# ゼップバウンド皮下注 2.5mg アテオス
# ゼップバウンド皮下注 5mg アテオス
# ゼップバウンド皮下注 7.5mg アテオス
# ゼップバウンド皮下注 10mg アテオス
# ゼップバウンド皮下注 12.5mg アテオス
# ゼップバウンド皮下注 15mg アテオス

## 2.2　緒言

日本イーライリリー株式会社

# 目次

2.2　緒言..... 1

## 2.2　緒言

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（glucose-dependent insulinotropic polypeptide：GIP）受容体及びグルカゴン様ペプチド-1（glucagon-like peptide-1：GLP-1）受容体の両方に結合するアゴニストであり、国内では、2022 年 9 月に「2 型糖尿病」を効能又は効果として承認されている（販売名：マンジャロ皮下注）。

消化管ホルモンのインクレチンである GIP 及び GLP-1 は、食後に消化管の内分泌細胞から分泌される。これらのインクレチンは、インクレチン効果（インスリン分泌促進作用）に加えて、満腹感及び栄養素の代謝など、食物に対する生理的反応を促進する。GLP-1 受容体アゴニストによる GLP-1 受容体シグナル伝達の活性化は、脳の食欲抑制経路を活性化することにより食物摂取量と体重を減少させる。非臨床及び臨床試験においても、チルゼパチドは GIP 受容体及び GLP-1 受容体の両方でアゴニストとして機能し、食物及びカロリー摂取量を減少させる可能性が確認されている。GIP と GLP-1 の既知の生理学と薬理学に基づく、両受容体へのシグナル伝達は、選択的 GLP-1 受容体アゴニスト単独の作用以上に炭水化物、脂質代謝、及び体重のコントロールを改善すると予想される。

今回、チルゼパチドの肥満症を適応とする開発を目標として、チルゼパチドの肥満症患者を対象とした国内第 3 相試験（I8F-JE-GPHZ 試験）、及び日本人を含む肥満又は過体重の被験者を対象とした国際共同第 3 相試験（I8F-MC-GPHK 試験、I8F-MC-GPHL 試験）を実施し、評価資料とした。

試験の結果から、チルゼパチドは、肥満症、肥満、又は過体重の様々な臨床的症状を呈する被験者集団に対して、臨床的に意味のある体重減少をもたらし、肥満症の治療に対して承認されているインクレチン関連薬と同様の安全性プロファイルを有していることが示された。

今般、これらの試験成績に基づくベネフィット・リスク評価の結果から、当該疾患に対するチルゼパチドの高い有用性が示され、新たなより優れた治療の選択肢となり得ると考えられることから、以下の効能又は効果、用法及び用量で、販売名をゼップバウンド皮下注として製造販売承認申請を行うこととした。

【効能又は効果】

肥満症

ただし、耐糖能障害（2 型糖尿病、耐糖能異常等）、脂質異常症又は非アルコール性脂肪性肝疾患のいずれかを有し、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 10 mg を維持用量とし、皮下注射する。ただし、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 に増量する。

なお、患者の状態に応じて適宜増減するが、週 1 回 10 mg で効果不十分な場合は、4 週間以上の間隔で 2.5 mg ずつ増量できる。ただし、最大用量は週 1 回 15 mg までとする。