

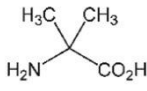
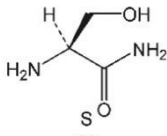
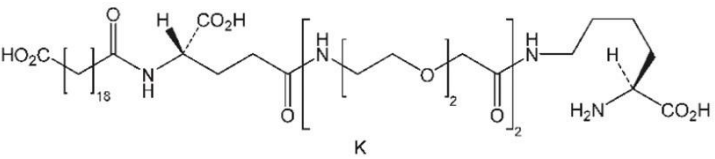
## DI 委員会トピックス

### 持続性GIP/GLP-1受容体作動薬 マンジャロ<sup>®</sup>皮下注アテオス<sup>®</sup>

2型糖尿病は、高齢化や運動不足、生活習慣の変化などが原因で増加傾向にある。糖尿病の治療は進歩しており、さまざまな治療薬が登場しているが、血糖コントロールが十分に改善されていない患者は依然と多いのが現状である。

本剤は、世界初の GIP(グルコース依存性インスリン分泌刺激ポリペプチド)/GLP-1(グルカゴン様ペプチド-1)受容体作動薬である。SURPASS J-mono 試験において、2型糖尿病患者への投与ではマンジャロ 5mg 群、10mg 群、15mg 群はトルリシティ 0.75mg 群に比べて、主要評価項目である HbA1c のベースラインから投与 52 週時までの変化量において優越性が検証され、体重の変化量においても優越性が検証されている。SURPASS-2 試験では、マンジャロ 5mg 群、10mg 群、15mg 群はオゼンピック 1mg 群に比べて、HbA1c のベースラインから投与 40 週時までの変化量で優越性が検証され、体重の変化量においても優越性が検証されている。また、注射針の扱いや用量設定が不要な 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』であり、当てて押すだけで自動的に注入されるため手技が簡単になっている。

上記のことから、マンジャロ皮下注は血糖降下作用や体重減少作用が高く、目標の HbA1c 値に達していない患者や食事療法や運動療法に取り組んでいても思うような効果が得られていない患者に効果が期待される。また、優れた操作性に加え、2.5mg から 15mg にかけて 2.5mg 刻みの 6 規格を有することから治療効果や副作用に応じて細やかな用量変更が可能のため、より患者に合わせた治療が可能になると期待される。

薬剤名	マンジャロ <sup>®</sup> 皮下注2.5mg/5mg/7.5mg/10mg/12.5mg/15mgアテオス <sup>®</sup>
一般名	チルゼパチド
組成	1キット中 チルゼパチド2.5mg/5mg/7.5mg/10mg/12.5mg/15mg リン酸水素二ナトリウム七水和物:0.7mg 塩化ナトリウム:4.1mg 塩酸:適量 水酸化ナトリウム:適量
構造式	<p style="text-align: center;">YXEGTFTSDY SIXLDKIAQK AFGWLIAGG PSSGAPPPS</p> <div style="display: flex; justify-content: space-around; align-items: center;"> <div style="text-align: center;">  <p>X 2, 13 2-methylAla</p> </div> <div style="text-align: center;">  <p>S 39 Ser-NH<sub>2</sub></p> </div> </div> <div style="text-align: center; margin-top: 20px;">  <p>K 20 N<sup>6</sup>-{N-(hydrogen icosanedioyl)- γ-Glu-bis[iminobis(ethylenoxy)acetyl]}-Lys</p> </div>

分子式・分子量	分子式：C <sub>225</sub> H <sub>348</sub> N <sub>48</sub> O <sub>6</sub> 分子量：4813.45
性状	無色～ 微黄色～ 微褐色の澄明又はわずかに乳白光を呈する液
効能・効果	2型糖尿病
用法・用量	通常、成人には、チルゼパチドとして週1回5mgを維持用量として、皮下注射する。ただし、週1回2.5mgから開始し、4週間投与した後、週1回5mg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5mgで効果不十分な場合は、4週間以上の間隔で2.5mgずつ増量できる。ただし、最大用量は週1回15mgまでとする。
包装	0.5mL×2キット
薬価	2.5mg:1,924円 5mg:3,848円 7.5mg:5,772円 10mg:7,689円 12.5mg:9,620円 15mg:11,544円
作用機序	本剤はGIP受容体及びGLP-1受容体のアゴニストであり、両受容体に結合して活性化することで、グルコース濃度依存的にインスリン分泌を促進させる。本剤はC20脂肪酸側鎖を含む39個のアミノ酸からなるペプチドであり、内因性アルブミンと結合して消失半減期が延長することにより作用が持続する。

