

イ. 起原又は発見の経緯及び外国における使用状況等

目 次		頁
I. 原薬		
1.	起原又は発見の経緯	イー原薬-1
2.	外国における使用状況	イー原薬-3
3.	特性及び他の忌避剤との比較検討等	イー原薬-5
4.	原薬の開発の経緯図	イー原薬-7
II. 製剤		
1.	開発の経緯	イー製剤-1

イ. 起原又は発見の経緯及び外国における使用状況等

I. 原薬

1. 起原又は発見の経緯

(1) はじめに

新規忌避有効成分イカリジン（製品名：Saltidin、開発コード番号：KBR-3023）は、
[redacted] [redacted]が開発した。

吸血性節足動物は世界中で多くの病気感染に関わり、しかも、刺咬によって皮膚炎、アレルギー反応及び二次感染を引き起こす可能性もある。忌避剤は時と場所を選ばずいつでも使用でき、感染症媒介吸血性節足動物に対する保護対策として重要な役割をはたし、また、熱帯マラリア原虫の抗マラリア剤に対する抵抗性が増加しているという理由から、世界保健機構（WHO）がマラリア予防手段として忌避剤を推奨している。

現在、最も広く知られ、よく使用されている化合物は、1946年に発見されたN, N-ジエチル-p-トルアミド（ディート）で、様々な剤型に製剤化でき、広い範囲の吸血性節足動物の忌避に有効であるという長所がある反面、不快臭を有し、皮膚や粘膜の炎症を引き起こしたり、数種の合成樹脂（材料）と相性が悪いという欠点がある。

〔1〕概要に「オーストラリア軍は35%ディートが配合されたゲル剤を採用している。本剤は蚊に対し有効であるが、兵士の間では広く使用されていない。理由として、ベタベタして気持ち悪いことやプラスチックや合成繊維を溶かす事を上げている。多くの兵は市販のスプレー式の忌避剤を使用している。」と報告されている。また、ディート製剤とイカリジン製剤の使用感を比較した試験において、刺激を感じた割合が、ディートで22.3%、イカリジンが11.9%と報告されている。〕

そのため、新忌避剤開発のために様々なアプローチがとられているが、イカリジンは、分子の形状を検討しながらその立体的な形状を変化させることでより効果の高い化合物を開発する分子モデリング技法²⁾を用いて開発された新世代の忌避剤で、既存の忌避剤であるディートの欠点を改善し、ディートと同等以上の有効性を有する化合物である。

米国疾病対策センター（Centers for Disease Control and Prevention：CDC）は、2005年4月28日に、害虫忌避剤の使用に関する指針を改め、長時間にわたって蚊を寄せ付けない効果があるものとして、イカリジン（ピカリジン）を認め、害虫忌避剤の選択肢を増やして感染予防対策を充実させた。

地球温暖化でこれまで我が国で発生が少なかった蚊を媒介虫とするマラリア、デング熱などの疾病の流行が懸念される中、承認されている害虫忌避剤はディートのみであり、この分野における選択肢を増やす意味でもイカリジンを有効成分とする医薬部外品「虫よけキンチョールB」の早期承認を願うところである。

(2) イカリジンの歴史

[redacted]年 [redacted]が新忌避剤の開発に着手。

[redacted]年 [redacted]はイカリジン（[redacted]（KBR3023））を候補化合物として選定。

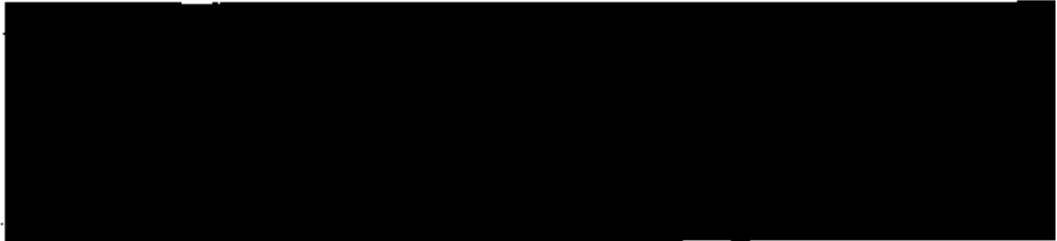
1998年 ベルギーでDEETと異なる成分としてイカリジンを有効成分とする忌避剤が初めて上市された。

(3) 海外登録及び販売状況

- ・ 欧州：ほとんどの国で登録又は販売されている。EUにおけるバイオサイド指令（BPD; Biocidal Products Directive）改訂があり、催奇形性試験が追加され、試験データを[redacted]年に提出した。

