

No.12-38

2012年6月28日
エーザイ株式会社

米国 FDA が肥満症治療剤「BELVIQ[®]」(一般名 lorcaserin HCl)を承認
---成人の肥満症に対する処方薬として 13 年ぶりの新薬承認---

エーザイ株式会社(本社:東京都、社長:内藤晴夫、以下 エーザイ)は、アリーナ・ファーマシューティカルズ・インク(Arena Pharmaceuticals, Inc. 本社:米国カリフォルニア州、社長:ジャック・リーフ、以下 アリーナ社)が、2012年6月27日(米国現地時間)、「BELVIQ[®]」(一般名 lorcaserin hydrochloride)について、ボディ・マス・インデックス(BMI)が 30kg/m²以上、あるいは少なくとも1つ以上の合併症を患うBMIが 27kg/m²以上の成人患者様の体重管理を目的とした食事療法と運動療法に対する補助療法として、米国食品医薬品局(FDA)より承認を取得したと、発表しました。このたびの承認は、米国における肥満症治療の処方薬としては13年ぶりとなります。

米国疾病対策予防センター(Centers for Disease Control and Prevention)によると、米国成人の3分の2以上は肥満又は過体重であるとされ、肥満の割合は、1980年から2010年にかけて2倍以上(約15%から約36%)に増加しています。肥満又は過体重は、糖尿病、脂質異常症、高血圧症といった合併症を引き起こす可能性があり、肥満又は過体重の増加は大きな社会問題となっています。本剤の承認により、当社は大きなアンメット・メディカル・ニーズが存在する肥満症領域において、新たな治療選択肢となる新薬を提供することとなります。本剤の発売にあたっては、アリーナ社が生産し、当社の米国子会社であるエーザイ・インクが販売活動を行います。

本剤は、アリーナ社創製のセロトニン受容体アゴニストであり、選択的に脳内セロトニン 2C 受容体を刺激することにより摂食を抑制し体重を減少させると考えられています。3つの二重盲検、無作為化、プラセボ対照臨床試験において、食事制限および運動に加えて本剤を服用した患者群が、食事制限および運動のみの患者群と比較して、1年後に5%以上体重が減少し、2年間体重減少を維持した患者数は有意に多く認められました。

本剤は、米国麻薬取締局(the U.S. Drug Enforcement Administration:DEA)による、規制物質法にもとづくスケジュール審査が完了した後に発売となります。また発売後に、ポスト・マーケティング・スタディとして、小児の肥満患者様における有効性・安全性に関する臨床試験、および、長期投与による心疾患または複数の心疾患リスクを持つ過体重又は肥満の患者様における心血管系副作用の発症頻度に関する臨床試験を実施することが義務付けられています。なお、この心疾患リスクに関する臨床試験では心エコー検査による評価を計画しています。

ヒューマン・ヘルスケア(hhc)理念にもとづき、当社はアンメット・メディカル・ニーズの充足に取り組んでおります。当社は肥満症治療に対する新しい選択肢を提供し、同疾患の内科的治療分野において、患者様とご家族のベネフィット向上により一層の貢献をまいります。

以上

[参考資料として、BELVIQ[®]、フェーズⅢ試験概要、アリーナ・ファーマシューティカルズ・インクを添付しています]

1. BELVIQ®(一般名 lorcaserin hydrochloride)について

BELVIQ®はアリーナ社創製の化合物であり、選択的なセロトニン 2C(5-HT2C)受容体アゴニストとして作用することが知られています。また、5-HT2C 受容体は、食欲や代謝を司る視床下部を含めた脳に発現しており、視床下部の 5-HT2C 受容体への刺激は摂食抑制、飽食に強い関連を有していることが報告されています。米国 FDA により承認された本剤の効能・効果は次の通りです。

【BELVIQ®の効能・効果】

ボディ・マス・インデックス(BMI)が 30kg/m² 以上、あるいは少なくとも 1 つ以上の合併症(高血圧、脂質異常症および2型糖尿病など)を患うBMIが 27kg/m² 以上の成人患者様の、低カロリーダイエットと習慣的な運動による体重管理プログラムに対する補助療法として適応される。

＜効能・効果に関連する使用上の注意＞

- 処方箋薬(フェンテラミン等)、市販薬、漢方薬を含む、他の抗肥満薬との併用時における有効性と安全性は確立していない。
- 本剤による心血管疾患の発症率および死亡率に関しては確立していない。

2010年7月、当社の米国子会社であるエーザイ・インクは、アリーナ社のスイス子会社アリーナ・ファーマシューティカルズ GmbH. と、本剤に関する米国での独占的販売供給契約を締結しました。また、2012年5月に、この契約を変更し、米国に加えて対象地域をメキシコ、ブラジル、カナダ等を含む米州 20 カ国にも拡大することに合意しています。

2. BELVIQ®のフェーズⅢ試験概要について

本剤のフェーズⅢ試験は 3 つの二重盲検、無作為化、プラセボ対照比較試験、1) BLOOM (Behavioral modification and Lorcaserin for Overweight and Obesity Management) 試験、2) BLOSSOM (Behavioral modification and Lorcaserin Second Study for Obesity Management) 試験、3) BLOOM-DM (Behavioral modification and Lorcaserin for Overweight and Obesity Management in Diabetes Mellitus) 試験が実施され、合計で約 7,800 人の患者様が登録されました。これらの 3 つの試験は、プラセボおよび BELVIQ®の両投与群において、食事療法、中程度の運動、および行動カウンセリングによる標準化プログラムのもと、実施されました。

BLOOM 試験および BLOSSOM 試験では、糖尿病を有さない肥満症 (BMI: 30~45kg/m²)、または糖尿病を有さずかつ1つ以上の合併症を有する過体重 (BMI: 27~29.9 kg/m²) の患者様 (18~65歳) を対象として実施され、BLOOM 試験 (3,182 人) では 2 年間以上、また BLOSSOM 試験 (4,008 人) では 1 年間以上にわたり、プラセボを対照とした BELVIQ®の有効性および安全性が評価されました。両試験において、BELVIQ®はプラセボに比較し、統計学的に有意かつ臨床的に意義のある体重減少を認めました。最も多く報告された有害事象 (5%以上かつプラセボより多かったケース) は、頭痛、めまい、けん怠感、吐き気、口渇、便秘でした。BLOOM 試験と BLOSSOM 試験の総合解析データは、2010年6月に開催された第 70 回米国糖尿病学会の年次会で発表されました。また、2 年間にわたり実施された BLOOM 試験の結果は、*New England Journal of Medicine* 2010 年 7 月 15 日号に掲載されました。

BLOOM-DM 試験 (604 人) では 2 型糖尿病を有する肥満または過体重の患者様を対象として、BELVIQ®の効果が評価されました。本試験のトップラインの結果について、BELVIQ®はプラセボに比較し、統計学的に有意な体重減少を示したことを、2010年11月9日にアリーナ社は発表しています。また、本試験において最も多く報告された有害事象は、低血糖、頭痛、腰痛(背部痛)、咳嗽、けん怠感でした。

3. アリーナ・ファーマシューティカルズ・インクについて

アリーナ・ファーマシューティカルズ・インクは、循環器、中枢系、炎症、代謝異常分野における G タンパク結合受容体、有効な創薬標的をターゲットとする、経口剤の発見、開発、商品化にフォーカスするバイオ製薬会社です。Arena Pharmaceuticals®および Arena®は、アリーナ・ファーマシューティカルズ・インクの登録商標です。また、BELVIQ®はアリーナ・ファーマシューティカルズ GmbH. の登録商標です。