

Press Release

2026 年 6 月 1 日
日本イーライリリー株式会社
田辺ファーマ株式会社

持続性 GIP/GLP-1 受容体作動薬「ゼップバウンド®」 「中等症以上の閉塞性睡眠時無呼吸症候群」の適応追加承認を取得 さらに 肥満症の適応症に「耐糖能異常等」の追加承認を取得

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)と田辺ファーマ株式会社(本社:大阪市中央区、代表取締役 CEO:原田明久、以下、田辺ファーマ)は、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)について、2026 年 5 月 18 日、「中等症以上の閉塞性睡眠時無呼吸症候群(以下、閉塞性睡眠時無呼吸症候群)」に対する治療薬として効能又は効果の追加承認を取得したことをお知らせします。同時に、肥満症の効能又は効果に規定する健康障害として、「耐糖能異常等」の追加承認を取得したことをあわせてお知らせします。

■変更前の効能又は効果:

「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 $27\text{kg}/\text{m}^2$ 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 $35\text{kg}/\text{m}^2$ 以上

■変更後の効能又は効果:

「肥満症

ただし、高血圧、脂質異常症又は **耐糖能障害(2 型糖尿病、耐糖能異常等)** 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 $27\text{kg}/\text{m}^2$ 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 $35\text{kg}/\text{m}^2$ 以上

中等症以上の閉塞性睡眠時無呼吸症候群

ただし、BMI が $27\text{kg}/\text{m}^2$ 以上に該当する場合に限る。」

注) どちらの適応症についてもゼップバウンドは最適使用推進ガイドラインの対象であり、ガイドラインの内容は適応症によって異なります。詳細は厚生労働省の発表資料をご参照ください。

(<https://www.pmda.go.jp/review-services/drug-reviews/review-information/p-drugs/0028.html>)

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、中枢神経系における食欲調節と、脂肪細胞における脂質等の代謝亢進により、体重減少作用を示すと考えられています。

今回の「閉塞性睡眠時無呼吸症候群」の承認取得は、第 III 相国際共同試験であるプラセボ対照二重盲検比較試験の SURMOUNT-OSA 試験(「I8F-MC-GPI1 試験」および「I8F-MC-GPI2 試験」)における、投与 52 週時の有効性および安全性の結果に基づいています。また、「耐糖能異常等」の承認取得は、第 III 相国際共同試験であるプラセボ対照二重盲検比較試験の SURMOUNT-1 試験における、投与 176 週時の有効性および安全性の結果に基づいています。

日本イーライリリーのダイアベティス・オベシティ・心・腎領域事業本部 事業本部長 兼 営業本部長である小嶋 毅彦は次のように述べています。「この度、ゼップバウンドが閉塞性睡眠時無呼吸症候群および肥満症における耐糖能異常等の追加承認を取得したことにより、日本の閉塞性睡眠時無呼吸症候群を抱えられている方や、耐糖能異常のある肥満症の方へ、新たな治療選択肢をお届けできるようになったことを大変嬉しく思います。これまで、閉塞性睡眠時無呼吸症候群の治療法は選択肢が限られていました。また2型糖尿病は広く知られた治療法も豊富にある疾患ですが、耐糖能異常はその前段階の状態として一般的にはあまり知られておらず、同じく治療法が限られていました。ゼップバウンドにより、これまで満たされてこなかったこれらのアンメットニーズに応えられるようになったことは、非常に意義深い進展であると考えています。」

田辺ファーマの代表取締役社長 執行役員 Chief Operating Officerである辻村 明広は次のように述べています。「閉塞性睡眠時無呼吸症候群は、睡眠の質の低下にとどまらず、心血管疾患など深刻な合併症や呼吸困難による生命リスクの高い疾患です¹。また肥満症は、QOL(生活の質)の低下だけでなく、既に患っている他の疾患を悪化させるリスクや、さらに他の健康障害を引き起こすリスクがあります²。さらに耐糖能異常を持つ方は、神経障害や網膜症、腎機能障害等のリスクの高い方です³。今後は、睡眠時無呼吸症候群の方や、2型糖尿病には至っていないものの耐糖能異常を呈している方においても、エビデンスに基づく最適な治療を享受し、より健やかで充実した生活を送っていただけるよう、ゼップバウンドを通じて貢献してまいります。」