- ・ 米国:2001年登録。
- ・ カナダ: 2012年3月8日登録。
- ・ オーストラリア:2007年登録。
- ・ 中国: 2012年2月12日登録 (本登録)。
- ・ マレーシア:2007年登録。
- ・ 韓国:2009年登録。

(4) 特許状況



(5) イカリジンの作用機作 (参考資料ニ一)

イカリジンの作用機作を、ネッタイシマカとワモンゴキブリを用いて行動学の観点から試験した結果、吸血対象動物の匂いや性フェロモンのような誘引物への接近行動を明らかに減少させ、消失させることが報告された。

イカリジンが忌避効果を発揮するメカニズムについてネッタイシマカとワモンゴキブリの触角を用いた電気生理学試験において触覚上の感覚子の活動電位を測定し、イカリジンに対する反応が報告された。その報告によると、ネッタイシマカで、吸血源に対し反応する感覚子(A-3)は、イカリジンでは反応を示さなかった。しかし、別の感覚子(A-2)イカリジンに大きく特異的に反応した。A-2感覚子に存在する2つの感覚細胞は、異なる振幅によって識別され、イカリジンは小さな振幅の細胞のみが反応したと報告された。

ワモンゴキブリの触角上の感覚子(sw-B)に存在する感覚細胞に対しフェロモン及びイカリジンを用いた試験の結果、「フェロモンに敏感な細胞」はイカリジンに反応を示さなかった。しかし、同じ感覚子上の他の感覚細胞がイカリジンに対し直ちに反応した。

電気生理学的検査の結論としてイカリジンは、ネッタイシマカとワモンゴキブリの誘引刺激において、誘引源の認識に関与しない特定の感覚細胞に特異的に作用することが報告された。

更に、ワモンゴキブリを用いた生化学的試験において、触覚における二次伝達系物質の濃度を測定した結果、イカリジンは、二次伝達系物質のイノシトール3リン酸の濃度をイカリジン濃度に比例して増加させた。更にフェロモン(periplanone-B)はイノシトール3リン酸産生に関して、イカリジンよりも高い活性を示した。これらの観察から、イカリジンが感覚神経においてフェロモンと同一の二次伝達系物質の産生に係っていることが報告された。

以上の結果より、イカリジンは触覚の感覚子に存在する天然の誘引物質に反応する感覚細胞とは異なる感覚細胞が受容体となり、化学感覚応答反応を惹起させ、二次伝達系物質の産生を促し一定の反応を脳へ伝える。しかし、その二次伝達系物質が天然誘引物質が惹起させ産生するものと同一であることが示唆されており、天然誘引物質により発生した刺激反応を圧倒し、誘引物質の認知を阻害していると考えられる。

本阻害作用は、ゴキブリを用いた行動実験においても、同様の阻害作用が認められており、フェロモン物質とイカリジンの両方が混在すると、フェロモンにより誘発されるゴキブリの移動運動活性の増加を抑制することが認められている。

参考文献

- 1) Stephen P Frances, Robert D Cooper Personal protection measures against mosquitoes. ADF Health 2002; 3: 58-63
- 2) 「初心者のための分子モデリング」 A. ヒンチリフ著 地人書館

2. 外国における使用状況（平成23年11月現在）

イカリジン製剤は、イカリジン濃度5%～30%の範囲でポンプスプレー、エアゾール他の剤型で実用化され、各国で登録、販売している。

表. 外国における使用状況

国名	剤型（イカリジン含有%）
USA	ポンプスプレー（5%～20%） エアゾール（15%～20%） ワイブ（5.75%～20%）
オーストラリア ニュージーランド	ポンプスプレー（10%～25%） エアゾール（10%） ロールオン（10%～25%） スティック（2%）
ドイツ	ポンプスプレー（5%～30%） エアゾール（15%～20%） ジェル（10%～20%） クリーム（10%～20%） 乳液（10%～20%）
フランス	ポンプスプレー（20%～25%）
イタリア	シート（20%）
スウェーデン	ポンプスプレー（20%） ジェル（10%） ロールオン（5%～20%）
ベルギー	ポンプスプレー（7.5%～22.5%）