マンジャロ、トルリンティ、オゼンピックの比較

商品名	マンジャロ	トルリンティ	オゼンピック
一般名	チルゼパチド	デュラグルチド	セマグルチド
分類	持続性GIP/GLP-1受容体作動薬	持続性GLP-1受容体作動薬	
構造	C20脂肪酸側鎖を含む39個のアミノ酸からなるペプチド	アミノ酸を置換したヒトGLP-1アナログと改変ヒトIgG4 Fc領域との融合タンパク質	31個のアミノ酸残基からなる修飾ペプチド
規格	2.5mg、5mg、7.5mg、10mg、12.5mg、15mg	0.75mg	2mg
適応症	2型糖尿病		
用法	週に1回、皮下注射		
用量	初回:2.5mg 維持:5mg 最大:15mg 4週ごとに2.5mgずつ増量	0.75mg	初回:0.25mg 維持:0.5mg 最大:1mg 4週投与後に増量
デバイス	オートインジェクター型注入器『アテオス』		ペン型注入器『フレックスタッチ』

1回用量	0.5ml		0.25mg:0.19ml 0.5mg:0.37ml
包装	0.5mL×2キット		1筒1.5mL:1本
針のサイズ	29G		30～34G
空打ち	不要		初回のみ必要
禁忌	本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 糖尿病性ケトアシドーシス、糖尿病性昏睡又は前昏睡、1型糖尿病の患者 重症感染症、手術等の緊急の場合		
半減期	約5～6日	4.5日(108時間)	約6日(145時間)
保管方法	凍結を避け、2～8℃で遮光保存 室温遮光時は21日間	凍結を避け、2～8℃で遮光保存 室温遮光時は14日間	凍結を避け、2～8℃で遮光保存 使用開始後は遮光室温保管にて8週間以内
投与忘れ時の対応	次回投与までの期間が3日間(72時間)以上であれば、気づいた時点で直ちに投与し、その後はあらかじめ定めた曜日に投与する		次回投与までの期間が2日間(48時間)以上であれば、気づいた時点で直ちに投与し、その後はあらかじめ定めた曜日に投与する
薬価	2.5mg:1,924円 5mg:3,848円 7.5mg:5,772円 10mg:7,689円 12.5mg:9,620円 15mg:11,544円	0.75mg:2,807円	2.0mg:11,008円
製造販売元	日本イーライリリー株式会社	日本イーライリリー株式会社	ノボ ノルディスク ファーマ株式会社
販売元	田辺三菱製薬株式会社	日本イーライリリー株式会社	ノボ ノルディスク ファーマ株式会社

<参考資料>

- ・マンジャロ<sup>®</sup>皮下注 2.5mg/5mg/7.5mg/10mg/12.5mg/15mg アテオス<sup>®</sup>添付文書
- ・マンジャロ<sup>®</sup>皮下注 2.5mg/5mg/7.5mg/10mg/12.5mg/15mg アテオス<sup>®</sup>インタビューフォーム
- ・トルリシティ<sup>®</sup>皮下注 0.75mg アテオス<sup>®</sup>添付文書
- ・トルリシティ<sup>®</sup>皮下注 0.75mg アテオス<sup>®</sup>インタビューフォーム
- ・オゼンピック<sup>®</sup>皮下注 2mg 添付文書
- ・オゼンピック<sup>®</sup>皮下注 2mg インタビューフォーム
- ・SURPASS J-mono 試験
- ・SURPASS-2 試験