



Press Release

2024年12月27日

日本イーライリリー株式会社
田辺三菱製薬株式会社

持続性 GIP/GLP-1 受容体作動薬「ゼップバウンド®」 複合的な要因からなる慢性疾患「肥満症*」を適応症として 国内製造販売承認を取得

日本イーライリリー株式会社(本社:兵庫県神戸市、代表取締役社長:シモーネ・トムセン、以下、日本イーライリリー)と田辺三菱製薬株式会社(本社:大阪府大阪市、代表取締役:辻村 明広、以下、田辺三菱製薬)は、本日2024年12月27日、複合的な要因からなる慢性疾患である「肥満症*」を効能・効果として、持続性GIP/GLP-1受容体作動薬「ゼップバウンド®」(一般名:チルゼパチド、以下、ゼップバウンド)の日本における製造販売承認を、日本イーライリリーが厚生労働省より取得しましたことをお知らせいたします。

*承認されたゼップバウンドの適応症は、「肥満症 ただし、高血圧、脂質異常症又は2型糖尿病のいずれかを有し、食事療法・運動療法を行っても十分な効果が得られず、以下に該当する場合に限る。
・BMIが27 kg/m²以上であり、2つ以上の肥満に関連する健康障害を有する ・BMIが35 kg/m²以上」です。

ゼップバウンドは、グルコース依存性インスリン分泌刺激ポリペプチド(GIP)とグルカゴン様ペプチド-1(GLP-1)の二つの受容体に作用する持続性GIP/GLP-1受容体作動薬です。ゼップバウンドは、天然GIPペプチド配列をベースとした単一分子ですが、GLP-1受容体にも結合するように改変されており、選択的に長時間作用するため週1回投与が可能です。両社が2型糖尿病治療薬として販売中で同分子のマンジャロ®同様、本剤は1回使い切りのオートインジェクター型注入器「アテオス®」により、週1回皮下注射で投与されます。用量も同様に2.5mg、5mg、7.5mg、10mg、12.5mg、15mgの6規格のラインナップで、状態に応じての使い分けが可能です。

日本イーライリリーの糖尿病・成長ホルモン事業本部長であるゲイリー・マイルズは次のように述べています。「この度のゼップバウンドの承認取得により、日本の肥満症のある方へ革新的な治療選択肢をお届けできることを大変嬉しく思います。肥満症は、QOL(生活の質)の低下だけでなく、更に他の健康障害を引き起こすリスクや、既に患っている他の疾患を悪化させるリスクがあります。それにもかかわらず、これまでは治療選択肢が限られていたこともあり、他の慢性疾患と同じレベルの必要な診断や治療がなされてこなかった現状があります。ゼップバウンドを通じて、肥満症のある方がエビデンスに基づく最適な治療を享受し、より充実した生活を送ることができるよう取り組んでまいります。」

田辺三菱製薬の日本医薬事業本部長 倉垣 康隆は次のように述べています。「ゼップバウンドが日本で承認されたことを大変喜ばしく思います。肥満には、遺伝的、身体的、心理的、社会的など複合的な要因があり、生活習慣だけが原因ではないにもかかわらず、肥満に対するスティグマ(偏見)が社会課題として存在しています。ゼップバウンドという新しい治療選択肢の登場をきっかけに、慢性疾患である肥満症が正しく理解され、肥満症のある人がよりよい生活を送ることができるよう、貢献できることを期待しています。」

今回のゼップバウンドの承認は、主に、国内第3相臨床試験であるSURMOUNT-J試験において検討された、肥満症の日本人成人に対するチルゼパチドの有効性および安全性の結果に基づいています。SURMOUNT-J試験では、72週時の体重のベースラインからの平均変化率は、プラセボ群(n=75)1.7%減に対して、チルゼパチド10mg群(n=71)17.8%減、チルゼパチド15mg群(n=76)22.7%減と、チルゼパチド両群でプラセボ群に対