表 イカリジン製品の海外登録状況代表例一覧

調査年月：2011年11月

国名	販売名	登録No.	剤型及び有効成分濃度	用法及び用量	効能又は効果
米国	Cutter Advanced Sport Insect Repellent	EPA: 121-92	15% エアゾール スプレー	スプレーする時はノズルを肌から4-6インチの間隔をあけて僅かに肌を濡らすくらいに噴霧する。子供に使用する場合は、手にとり子供に塗る。	10 時間 (蚊、ダニ)
米国	Natrapel 8 Hour Insect Repellent Continuous Spray	EPA: 56575-1 5	20%エアゾール スプレー	ノズルを肌から4-6インチの間隔をあけてスプレーする。顔に使用する場合には、一旦手にスプレーして、それを顔に塗る。	8 時間 (蚊、ダニ)
米国	Off FamilyCare Insect Repellent	EPA: 4822-53 6	5% ポンプスプレ ー	容器を肌や服から6-8インチ離してゆっくりと弧を描くようにスプレーする。子供に使用する時は、あなた自身の手に一旦スプレーした後、それを子供に塗る。	3-4 時間 (蚊、サシバエ、ノミ)
米国	Natrapel 8 Hour Insect Repellent	EPA: 39967-5 3-56575	20% ポンプス プレー	ノズルを肌から4-6インチ離してスプレーする。ゆっくりと弧を描く動きで僅かに湿らせる。顔に使用する場合には、一旦手のひら少量スプレーして、それを顔や首に目を避けて塗る。子供に使用する時には、手にとり、それを子供に塗る。	8 時間 (蚊) 8時間 (ダニ)
米国	Cutter Advanced Insect Repellent	EPA: 121-90	5.75% ワイブ	ワイブを広げて露出した肌を均等に拭く。子供に使用する場合は、一旦自分の手につけた後、それを子供に塗る。露出した肌に使用する。	8 時間 (蚊) 5時間 (ダニ)
米国	Natrapel 8 Hour Insect Repellent Wipes	EPA: 56575-1 4	ワイブ/20%	ワイブを取り出し広げ、露出した肌に塗る。	8 時間 (蚊) 8時間 (ダニ)
ドイツ	Herwe Moskit Spray	BAuA:N 35322	ポンプスプレー /15%	保護したい場所に均一にきれいに処理する。頭や顔に使用する場合は、一度手にスプレーしてそれを処理する。	4時間(サシバエ、蚊、ブユ、ダニ)
ドイツ	Allgaeuer Latschenkiefer Beinspray Plus Zeckenschutz	BAuA:N 36473	ポンプスプレー /20%	皮膚に均一に広げる。必要であれば繰り返す。	8 時間 (蚊、ブユ) 4 時間 (ダニ)
オーストラリア	Family Protection Aerogard Odourless Low Irritant	APVMA : 61364/1 50g/060 7	エアゾールスプレ ー/9.5%	使用前に良く振る。缶を垂直に持ち、15-20cm 離して露出した肌に軽くスプレーする。顔に使用する場合は、一旦手にスプレーしそれを塗る。	4 時間 (蚊、ハエ、サシバエ、その他の刺咬昆虫)

3. 特性及び他の忌避剤との比較検討等
イカリジンの基礎効力試験結果の概要を以下に示す。

表イー2 効力を裏付ける試験成績一覧(原薬)

