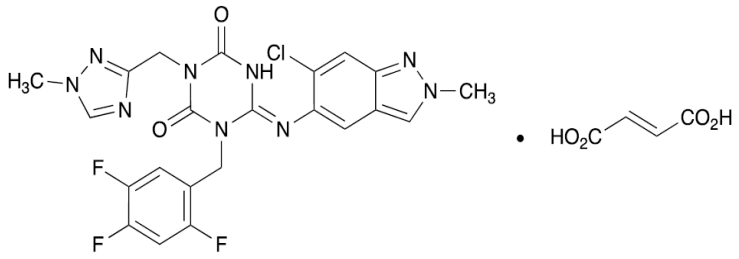
毒薬・劇薬等の指定審査資料のまとめ

(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 による感染症の治療及びその予防
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

	サル	2 週間	経口	M: 0, 10, 50, 1000/300/100 F: 0, 10, 50, 300/100	10	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
	サル	4 週間	経口	0, 3, 10, 30	10	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

副作用

＜治療試験成績＞

副作用発現率 22.5% (172/763 例)[注 1]

副作用の種類	例数	発現率%
高比重リポ蛋白減少	127	16.60
血中ビリルビン増加	18	2.35
血中トリグリセリド増加	17	2.22
血中コレステロール減少	8	1.05
下痢	6	0.78
頭痛	5	0.65

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)

副作用の種類[注 2]	例数	発現率%
下痢	4	0.3
頭痛	3	0.3
悪心	2	0.2
活性化部分トロンボプラスチン時間延長	2	0.2

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．

会社	塩野義製薬株式会社

(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></td></tr>
<tr><td>用法・用量</td><td>＜治療＞
通常，エンシトレルビルとして以下の用量を 1 日 1 回経口投与する．
<table>
<tr><td rowspan="2">年齢</td><td rowspan="2">体重</td><td colspan="2">用量</td></tr>
<tr><td>1 日目</td><td>2 日目から
5 日目</td></tr>
<tr><td>成人及び
12 歳以上の小児</td><td>―</td><td>375mg</td><td>125mg</td></tr>
<tr><td rowspan="3">6 歳以上
12 歳未満の小児</td><td>40kg 以上</td><td>375mg</td><td>125mg</td></tr>
<tr><td>30kg 以上 40kg 未満</td><td>250mg</td><td>125mg</td></tr>
<tr><td>20kg 以上 30kg 未満</td><td>150mg</td><td>75mg</td></tr>
</table>
＜予防＞
通常，成人及び 12 歳以上の小児にはエンシトレルビルとして 1 日目は 375mg を，2 日目から 5 日目は 125mg を 1 日 1 回経口投与する．</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>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)
ゾコーバ錠 25 mg (1 錠中エンシトレルビル　フマル酸 30.46 mg 含有)</td></tr>
</table>

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
サル	2 週間	経口	M: 0, 10, 50, 1000/300/100 F: 0, 10, 50, 300/100	10	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
サル	4 週間	経口	0, 3, 10, 30	10	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
幼若ラット	8 日 3), 4), 9 日 5)	経口	0, 30, 90, 1000	90 3) 1000 4), 5)	雌雄:体重及び摂餌量減少 3) 雌：大腿骨長の短縮 3) 毒性変化なし 4), 5)

3) コホート 1 (生後 21 から 28 日投与群)
4) コホート 2 (生後 29 から 36 日投与群)
5) コホート 3 (生後 37 から 45 日投与群)

副作用

＜治療試験成績＞

T1221 試験

副作用発現率 22.5% (172/763 例)[注 1]

副作用の種類	例数	発現率%
高比重リポ蛋白減少	127	16.60
血中ビリルビン増加	18	2.35
血中トリグリセリド増加	17	2.22
血中コレステロール減少	8	1.05
下痢	6	0.78
頭痛	5	0.65

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

T1231 試験

副作用発現率 19.2% (15/78 例)

副作用の種類[注 2]	例数	発現率%
高比重リポ蛋白減少	11	14.10
嘔吐[注 3]	3	3.85

注 2：エンシトレルビル群で 2 例以上に報告された副作用を記載した．
注 3：3 例のうち，1 例は治験薬の大きさ，2 例は味が原因で，day 1 に嚥下後吐き出したものと報告され，いずれも day 2 以降は規定量を服用した．

＜予防試験成績＞

副作用発現率 1.6% (19/1190 例)

副作用の種類[注 4]	例数	発現率%
下痢	4	0.3
頭痛	3	0.3
悪心	2	0.2
活性化部分トロンボプラスチン時間延長	2	0.2

注 4：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．

会社