ゾコーバ錠 125mg, 同錠 25mg

第 2 部 (モジュール 2) : CTD の概要 (サマリー)

2.6 非臨床試験の概要文及び概要表

2.6.1 緒言

塩野義製薬株式会社

目次

略号及び用語定義一覧表 3
2.6.1 緒言 4
2.6.1.1 医薬品の構造及び薬理学的特性 4
2.6.1.2 申請した臨床適応，用量及び投与期間 4

略号及び用語定義一覧表

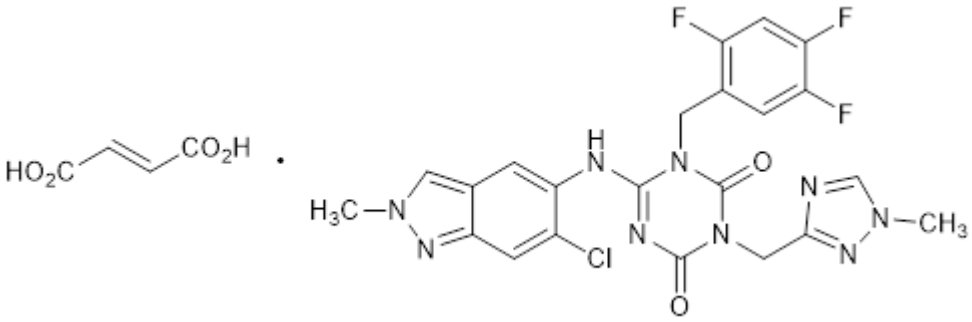
略号	英語	日本語
3CL	3C-like	(3C 様)
COVID-19	coronavirus disease 2019	新型コロナウイルス感染症

2.6.1 緒言

2.6.1.1 医薬品の構造及び薬理学的特性

エンシトレルビルフマル酸共結晶 (以下, エンシトレルビルフマル酸) は, 塩野義製薬株式会社によって創製された新型コロナウイルス感染症 (COVID-19) 治療薬である. 本薬は, SARS-CoV-2 の 3C-like (3CL) プロテアーゼに作用し, SARS-CoV-2 の増殖を抑制すると考えられる.

1. 医薬品の構造



2. 薬理学的特性

実施した非臨床薬効薬理試験の結果から, 本薬の薬理学的特性は以下のように考えられる.

- スパイクタンパクに変異を持つ SARS-CoV-2 (アルファ株, ベータ株, ガンマ株, デルタ株, シータ株, ラムダ株, ミュー株又はオミクロン株) を用いた in vitro の評価結果から, エンシトレルビルフマル酸はスパイクタンパクに変異を持つ SARS-CoV-2 に対して抗ウイルス作用を有すると考えられる.
- In vitro 試験の結果より, エンシトレルビルフマル酸の抗ウイルス活性は, 3CL プロテアーゼ上の N 末端側から 166 番目のグルタミン酸がバリンに置換 (E166V) を含むニルマトレルビル感受性低下責任アミノ酸変異に対して影響を受けなかった.
- In vitro 試験の結果より, エンシトレルビルフマル酸は核酸アナログであるレムデシビル, EIDD-1931 (モルヌピラビルの親化合物), 3CL プロテアーゼ阻害剤である PF-07321332 並びに中和抗体であるソトロビマブ, ベブテロビマブ, チキサゲビマブ/シルガビマブと併用することにより相加的な, カシリビマブ/イミデビマブの中和抗体カクテルである REGN-COV2 と併用することにより相加から相乗的なウイルス増殖抑制効果を示すと考えられる.
- 致死量の SARS-CoV-2 をマウスに接種し, 致死率改善効果を検討した in vivo の評価結果から, エンシトレルビルフマル酸は, SARS-CoV-2 感染後の治療を目的として投与した場合, 治療開始が遅れた患者に対しても有効性を発揮し, 病態進展を抑制すると考えられる. また, エンシトレルビルフマル酸は, 予防を目的として SARS-CoV-2 感染前に投与した場合にも有効性を発揮し, 病態進展を抑制すると考えられる.

2.6.1.2 申請した臨床適応, 用量及び投与期間

申請品目：ゾコーバ錠 125 mg, 同錠 25 mg

(1) 効能又は効果

SARS-CoV-2 による感染症の治療及びその予防

(2) 用法及び用量

＜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．

年齢	体重	用量	
		1 日目	2 日目から 5 日目
成人及び 12 歳以上の小児	―	375mg	125mg
6 歳以上 12 歳未満の小児	40kg 以上	375mg	125mg
	30kg 以上 40kg 未満	250mg	125mg
	20kg 以上 30kg 未満	150mg	75mg

＜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．