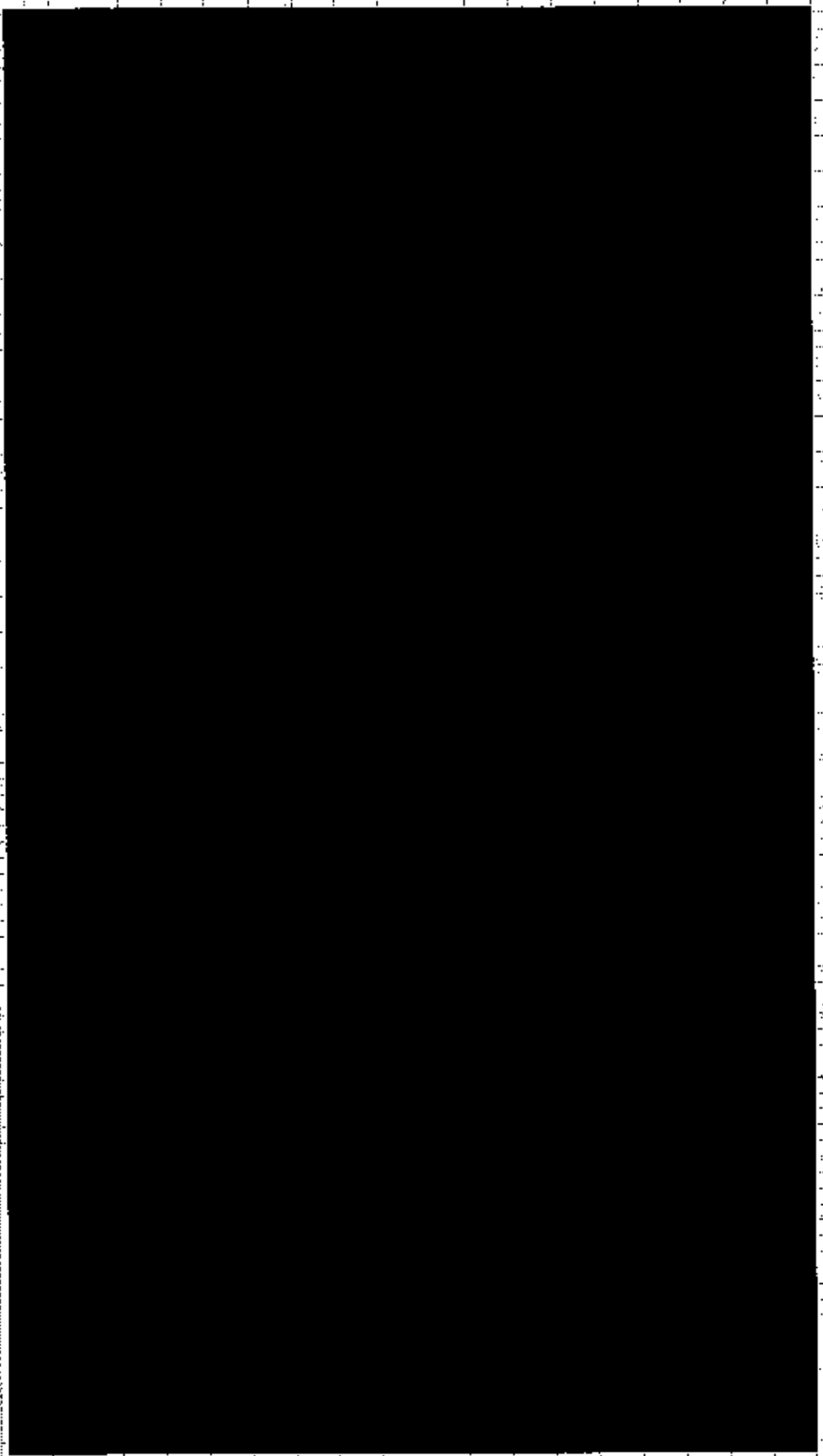
試験項目 (投与経路)	対象害虫	配合量 又は 使用量	対照薬剤	試験結果	資料番号
モルモットを用いた忌避効力試験	ネッタイシマカ ネッタイイカ ステファンスマダラカ	●●●● ng/cm ²	ディート	忌避効力持続時間(単位 hr) イカリジン ディート ネッタイシマカ 7.2 3.6 ネッタイイカ 12.2 6.8 ステファンスマダラカ 6.4 2.7	参考資料 ニ-1
	ツバエ	●●●● ng/cm ²	ディート	忌避効力持続時間(単位 hr) イカリジン ディート ツバエ 9.3 2.4	参考資料 ニ-1
行動試験	ネッタイシマカ	手拭 ●●●● mg 手拭 ●●●● mg	ディート	イカリジンとディートの忌避効力活性は、行動面から明らかで、薬量に依存した。	参考資料 ニ-1
	ワモンゴキブリ	Periplanone-B(0.1 μg) + ●●●● μg	ディート	イカリジンあるいはディートをフェロモン(Periplanone-B)に混ぜ合わせると、薬量に応じて移動運動活性を減衰させた。	参考資料 ニ-1
電気生理学的観察	ネッタイシマカ触角 ワモンゴキブリ触角	—	ディート	ネッタイシマカとワモンゴキブリの誘引において、ディートとイカリジンが、においの認識に関わらない特定の嗅覚受容細胞型タイプの細胞に特異的に作用することを示唆した。	参考資料 ニ-1 参考資料 ニ-1
	ワモンゴキブリ触角及び筋肉のホモジネート液	50 ミリ秒刺激	periplanone-B	触角ではイカリジンの処理において用量に依存したイノシトール三リン酸(IP ₃)濃度の増加を誘発したが、筋組織内のIP ₃ レベルは影響を受けなかった。 触角標本のIP ₃ レベル経路の選択的活性化は、イカリジンが感覚神経のGタンパク質共役受容体(GPCR)の一部を介して作用する可能性を示唆した。	参考資料 ニ-1
イカリジンに対する●●●●の忌避効力増強効果	ネッタイシマカ雌成虫	イカリジン 10%+●●●●%のイソプロパノール溶液	イカリジン 10%のイソプロパノール溶液	●●●●はイカリジンの忌避効力持続時間に影響なかった。	ニ-1

