

毒薬・劇薬等の指定審査資料のまとめ

化学名・別名	(6E)-6-[(6-クロロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)イミノ]-3-[(1-メチル-1H-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 ーフマル酸																																
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																																	
市販名及び有効成分・分量	原体：ファボトレルビル 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 <table border="1"> <thead> <tr> <th>動物種</th> <th>性</th> <th>投与経路</th> <th>概略の致死量</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>ラット¹⁾</td> <td>雄</td> <td>経口</td> <td>>2000 mg/kg</td> </tr> <tr> <td>サル²⁾</td> <td>雌雄</td> <td>経口</td> <td>>1000 mg/kg</td> </tr> </tbody> </table> <p>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</p> 亜急性毒性 <table border="1"> <thead> <tr> <th>動物種</th> <th>投与期間</th> <th>投与経路</th> <th>投与量 (mg/kg/日)</th> <th>無毒性量 (mg/kg/日)</th> <th>主な所見</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>ラット</td> <td>2 週間</td> <td>経口</td> <td>0, 20, 100, 1000</td> <td>1000</td> <td>毒性変化なし</td> </tr> <tr> <td>ラット</td> <td>4 週間</td> <td>経口</td> <td>0, 20, 50, 1000</td> <td>1000</td> <td>毒性変化なし</td> </tr> </tbody> </table>			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	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
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																														
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	副作用発現率 14.9% (24/161 例) ^注					
	副作用の種類					件数
	高比重リポ蛋白減少					16
					等	
注: T1221 試験 Phase 2a Part, Phase 2b Part の結果を参照						
会社	塩野義製薬株式会社					