尚、日本におけるゼップバウンドの提供については、閉塞性睡眠時無呼吸症候群の適応についても、肥満症同様、田辺ファーマが流通・販売を行い、日本イーライリリーと田辺ファーマ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ファーマは、肥満症や閉塞性睡眠時無呼吸症候群のある人々のより豊かな人生の実現に貢献するため、研究開発や適正使用のための情報提供活動および疾患啓発活動を通じ、引き続き尽力してまいります。

以上

【参考情報】

SURMOUNT-OSA 試験「I8F-MC-GPI1 試験」について

ゼップバウンドの第 III 相国際共同試験であるプラセボ対照二重盲検比較試験の I8F-MC-GPI1 試験において、BMI が 30kg/m² 以上(日本人は BMI27kg/m² 以上)で、気道陽圧(PAP)療法を実施できない又は望まない、かつポリソムノグラフィーによる無呼吸低呼吸指数(AHI: Apnea-Hypopnea Index)が 15/h 以上の中等症以上の閉塞性睡眠時無呼吸症候群患者 234 例を対象に、二重盲検下で本剤の最大耐用量(10 又は 15mg)又はプラセボを週 1 回、52 週間皮下投与しました(チルゼパチド群:114 例(日本人:3 例)、プラセボ群:120 例(日本人:4 例))。チルゼパチドは週 1 回 2.5mg で投与を開始し、以後 4 週間ごとに 2.5mg ずつ増量しました。試験期間中、試験参加者は食事のカロリー制限及び身体活動の増加を併せて行いました。主要評価項目であるベースラインから投与 52 週時までの AHI 変化量は、チルゼパチドのプラセボに対する優越性が検証されました(p<0.001)。

副作用発現割合は、チルゼパチド群で 56.1%(64/114 例)及びプラセボ群で 24.2%(29/120 例)でした。主な副作用はチルゼパチド群では悪心 23.7%(27/114 例)、下痢 21.9%(25/114 例)、嘔吐 17.5%(20/114 例)及び便秘 14.9%(17/114 例)でした。なお、プラセボ群における悪心、下痢、嘔吐、便秘の発現割合は、それぞれ 7.5%(9/120 例)、5.0%(6/120 例)、1.7%(2/120 例)、1.7%(2/120 例)でした。血糖値 54mg/dL 未満の低血糖は、プラセボ群で 0.8%(1/120 例)認められ、本剤群では認められず、重症低血糖は認められませんでした。

SURMOUNT-OSA 試験「I8F-MC-GPI2 試験」について

ゼップバウンドの第 III 相国際共同試験であるプラセボ対照二重盲検比較試験の I8F-MC-GPI2 試験において、BMI が 30kg/m² 以上(日本人は BMI27kg/m² 以上)で、PAP 療法を実施中、かつポリソムノグラフィーによる AHI が 15/h 以上の中等症以上の閉塞性睡眠時無呼吸症候群患者 235 例を対象に、二重盲検下でチルゼパチドの最大耐用量(10 又は 15mg)又はプラセボを週 1 回、52 週間皮下投与した(チルゼパチド群:120 例(日本人:7 例)、プラセボ群:115 例(日本人:6 例))。チルゼパチドは週 1 回 2.5mg で投与を開始し、以後 4 週間ごとに 2.5mg ずつ増量しました。試験期間中、試験参加者は食事のカロリー制限及び身体活動の増加を併せて行いました。主要評価項目であるベースラインから投与 52 週時までの AHI 変化量は、本剤のプラセボに対する優越性が検証されました(p<0.001)。

副作用発現割合は、チルゼパチド群で 56.3%(67/119 例)及びプラセボ群で 21.9%(25/114 例)でした。主な副作用はチルゼパチド群では悪心 20.2%(24/119 例)、下痢 19.3%(23/119 例)、便秘 10.9%(13/119 例)及び消化不良 9.2%(11/119 例)でした。なお、プラセボ群における悪心、下痢、便秘、消化不良の発現割合は、それぞれ 3.5%(4/114 例)、6.1%(7/114 例)、4.4%(5/114 例)、0.0%(0/114 例)でした。血糖値 54mg/dL 未満の低血糖及び重症低血糖は認められませんでした。

SURMOUNT-1試験(「I8F-MC-GPHK試験」)について

ゼップバウンドの第 III 相国際共同試験であるプラセボ対照二重盲検比較試験の SURMOUNT-1 試験において、無作為割付された 2,517 例の肥満症患者のうち、スクリーニング時に前糖尿病状態を有する被験者(1,021 例)を、二重盲検下でチルゼパチド 5mg 群(245 例)、10mg 群(258 例)、15mg 群(252 例)またはプラセボ群(266 例)に割付け、週 1 回、176 週間皮下投与し、長期の体重管理および 2 型糖尿病の発症リスクを評価しました。