表イー2 (つづき) 効力を裏付ける試験成績一覧 (原薬)

試験項目 (投与経路)	対象害虫	配合量 又は 使用量	対照薬剤	試験結果	資料番号
イカリジンとデイトの効力比較	ネクターマカ雌成虫	イカリジン 10%のイソプロパノール溶液	デイト 10%のイソプロパノール溶液	効力持続時間 イカリジン 10% 6.5hrs デイト 10% 4.7hrs イカリジンはデイトの 1.4 倍の忌避効力持続時間	ニ-1
ケージ試験法	ネクターマカ雌成虫	イカリジン 15%のエタノール溶液	デイト 15%のエタノール溶液	デイトの効力持続時間は平均 5.2 時間であったが、イカリジンは平均 7.3 時間と十分な効力持続時間を示した。	ニ-2
ケージ試験法	ネクターマカ雌成虫	イカリジン 10%製剤 20%製剤	デイト 10%製剤 20%製剤	イカリジン3製剤はデイト各製剤より総合的に忌避効力が高かった。製剤の忌避効力は持続時間が大きな要素を占め、3製剤の中でイカリジン 20% (lotion) が最も忌避効力持続時間が長かった。	ニ-3
ケージ試験法	ハマダラカ類 (<i>Anopheles dirus</i>) 雌成虫	イカリジン 10%製剤 20%製剤	デイト 10%製剤 20%製剤	イカリジン3製剤が試験期間を通じて 70%以上の忌避率が得られ、処理 6 時間後、8 時間後においても高い忌避率を示し、長時間忌避効果が持続した。イカリジン3製剤はデイト製剤と比較してハマダラカ類に対する忌避率が総じて高かった。	ニ-3
ケージ試験法	ネックツイエカ ステフェンスハマ ダラカ サンバエ (<i>Stomoxys calcitrans</i>)	イカリジン 12%製剤	デイト 17%製剤	すべての供試昆虫に対して、KBR3023 の濃度が低いにもかかわらず、KBR3023はデイトより忌避効力持続時間が長かった。	ニ-4
ヒト図法	アブ類	イカリジン 7.5%製剤	デイト 10%製剤	忌避効力持続時間は、(中程度の密度) イカリジン7.5%製剤では5時間、デイト10%製剤では6時間であった。 (低密度) イカリジン7.5%製剤で6時間、デイト10%製剤で7時間であった。 (高密度) イカリジン7.5%製剤で4時間、デイト10%製剤で6時間であった。 (超高密度) イカリジン7.5%製剤で4時間、デイト10%製剤で5時間であった。	ニ-5

イカリジンは対照薬剤デイトと比較し、各種吸血害虫に対し、優れた忌避効力を示した。

4. 原薬の開発の経緯図



II. 製剤

1. 開発の経緯

蚊、ブユ（ブヨ）、マダニ及びイエダニなどの吸血性節足動物は、多くの感染症を媒介することが知られている。忌避剤は時と場所を選ばずいつでも使用でき、感染症媒介吸血性節足動物に対する保護対策として重要な役割をはたしている。しかし、地球温暖化でこれまで我が国で発生が少なかった蚊を媒介虫とするマラリア、デング熱などの疾病の流行が懸念される中、我が国で承認されている害虫忌避剤はディートのみである。ディートに対し非感受性を示す系統の吸血昆虫¹⁾が蔓延した場合、吸血忌避に使用可能な代替製剤が存在しない状況は、本邦の公衆衛生上、大きな懸念である。そこで、忌避剤の選択肢を増やすべく、諸外国で承認されているイカリジン²⁾を有効成分とする医薬部外品「虫よけキンチョールB」の開発に着手した。

■によって開発されたイカリジンIcaridin（開発コード番号：KB R 3 0 2 3、米国EPAの登録名はピカリジンPicaridin）は、ディートに替わる新しい世代の合成忌避剤で、分子の形状を検討しながらその立体的な形状を変化させることでより効果の高い化合物を開発する分子モデリング技法³⁾により創製された。800以上の物質を探索した中で、イカリジンはさまざまな節足動物に対して高い忌避効力を示し、人体に対する安全性が高く、皮膚刺激反応が認められないうえ、皮膚からの浸透もほとんどなく、プラスチック素材を侵さないという非常に優れた特性を持ち合わせている。

今回、このような極めて有用な昆虫忌避成分イカリジンを有効成分とする医薬部外品の製造販売承認を取得するために各種の試験を実施し、使用が簡便で日本において最もポピュラーな剤型であるエアゾール剤への適用を検討した。本申請品の処方化は、医薬部外品として既承認の前例を参考にして進め、各種試験結果に基づいて、本申請品の成分及び分量又は本質を決定した。

