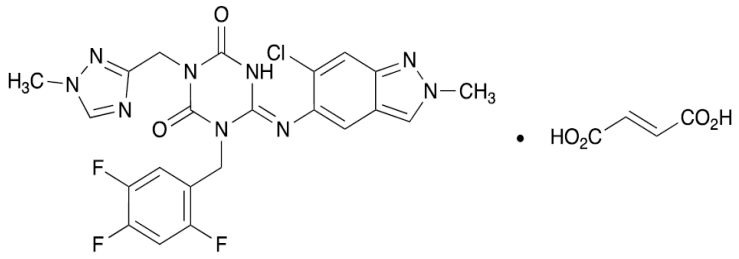
毒薬・劇薬等の指定審査資料のまとめ

(現行)

化学名・別名	(6*E*)-6-[(6-クロロ-2-メチル-2*H*-インダゾール-5-イル)イミノ]-3-[(1-メチル-1*H*-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル]-1-[(2,4,5-トリフルオロフェニル)メチル]-1,3,5-トリアジナン-2,4-ジオン　一フマル酸
構造式	
効能・効果	SARS-CoV-2 による感染症
用法・用量	通常，12 歳以上の小児及び成人にはエンシトレルビルとして 1 日目は 375 mg を，2 日目から 5 日目は 125 mg を 1 日 1 回経口投与する.
劇薬等の指定	劇薬
市販名及び有効成分・分量	原体：エンシトレルビル　フマル酸 製剤：ゾコーバ錠 125 mg (1 錠中エンシトレルビル　フマル酸 152.3 mg 含有)
毒性	**急性毒性** 動物種 / 性 / 投与経路 / 概略の致死量 ラット[1] / 雄 / 経口 / >2000 mg/kg サル[2] / 雌雄 / 経口 / >1000 mg/kg 1)　ラットを用いた小核試験の初回投与時 2)　サル 2 週間反復経口投与毒性試験の初回投与時 **亜急性毒性** 動物種 / 投与期間 / 投与経路 / 投与量 (mg/kg/日) / 無毒性量 (mg/kg/日) / 主な所見 ラット / 2 週間 / 経口 / 0, 20, 100, 1000 / 1000 / 毒性変化なし ラット / 4 週間 / 経口 / 0, 20, 50, 1000 / 1000 / 毒性変化なし

<table>
<tr><td></td><td>
<table>
<tr><td>サル</td><td>2 週間</td><td>経口</td><td>M: 0, 10, 50, 1000/300/100
F: 0, 10, 50, 300/100</td><td>10</td><td>死亡/瀕死，嘔吐，摂餌量減少を伴う体重減少，赤血球パラメータ及び血小板減少，多臓器における炎症性変化，ストレスに伴う二次的変化</td></tr>
<tr><td>サル</td><td>4 週間</td><td>経口</td><td>0, 3, 10, 30</td><td>10</td><td>雌 : 摂餌量及び体重減少，赤血球パラメータの減少，胆嚢及び子宮における炎症性細胞浸潤</td></tr>
</table>
</td></tr>
<tr><td>副作用</td><td>副作用発現率 22.5% (172/763 例)注
<table>
<tr><th>副作用の種類</th><th>例数</th><th>発現率%</th></tr>
<tr><td>高比重リポ蛋白減少</td><td>127</td><td>16.60</td></tr>
<tr><td>血中ビリルビン増加</td><td>18</td><td>2.35</td></tr>
<tr><td>血中トリグリセリド増加</td><td>17</td><td>2.22</td></tr>
<tr><td>血中コレステロール減少</td><td>8</td><td>1.05</td></tr>
<tr><td>下痢</td><td>6</td><td>0.78</td></tr>
<tr><td>頭痛</td><td>5</td><td>0.65</td></tr>
</table>
注 : T1221 試験 Phase 2a Part，Phase 2b Part，及び Phase 3 Part を併合した 375/125 mg 群の結果を参照</td></tr>
<tr><td>会社</td><td>塩野義製薬株式会社</td></tr>
</table>

(変更)

<table>
<tr><td>化学名・別名</td><td></td></tr>
<tr><td>構造式</td><td></td></tr>
<tr><td>効能・効果</td><td>SARS-CoV-2 による感染症の治療及びその予防</td></tr>
<tr><td>用法・用量</td><td></td></tr>
<tr><td>劇薬等の指定</td><td></td></tr>
<tr><td>市販名及び有効成分・分量</td><td></td></tr>
<tr><td>毒性</td><td></td></tr>
<tr><td>副作用</td><td>＜治療試験成績＞
副作用発現率 22.5% (172/763 例)注1
<table><tr><th>副作用の種類</th><th>例数</th><th>発現率%</th></tr><tr><td>高比重リポ蛋白減少</td><td>127</td><td>16.60</td></tr><tr><td>血中ビリルビン増加</td><td>18</td><td>2.35</td></tr><tr><td>血中トリグリセリド増加</td><td>17</td><td>2.22</td></tr><tr><td>血中コレステロール減少</td><td>8</td><td>1.05</td></tr><tr><td>下痢</td><td>6</td><td>0.78</td></tr><tr><td>頭痛</td><td>5</td><td>0.65</td></tr></table>注 1：T1221 試験 Phase 2a Part，Phase 2b Part, 及び Phase 3 Part を併合した 375/125 mg 群の結果を参照

＜予防試験成績＞
副作用発現率 1.6% (19/1190 例)
<table><tr><th>副作用の種類注2</th><th>例数</th><th>発現率%</th></tr><tr><td>下痢</td><td>4</td><td>0.3</td></tr><tr><td>頭痛</td><td>3</td><td>0.3</td></tr><tr><td>悪心</td><td>2</td><td>0.2</td></tr><tr><td>活性化部分トロンボプラスチン時間延長</td><td>2</td><td>0.2</td></tr></table>注 2：T1331 試験で 2 例以上に発現した副作用を対象とした.
試験の盲検維持のため，高比重リポ蛋白値は実施医療機関に報告されなかったことから，副作用発現率には含まれていない.</td></tr>
<tr><td>会社</td><td></td></tr>
</table>