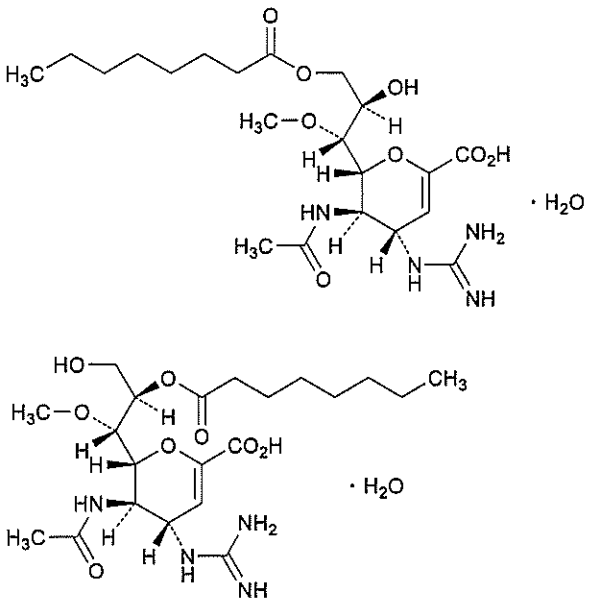
名称	化学名	構造式
CS-8958 （ラニナミビルオクタン酸エステル水和物、未変化体）	(2*R*,3*R*,4*S*)-3-Acetamido-4-guanidino-2-[(1*R*,2*R*)-2-hydroxy-1-methoxy-3-(octanoyloxy)propyl]-3,4-dihydro-2*H*-pyran-6-carboxylic acid monohydrate (2*R*,3*R*,4*S*)-3-Acetamido-4-guanidino-2-[(1*S*,2*R*)-3-hydroxy-1-methoxy-2-(octanoyloxy)propyl]-3,4-dihydro-2*H*-pyran-6-carboxylic acid monohydrate	
R-125489 （ラニナミビル、活性代謝物）	(2*R*,3*R*,4*S*)-3-Acetamido-2-[(1*R*,2*R*)-2,3-dihydroxy-1-methoxypropyl]-4-guanidino-3,4-dihydro-2*H*-pyran-6-carboxylic acid	

1. 構造式及び主薬理作用

CS-8958（ラニナミビルオクタン酸エステル水和物）は、第一三共株式会社が創製した長時間作用型ノイラミニダーゼ阻害剤である。CS-8958 の構造式を図 2.6.1.1-1 に示す。

CS-8958 は活性代謝物である R-125489 の直鎖をアルキルエステル化し、標的器官である気管及び肺への R-125489 の貯留性を向上させたプロドラッグである。CS-8958 は、オセルタミビルリン酸塩の耐性ウイルス株を含むすべての亜型のウイルスに対してノイラミニダーゼ阻害作用を示し、細胞障害活性は十分に低いことが確認されている。

図 2.6.1.1-1　CS-8958 の構造式



なお、CS-8958 は 2-アシル体と 3-アシル体の 2 種類の位置異性体の混合物であり、本資料では両化合物の混合物を CS-8958 として表記した。

2. 申請効能又は効果、用法及び用量

【効能又は効果（案）】

A 型又は B 型インフルエンザウイルス感染症の治療

【用法及び用量（案）】

成人及び小児には、ラニナミビルオクタン酸エステルとして 160 mg を日本薬局方生理食塩液 2 mL で懸濁し、ネブライザを用いて単回吸入投与する。