表イ-1 本邦における忌避剤の適用害虫一覧表

害虫 項目	蚊成虫	ブユ (ブヨ)	アブ	マダニ
分布 状況	アカイエカ 北海道、本州、四国、 九州に分布。 ヒトスジシマカ 関東以西に広く分 布。	キタオオブユ 関東以北に分布。 アシマグラブユ 北海道、本州、四国、 九州、琉球諸島に分 布。	イヨシロオビアブ 北海道、本州、四国、 九州に分布。 コマブアブ 北海道、本州に分布。	フタトゲチマダニ 屋久島以北に分布。 ヤマトマダニ 屋久島以北に分布。
公衆衛生上の 被害	ヒトから吸血し、ア レルギー症状を起こ す。	朝夕の薄明かりの時 刻に旺盛に吸血す る。刺咬後の痒痒感 が強い。	早期や夕方、薄明か り時刻に大群でヒトを 吸血する。吸血時に 激痛を伴う。	ヒトから吸血し、皮 膚の発赤、腫瘍など の炎症を起こす。
本邦に おける 感染症	コガタアカイエカが 日本脳炎ウイルスを 媒介する。 ヒトスジシマカがデ ング熱ウイルスを媒 介する。	ブユにより糸状虫が 媒介され、オンコセ ルカ症などを発症す る。主にアフリカで 発生している。	本邦において野兔病 菌 (<i>Francisella tularensis</i>) をアブ が媒介したとの報告 がある。糸状虫を媒 介することも知られ ている。	マダニの吸血により 重症熱性血小板減少 症候群のウイルスを 媒介する。 ライム病の原因とな るスピロヘータを媒 介する。
感染症発生状況 (参考)	日本脳炎 世界的には年間 3~4 万人の日本脳炎患者 の報告があるが、日 本と韓国はワクチン の定期接種によりす でに流行が阻止され ている。日本では、 1968 年の 2,017 人を ピークに減少し、 1992 年以降発生数は 毎年 10 人以下であ り、そのほとんどが 高齢者であった。し かし、1999 年以後、 10 歳代 2 例、30 歳 代・40 歳代各 1 例と 比較的若年の患者が 発生している。 ¹⁾ デング熱 日本では、海外にお いて感染し帰国後発 症するいわゆる輸入 症例が、近年は年間 約 200 例報告され ている。過去 60 年以 上国内における感染 報告はなかったが、 2014 年 8 月以降、国 内感染事例が 160 例 以上確認されている。 ^{2) 4)}	フィラリア かつて日本でも流行 していたが、現在猪 生は報告されていな い。 ⁵⁾	野兔病 日本では 1924 年の初 発例以降、1994 年ま での間に合計 1,372 例の患者が報告さ れ、東北地方全域と 関東地方の一部が本 病の多発地である。 発生の季節性は、吸 血性節足動物の活動 期 (4~6 月) と狩猟 時期 (11~1 月) の 2 つのピークを示す。 第二次世界大戦前は 年平均 13.8 件であ ったが、戦後は 1955 年まで年間 50~80 例 と急増した。その後 減少傾向を示し、 1999 年の千葉県での 1 例以降は報告され ていない。 ⁶⁾	重症熱性血小板減少 症候群 (SFTS) 国内感染症発生動向 調査では 109 人の SFTS 患者が報告さ れており、男女比は 48:61 で、年齢中央 値は 73 歳であった。 5-8 月の発症例が多 く、西日本の 15 県か ら報告されている。 ³⁾
現在の 対策	[忌避] ディート製剤 [駆除] 蚊取線香他	[忌避] ディート製剤	[忌避] ディート製剤	[忌避] ディート製剤 [駆除] ハエ蚊用エタール剤他

参考文献

- 1) Stanczyk, N. M., Brookfield, J. F., Innell, R., Logan, J.G., Field, L. M. (2010) Behavioral insensitivity to DEET in *Aedes aegypti* is a genetically determined trait residing in changes in sensillum function. *Proc Natl Acad Sci USA* 107, 8575-8580
- 2) 「初心者のための分子モデリング」 A.ヒンチリフ 地人書館
- 3) 国立感染症研究所 HP <http://www.niid.go.jp/niid/ja/>
- 4) 厚生労働省 HP <http://www.mhlw.go.jp/>
- 5) 日本における寄生虫学の研究 7 (1999) IV 線虫類 11.リンパ性フィラリア症 藤田敏一郎