176 週時のベースラインからの体重変化率は、チルゼパチド 10mg および 15mg 群がプラセボ群に対して優越性を示し、減量体重の維持を示しました(プラセボ比 $p < 0.0001$)。また、ベースラインから 176 週時までのチルゼパチド 5mg、10mg および 15mg の用量併合群は、プラセボ群と比較して 94%の有意な 2 型糖尿病の発症リスク低減を示しました。

副作用発現割合は、プラセボ群の 36.5%に対し、チルゼパチド 5mg 群で 55.5%、10mg 群で 65.1%、15mg 群で 63.1%でした。主な副作用は消化器系症状で、チルゼパチド 5mg 群で悪心(19.6%)、下痢(13.9%)、便秘(13.5%)、10mg 群で悪心(29.5%)、下痢(23.3%)、便秘(15.9%)、15mg 群で悪心(27.8%)、下痢(19.0%)、便秘(13.1%)、消化不良(11.9%)、嘔吐(11.5%)でした。プラセボ群における発現割合は、悪心(9.8%)、下痢(7.1%)、便秘(6.8%)、消化不良(3.8%)、嘔吐(0.0%)でした。

※今回追加承認を取得した「耐糖能異常等」とは

以下の①～③のうち2つ以上に該当又は糖尿病型に該当し、糖代謝関連検査等から2型糖尿病の発症リスクが高いと考えられる患者

- ①空腹時血糖値が100～125mg/dL
- ②75g経口ブドウ糖負荷試験(OGTT)における2時間値が140～199mg/dL
- ③HbA1cが5.7%～6.4%

製品概要

販売名	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®
一般名	チルゼパチド
効能又は効果	肥満症 ただし、高血圧、脂質異常症又は耐糖能障害(2 型糖尿病、耐糖能異常等)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 27kg/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 35kg/m ² 以上 中等症以上の閉塞性睡眠時無呼吸症候群 ただし、BMI が 27kg/m ² 以上に該当する場合に限る。
用法及び用量	<u>肥満症</u> 通常、成人には、チルゼパチドとして週1回2.5mgから開始し、4週間の間隔で2.5mgずつ増量し、週1回10mg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5mgまで減量、又は4週間以上の間隔で2.5mgずつ週1回15mgまで増量できる。 <u>中等症以上の閉塞性睡眠時無呼吸症候群</u> 通常、成人には、チルゼパチドとして週1回2.5mgから開始し、4週間の間隔で2.5mgずつ増量し、週1回15mgを皮下注射する。 なお、忍容性が認められない場合には、週1回10～15mgの範囲で投与量を調整することができる。

薬価	ゼップバウンド®皮下注2.5mgアテオス®	0.5mL 1キット:	3,067円
	ゼップバウンド®皮下注5mg アテオス®	0.5mL 1キット:	5,797円
	ゼップバウンド®皮下注7.5mgアテオス®	0.5mL 1キット:	7,721円
	ゼップバウンド®皮下注10mgアテオス®	0.5mL 1キット:	8,999円
	ゼップバウンド®皮下注12.5mgアテオス®	0.5mL 1キット:	10,180円
	ゼップバウンド®皮下注15mgアテオス®	0.5mL 1キット:	11,242円
製造販売承認取得日	2024年12月27日		
薬価基準収載日	2025年3月19日		
発売日	2025年4月11日		
適応変更承認取得日	2026年5月18日		
製造・販売元	製造販売元: 日本イーライリリー株式会社 / 販売元: 田辺ファーマ株式会社		
備考	<p>ゼップバウンドは最適使用推進ガイドラインの対象薬剤であり、ガイドラインの内容は適応症によって異なります。詳細は厚生労働省の発表資料をご参照下さい。</p> <p>https://www.pmda.go.jp/review-services/drug-reviews/review-information/p-drugs/0028.html</p>		

製品画像



左側より 2.5mg、5mg、7.5mg、10mg、12.5mg、15mg の 6 規格

ゼップバウンドについて

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。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、皮下注射で投与されます。用量は2.5mg、5mg、7.5mg、10mg、12.5mg、15mgの6規格のラインナップで、状態に応じた使い分けが可能です。

