

▼ゾコーバ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】 エンシトレルビル フマル酸 Ensitrelvir Fumaric Acid 【分類】 抗SARS-CoV-2 剤 [PI]

【単位】 ▼125mg/錠

【常用量】 ■12 歳以上の小児及び成人

■初日 375mg (3 錠), 2～5 日目に 125mg (1 錠) /日

【用法】 1 日 1 回

■初回投与は発症後 72 時間以内に開始

■無症状例には適用しない (重症例での有効性は検討されていない)

■妊娠可能女性には禁忌

■併用薬を全て確認する

【透析患者への投与方法】 データがなく勧められない (1)

他により効果的な選択が存在するため、本剤選択の優先度は低い (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 健康成人との AUC 比は eGFR 60 以上 90 未満で 1.44 倍, eGFR 30 以上 60 未満で 1.49 倍, eGFR30 未満で 1.60 倍 (1)
AUC 比 1.2-2.0 倍程度で減量は不要と思われる (Katsube T, et al: Infect Dis Ther 2024 PMID: 38460082)

CKD が重症化リスク因子ならば、他により効果的な選択が存在するため、本剤選択の優先度は低い (5)

【特徴】 SARS-CoV-2 3CL プロテアーゼを阻害し、ポリタンパク質の切断を阻止することでウイルスの複製を抑制。

現状では、症状のある重症化リスクのない男性患者のみが適用になり、治療の必要性評価には後遺症抑制を含めたさらなるデータが要求される。

【主な副作用・毒性】 アナフィラキシー, HDL-C 低下, TG 上昇, 発疹, かゆみ, 消化器症状など

【安全性に関する情報】

【吸収】 AUC は食事の影響を受けない (1) 九州における P-gp, BCRP の関与は否定的 (Watari R, et al: J Pharm Sci 2024 PMID: 38885812)

【F】 85.5% [ラット] (1)

【tmax】 2.5～4hr (1)

【代謝】 肝で酸化, グルクロン酸抱合, メチル化, クロル化などを受ける (1) CYP3A の基質であり, 強い CYP3A 阻害作用を有する (1) CYP2B6, 3A を誘導 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 19% [po], 尿中に代謝物として 6.5%回収 (1) 糞便中に未変化体が 50.7%, 代謝物が 12%回収 (1)

P-gp, BCRP の基質 (1)

【CL/F】 0.219～0.315 L/hr (1)

【t1/2】 42～48hr (1)

【蛋白結合率】 98% [Alb] (1)

【Vd/F】 13.5～20.6 L/body (1)

【MW】 647.95 [salt]

【透析性】 資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【O/W 係数】 LogP=1.06 (1)

【相互作用】 禁忌, 併用注意が多数あり全ての併用薬を確認する必要がある (1) CYP3A を時間依存的に阻害, CYP2B6 及び CYP3A を誘導, P-gp, BCRP, OATP1B1 及び OATP1B3, OAT3, OCT1 を阻害 (1)

タクロリムス血中濃度が 3 倍に上昇 (Naganawa H, et al: J Pharm Health Care Sci 2024 PMID: 38987842)

【肝障害患者への投与方法】 投与しない (1)

【小児 CKD 患者における報告】 12 歳以下には投与しない (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】 投与しない (1)

【主な臨床報告】 スワクチン 2 回以上接種集団において, BA.2 株流行期の COVID-19 発症 72 時間以内に開始すると, 関連 5 症状の消失をプラセボに比べ 1 日短縮 (Yotsuyanagi H, et al: JAMA Netw Open 2024 PMID: 38335000)

急性期症状および慢性期症状のリスク軽減 [sponsored by Shionogi] (Yotsuyanagi H, et al: Antiviral Res 2024 PMID: 38972603)

モルスビラビルより抗原陰性化しやすいが, 臨床効果は同等 (Yoshida R, et al: Cureus 2024 PMID: 38915977)

無症状, 軽症 COVID-19 患者への適用は発熱を除く諸症状の改善効果を認めた (Ohmagari N, et al: Influenza Other Respir Viruses 2024 PMID: 38890511)

平均 90 歳の 9 例に適用して COVID-19 重篤化なし (Tomita T, et al: Medicine (Baltimore) 2024 PMID: 39058834)

【更新日】 20241031