本申請品の物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法設定に関しては、規格及び試験方法に基づき、性状、確認試験及び定量法に係る試験を行ったうえで資料を作成した。なお、性状の項における「におい」の項目は、当初規格の1項目として試験を実施したが、規格の内容として特徴的な情報が得られるものではないため、本申請品の規格及び試験方法を設定するに際しては、性状の項に「におい」の項目を含めなかった。

また、本申請品の安定性に関する資料では、長期保存試験、苛酷試験及び加速試験を行い、十分な安定性を有することを確認した。

本申請品の急性毒性について、ラット及びマウスを用い、単回経口及び単回経皮試験を検討した結果、いずれの試験においても死亡例は認められず、最小致死量は雌雄とも2000mg/kg以上であった。本申請品の吸入毒性については、単回吸入及び反復吸入試験を実施し、評価した結果、単回吸入試験における最小致死濃度は23.46mg/m³超（KBR3023として）、反復吸入試験における無毒性量は4.359mg/m³（KBR3023として）であった。

本申請品の眼一次刺激性試験は「刺激物」、皮膚一次刺激性試験は「皮膚一次刺激性は認められなかった」と評価された。更に、皮膚感作性は陽性率0%となり、皮膚感作性はないと結論された。眼に対して「刺激物」と評価されたが、刺激反応が一過性の反応であったこと、更に使用上の注意等において注意喚起を実施することから、実用上問題はないと判断した。

よって、本申請品は安全性が十分に確保されており、医薬部外品に該当する安全性の高い製剤であると判断した。

イカリジンを有効成分とする虫よけエアゾール「虫よけキンチョールB」（開発コード番号■■■■■■■■■■）の処方選定試験は、アカイエカを対象に実施した。対照薬剤として、昆虫忌避成分・ディートを有効成分とする大日本除虫菊株式会社製虫よけエアゾール「虫よけキンチョールA」を用い、対照薬剤と同等以上の高い忌避効力が得られる処方を選定した。

この虫よけエアゾール「虫よけキンチョールB」について基礎効力試験及び実地効力試験を次表のとおり実施した。

表イ-2

「虫よけキンチョールB」(開発コード番号「XXXXXXXXXX」)の効力を裏付ける試験成績一覧(製剤)

試験項目	暴露時間	対照薬剤	試験結果	試験機関	資料
処方選定試験 (フアンパ-法:アハニカ雌成虫)	3分 薬剤塗布 2, 4, 6, 8 時間後	「虫よけキンチョールA」 アハニカ 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-平均忌避率(%) 被験薬剤① 2-100, 4-95.0, 6-87.1, 8-63.8 被験薬剤② 2-100, 4-100, 6-100, 8-97.6 被験薬剤③ 2-100, 4-100, 6-100, 8-100 対照薬剤 2-100, 4-100, 6-100, 8-93.9	大日本除虫菊株式会社 中央研究所	ニ-8
基礎忌避効力試験 (単ケン'法:アハニカ雌成虫)	連続 薬剤塗布 2, 4, 6, 8, 24 時間後	「虫よけキンチョールSRB」 アハニカ 10.0w/v% (原液中)	薬剤塗布後時間-忌避指数 被験薬剤 XXXXXXXXXX 2-100, 4-100, 6-100, 8-100, 24-99.0 対照薬剤 2-100, 4-100, 6-100, 8-100, 24-100	XXXXXXXXXX	ニ-7
基礎忌避効力試験 (フアンパ-法:アハニカ雌成虫)	3分 薬剤塗布 直後, 2, 4, 6 時間後	「虫よけキンチョールA」 アハニカ 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-平均忌避率(%) 被験薬剤 XXXXXXXXXX 直後-100, 2-100, 4-100, 6-100 対照薬剤 直後-100, 2-100, 4-100, 6-100	大日本除虫菊株式会社 中央研究所	ニ-8
実地忌避効力試験 (3'ランティ'法:ヒスジ'メカ)	5分 薬剤塗布 直後, 2, 4, 6 時間後	「虫よけキンチョールA」 アハニカ 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-平均忌避率(%) 被験薬剤 XXXXXXXXXX 直後-100, 2-100, 4-100, 6-100 対照薬剤 直後-100, 2-100, 4-100, 6-100	XXXXXXXXXX	ニ-9
	5分 薬剤塗布 直後, 2, 4, 6 時間後	「虫よけキンチョールA」 アハニカ 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-平均忌避率(%) 被験薬剤 XXXXXXXXXX 直後-100, 2-100, 4-100, 6-100 対照薬剤 直後-100, 2-100, 4-100, 6-100	大日本除虫菊株式会社 中央研究所	ニ-10