閉塞性睡眠時無呼吸症候群について¹

閉塞性睡眠時無呼吸症候群は、睡眠中に気道が閉塞することによって無呼吸状態となる、睡眠に関連する呼吸障害の一つです。通常いびきを伴い、肥満や加齢、男性であることなどが重要な発症要因と考えられています。睡眠が十分にとれず、日中に過度な眠気をきたすことにより、QOLや作業効率の低下、自動車事故のリスク増加など、日常生活に支障をきたすことがあります。様々な併存疾患リスクとも関連し、重度の場合には生命にかかわる可能性もあるリスクの高い病気です。一方で、当事者自身で気づきにくい側面もあり、治療が十分に行き届いていない場合も多く、アンメットニーズの高い疾患とされています。

耐糖能異常について³

耐糖能異常(IGT)は、世界保健機構(WHO)の糖尿病診断基準に取り入れられた分類であり、空腹時血糖値が126mg/dL未満かつ75gOGTT(経口ブドウ糖負荷試験)2時間値が140~199mg/dLの群と定義されています。日本人において、ベースラインの空腹時血糖値やHbA1cの値と、ベースライン時点、5年後、あるいは27年後の網膜症との関連を検討したそれぞれの研究において、動脈硬化性合併症のリスクがIGTの時点から増加することが知られており、IGTへの介入が重要であるとされています⁴。またIGTは2型糖尿病へ悪化するリスクが高く、生活指導(食事、運動、肥満があればその是正)を行い、定期的に検査することが推奨されています。

肥満症について⁵

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(BMI)25以上と定義されています。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しています。

日本には「肥満」に該当する人口が2,800万人⁶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) | 7) 非アルコール性脂肪性肝疾患 |
| 2) 脂質異常症 | 8) 月経異常・女性不妊 |
| 3) 高血圧 | 9) 閉塞性睡眠時無呼吸症候群・肥満低換気症候群 |
| 4) 高尿酸血症・痛風 | 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) |
| 5) 冠動脈疾患 | 11) 肥満関連腎臓病 |
| 6) 脳梗塞・一過性脳虚血発作 | |

肥満症治療について

肥満症治療の目的は、減量ではなく、減量により肥満に関連する健康障害を改善することです。肥満症治療は、肥満症と診断された人を対象としたもので、合併症の予防や改善を目的とする医療です。美容・痩身のためのダイエットなどを目的として行われるものではありません。肥満症治療薬等については、医師による診断のもと、電子添文の内容を遵守の上、適正な使用をいただくようご協力をお願いしています。肥満症の診断・治療方針については、必ず医師にご相談いただけますようお願い申し上げます。

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、米国に本社をおくグローバル製薬企業イーライリリー・アンド・カンパニーの日本法人として、最先端の科学技術を基盤とした革新的医薬品の研究開発および供給に、50年以上にわたり継続的に取り組んでいます。ダイアベティス(糖尿病)、肥満症、がん、アルツハイマー病を含む中枢神経系疾患、自己免疫疾患など幅広い領域において医療の可能性を切り拓き、誰もが必要な医療を安心して受けられる社会づくりや、人々の健康で豊かな人生の実現に貢献してまいります。

詳細は当社ウェブサイトをご覧ください。<https://www.lilly.com/jp>

田辺ファーマについて

田辺ファーマは、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。<https://www.tanabe-pharma.com/ja/>

出典:

- 1: 日本呼吸器学会監修. 睡眠時無呼吸症候群(SAS)の診療ガイドライン 2020. 南江堂. 2020.
- 2: Jastreboff AM, et al.: Obesity (Silver Spring). 2019; 27(1): 7-9. / Ansari S, et al.: Ther Adv Endocrinol Metab. 2020; 11: 1-14. / Fitch AK, et al.: Obes Pillars. 2022; 1: 100004. / Hotoleanu C.: Med Pharm Rep. 2020; 93(2): 162-168.
- 3: 日本糖尿病学会「糖尿病診療ガイドライン 2024」 1 章
- 4: American Diabetes Association Professional Practice Committee. Classification and diagnosis of diabetes: standards of medical care in diabetes-2022. Diabetes Care 45(Suppl 1):S17-S38, 2022)
- 5: [日本肥満学会「肥満症診療ガイドライン 2022」, p.1-2](#)
- 6: 厚生労働省 国民健康・栄養調査(令和元年) <https://www.mhlw.go.jp/content/10900000/000687163.pdf> の「肥満者の割合」と 2019 年人口推計より算出)