する優越性が示されました。また、「5%以上の体重減少を達成した試験参加者の割合」は、プラセボ群の20.0%に対してチルゼパチド10mg群94.4%、チルゼパチド15mg群96.1%と、両群ともにプラセボ群に対する優越性を示しました。さらに、副次評価項目として、72週時の体重がベースラインから7%以上減、10%以上減、15%以上減、20%以上減、とそれぞれの達成率を比較したところ、いずれの評価項目においてもチルゼパチド両群で、プラセボ群に対する優越性が示されました。

日本におけるゼップバウンドの提供については、マンジャロ同様、田辺三菱製薬が流通・販売を行い、日本イーライリリーと田辺三菱製薬が共同で情報提供活動を行います。日本イーライリリーと田辺三菱製薬は、肥満症のある人々のより豊かな人生を実現するため、さまざまな研究開発や肥満症に関わる人々との活動を通じ、引き続き最善を尽くしてまいります。

以上

製品概要

販売名	ゼップバウンド®皮下注 2.5 mg アテオス® ゼップバウンド®皮下注 5 mg アテオス® ゼップバウンド®皮下注 7.5 mg アテオス® ゼップバウンド®皮下注 10 mg アテオス® ゼップバウンド®皮下注 12.5 mg アテオス® ゼップバウンド®皮下注 15 mg アテオス®
一般名	チルゼパチド
効能又は効果	肥満症 ただし、高血圧、脂質異常症又は2型糖尿病のいずれかを有し、食事療法・運動療法を行っても十分な効果が得られず、以下に該当する場合に限る。 ・BMIが27 kg/m ² 以上であり、2つ以上の肥満に関連する健康障害を有する ・BMIが35 kg/m ² 以上
用法及び用量	通常、成人には、チルゼパチドとして週1回2.5 mgから開始し、4週間の間隔で2.5 mgずつ増量し、週1回10 mgを皮下注射する。 なお、患者の状態に応じて適宜増減するが、週1回5 mgまで減量、又は4週間以上の間隔で2.5 mgずつ週1回15 mgまで増量できる。
製造販売承認日	2024年12月27日
製造販売元	日本イーライリリー株式会社
販売元	田辺三菱製薬株式会社

肥満と肥満症について

日本における「肥満」は、脂肪組織に脂肪が過剰に蓄積した状態で、体格指数、BMI25以上のものと定義されています。尚、BMIが35以上の場合は、高度肥満となります。

一方で「肥満症」は、肥満(BMI25以上)があり、かつ肥満に起因ないし関連する健康障害(合併症)を1つ以上有するか、あるいは内臓脂肪蓄積がある場合など関連健康障害の合併が予測され、医学的に減量を必要とする病態と定義されており、減量による医学的治療の対象になる慢性疾患です。

肥満や肥満症は、生活習慣のみならず遺伝や環境などの様々な要因が関与しており、他の様々な健康障害と密接に関連していると言われております。

日本には「肥満」に該当する人口が2,800万人いるとされていますが、そのうち肥満に関連する健康障害を合併する「肥満症」の診断や治療は他の慢性疾患に比べて積極的に行われていない状況があります。

肥満症の診断に必要な健康障害

- 1) 耐糖能障害(2型糖尿病・耐糖能異常など)
- 2) 脂質異常症
- 3) 高血圧
- 4) 高尿酸血症・痛風
- 5) 冠動脈疾患
- 6) 脳梗塞・一過性脳虚血発作
- 7) 非アルコール性脂肪性肝疾患
- 8) 月経異常・女性不妊
- 9) 閉塞性睡眠時無呼吸症候群・肥満低換気症候群
- 10) 運動器疾患(変形性関節症:膝・股関節・手指関節、変形性脊椎症)
- 11) 肥満関連腎臓病