表イー2 (つづき)
「虫よけキンチョールB」(開発コード番号 [REDACTED])の効力を裏付ける試験成績一覧(製剤)

試験項目	暴露時間	対照薬剤	試験結果	試験機関	資料
実地忌避効力試験 (ホランティ7法:ブス類)	1時間 薬剤塗布 5, 6 時間後	「虫よけキンチョールA」 デイト 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-平均忌避率(%) 被験薬剤 [REDACTED] 5-100、6-100 対照薬剤 5-100、6-100	[REDACTED]	ニ-11
	30分 薬剤塗布 5, 6 時間後	「虫よけキンチョールA」 デイト 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-平均忌避率(%) 被験薬剤 [REDACTED] 5-100、6-100 対照薬剤 5-100、6-100	大日本除蟲菊株式会社 中央研究所	ニ-12
実地忌避効力試験 (ホランティ7法:アブ類)	1時間 薬剤塗布 3, 6 時間後	「虫よけキンチョールA」 デイト 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-忌避指数 【脚】 被験薬剤 [REDACTED] 直後-100、3-97.9、6-98.9 対照薬剤 直後-100、3-100、6-100 【腕】 被験薬剤 [REDACTED] 直後-100、6-93.8 対照薬剤 直後-100、6-100	[REDACTED]	ニ-13
基礎忌避効力試験 (ろ紙を用いた忌避効力試験:フタゲチダニ)	30分間 薬剤処理 1 時間後	「虫よけキンチョールA」原液 デイト 10w/v%	這い出し率(%)=忌避指数 被験薬剤「虫よけキンチョールB」原液 0-100 対照薬剤 0-100	[REDACTED]	ニ-14
	30分間 薬剤処理 1 時間後	「虫よけキンチョールA」原液 デイト 10w/v%	這い出し数(匹)=忌避指数 被験薬剤「虫よけキンチョールB」原液 0-100 対照薬剤 0-100	フマキラー株式会社	ニ-15
人脚を用いた忌避効力試験 (ホランティ7法:フタゲチダニ)	3分間 薬剤塗布 1, 2, 4, 6 時間後	「虫よけキンチョールA」 デイト 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-忌避指数 被験薬剤「虫よけキンチョールB」 1-100、2-100、4-100、6-100 対照薬剤 1-100、2-100、4-100、6-100	[REDACTED]	ニ-16
	3分間 薬剤塗布 1, 2, 3, 4, 5, 6 時間後	「虫よけキンチョールA」 デイト 5.0w/v%	薬剤塗布後時間-忌避指数 被験薬剤「虫よけキンチョールB」 1-100、2-100、3-100、4-100、 5-100、6-100 対照薬剤 1-100、2-100、3-100、4-100、 5-100、6-100	フマキラー株式会社	ニ-17

その結果、被験薬剤「虫よけキンチョールB」は、基礎忌避効力試験において、アカイエカに対する単ケージ法あるいはチャンバー法で薬剤塗布後 6 時間以上にわたり優れた忌避効力を保持し、既承認品である「虫よけキンチョールローションSRB」や「虫よけキンチョールA」と同様に、アカイエカに対して十分な効力を示すエアゾール製剤であると判断した。

また、被験薬剤「虫よけキンチョールB」のヒトスジシマカ、ブユ類、アブ類に対するボランディアによる実地忌避効力試験においても、その優れた忌避効力が既承認品である「虫よけキンチョールA」と同様に、薬剤塗布後6時間にわたり持続することが実証され、被験薬剤「虫よけキンチョールB」はこれらの害虫に対しても実用性の高い虫よけエアゾール製剤であると判断した。

更に、被験薬剤「虫よけキンチョールB」は、マダニに対する基礎忌避効力試験（ろ紙を用いた忌避効力試験）あるいはボランディアによる人腕を用いた忌避効力試験において薬剤塗布後 6 時間にわたり優れた忌避効力を保持し、対照薬剤である「虫よけキンチョールA」と同様に、マダニに対しても実用性の高い虫よけエアゾール製剤であると判断した。

これらの試験結果及びイカリジン原薬における効力試験結果に基づき、ここに「虫よけキンチョールB」の「用法及び用量」及び「効能又は効果」を以下のように設定し、医薬部外品製造販売承認を申請する次第である。

用法及び用量	缶をよく振って、肌から約10cm 離して、適量を肌の露出面にまんべんなくスプレーする。顔、首筋には、手のひらに一度スプレーしてから肌に塗布する。
効能又は効果	蚊成虫、ブユ（ブヨ）、アブ、マダニの忌避