チルゼパチドについて

チルゼパチドは、グルコース依存性インスリン分泌刺激ポリペプチド(GIP)とグルカゴン様ペプチド-1(GLP-1)の二つの受容体に作用する持続性GIP/GLP-1受容体作動薬です。本剤の構造は、天然GIPペプチド配列をベースとした単一分子ですが、GLP-1受容体にも結合するように改変されており、選択的に長時間作用するため週1回投与が可能です。チルゼパチドは日本において、2023年4月に2型糖尿病治療薬マンジャロとして発売され、2.5mgから15mgまでの6規格を販売しており、既に臨床において多くの2型糖尿病のある人々に使用されています。世界においても、多くの国で2型糖尿病治療薬として販売されており、肥満治療薬としても米国およびその他数か国において承認されています。米国では肥満症治療薬として、昨年12月よりZepbound®の製品名で発売されています。

SURMOUNT-J試験について

SURMOUNT-J試験(NCT04844918)は、肥満または高度肥満、かつ肥満に関連する健康障害(耐糖能異常、脂質異常症または非アルコール性脂肪性肝疾患のうち、肥満の場合は2つ以上、高度肥満の場合は1つ以上該当)を有する日本人の成人を対象に、チルゼパチド10mgおよび15mgを週1回皮下投与したときの安全性および有効性をプラセボと比較した、第3相多施設共同無作為化プラセボ対照二重盲検試験です。試験参加者は、それぞれプラセボ群、チルゼパチド10mg群、チルゼパチド15mg群の3群に割り付けられ、4週間のスクリーニング期間を経た後、用量漸増期間として1回2.5mg週1回皮下投与から開始し、4週ごとに投与量を2.5mgずつ増量しました。それぞれの投与群が規定用量(チルゼパチド10mgまたは15mg)にまで達した時点で投与量を固定し、その後72週の試験終了時点まで投与が継続されました。

本試験は、肥満症診療ガイドライン²⁾に記載されている、体重管理のための低カロリー食事療法および運動療法下で実施されました。試験期間中は、すべての試験参加者に対して管理栄養士または同等の資格を有する者による食事および運動に関するカウンセリングが実施されました。

また試験除外基準として、糖尿病のある人、糖尿病の診断基準となる臨床検査値が認められた人、肥満に対して内視鏡または機器による治療歴がある、または治療予定がある人、無作為化3カ月以内に減量を目的とした薬物治療歴がある、または体重減少を引き起こす可能性がある薬剤による治療歴がある人は、除外されました。詳細は[プレスリリース](#)をご参照ください。

日本イーライリリーについて

日本イーライリリー株式会社は、米国イーライリリー・アンド・カンパニーの日本法人です。日本の患者さんが健康で豊かな生活を送れるよう、日本で50年にわたり最先端の科学に思いやりを融合させ、世界水準の革新的な医薬品を開発し提供してきました。現在、がん、糖尿病、アルツハイマー病などの中枢神経系疾患や自己免疫疾患など、幅広い領域で日本の医療に貢献しています。詳細はウェブサイトをご覧ください。

<https://www.lilly.com/jp>

田辺三菱製薬について

三菱ケミカルグループ(MCG)のファーマ部門である田辺三菱製薬は、1678年に創業、日本の医薬品産業発祥の地である大阪の道修町に本社を置き、医療用医薬品事業を中心とする製薬企業として、最も歴史ある老舗企業の一つです。当社は、「病と向き合うすべての人に、希望ある選択肢を。」をMISSIONとし、これを実現するため、中枢神経、免疫炎症、糖尿病・腎領域に加え、がん領域にも取り組んでいきます。有効性・安全性が高い患者層を見出し、治療満足度の高い薬剤をお届けする「プレジジョンメディシン」の他、予防・未病、重症化予防、予後にも目を向け、治療薬を起点に患者さんの困りごとに応える「アラウンドピルソリューション」を展開していきます。<https://www.mt-pharma.co.jp/>

References:

1:国民健康・栄養調査(令和元年) [令和4年国民健康・栄養調査 結果公表 | 厚生労働省](#)

2:肥満症診療ガイドライン 2022 [学会誌: 日本肥満学会/JASSO](#)