



2022年9月26日

エーザイ株式会社
日本メダック株式会社

**「メトジェクト®皮下注シリンジ」 (一般名：メトトレキサート)
日本において関節リウマチに係る製造販売承認を取得**

エーザイ株式会社（本社：東京都、代表執行役 CEO：内藤晴夫、以下 エーザイ）と medac GmbH（本社：ドイツ）の子会社である日本メダック株式会社（本社：東京都、代表取締役：入山博久、以下 日本メダック）は、本日、抗リウマチ剤「メトジェクト®皮下注 7.5mg シリンジ 0.15mL、同 10mg シリンジ 0.20mL、同 12.5mg シリンジ 0.25mL、同 15mg シリンジ 0.30mL」（一般名：メトトレキサート、以下 MTX）について、日本メダックが「関節リウマチ」の効能・効果で製造販売承認を厚生労働省より取得したことをお知らせします。本剤は、関節リウマチを対象とした国内初の自己投与可能な MTX 皮下注射製剤となります。2019年5月にエーザイと medac GmbH が締結したライセンス契約に基づき、本剤の製造販売承認は日本メダックが保有し、販売はエーザイが担当します。

本承認は、日本メダックが国内で実施した、本剤の有効性と安全性について MTX 経口剤と比較する二重盲検期ならびに継続投与期からなる臨床第 III 相試験（MC-MTX.17/RA 試験）の結果に基づいています。本試験の二重盲検期においては、MTX 未治療の関節リウマチ患者様 102 人を対象に、本剤 7.5mg/週あるいは MTX 経口剤 8mg/週が 12 週間反復投与されました。主要評価項目である 12 週後の ACR 20%改善率^{*}は、MTX 経口剤群 51.0%に対して本剤群 59.6%であり、同程度の有効性が認められました。二重盲検期における副作用発現率は、本剤群 25.0%、MTX 経口剤群 34.0%でした。また、主な副作用（発現率 5%以上）は、本剤群で口内炎 5.8%、MTX 経口剤群で悪心 12.0%、口内炎 6.0%でした。

日本には約 70～80 万人の関節リウマチ患者様がいらっしゃるといわれています¹。MTX は、関節リウマチ治療において第一選択薬として使用されていますが、日本においては経口製剤のみが販売されています。エーザイと日本メダックは、自己投与可能な皮下注射製剤である本剤を関節リウマチの新たな治療選択肢として一日も早く日本の患者様にお届けし、関節リウマチ患者様の多様なニーズの充足とベネフィット向上により一層貢献してまいります。

以上

^{*}米国リウマチ学会（American College of Rheumatology）で作成された関節リウマチの臨床症状改善度の基準です。関節リウマチの活動性に関する 7 項目（①疼痛関節数、②腫脹関節数、③被験者による疼痛評価、④被験者による疾患活動性の全般評価、⑤医師による疾患活動性の全般評価、⑥被験者による身体機能評価、⑦急性期反応蛋白[C 反応性蛋白または赤血球沈降速度]）のうち、①および②の 20%以上の改善に加え、さらに③～⑦の 5 項目中 3 項目で 20%以上の改善が認められた被験者の割合を示したものです。

本件に関する報道関係お問い合わせ先	
<p>エーザイ株式会社 PR 部 TEL：03-3817-5120</p>	<p>日本メダック株式会社 担当：上野 TEL：03-6661-6270</p>

参考資料

1. 「メトジェクト皮下注シリンジ」（一般名：メトトレキサート）について

メトトレキサート（MTX）は、関節リウマチ治療のアンカードラッグに位置づけられています²。関節リウマチへの作用として、リンパ球等における葉酸代謝阻害による細胞増殖抑制作用および滑膜の血管内皮細胞等におけるアデノシン合成促進による抗炎症作用などが考えられています。本剤は、関節リウマチを対象とした国内初の自己投与可能な MTX 皮下注射製剤となります。海外では、欧州を中心として約 50 カ国にて承認されています。

2. 国内臨床第 III 相試験（MC-MTX.17/RA 試験）

国内臨床第 III 相試験（MC-MTX.17/RA 試験）の二重盲検期では、MTX 未治療の関節リウマチ患者様 102 人を対象に、本剤 7.5mg/週または MTX 経口剤 8mg/週が 12 週間反復投与されました。主要評価項目である 12 週後の ACR20%改善率は、MTX 経口剤群 51.0%（25/49 例）に対して本剤群 59.6%（31/52 例）であり、同程度の有効性が認められました。二重盲検期における副作用発現率は、本剤群 25.0%（13/52 例）、MTX 経口剤群 34.0%（17/50 例）でした。また、主な副作用（発現率 5%以上）は、本剤群で口内炎 5.8%（3/52 例）、MTX 経口剤群で悪心 12.0%（6/50 例）、口内炎 6.0%（3/50 例）でした。

継続投与期では、二重盲検期から移行した 98 人（本剤群 50 人、MTX 経口剤 48 人）に加え MTX 経口剤 8mg の既治療例 11 人の合計 109 人を対象とし、最大用量を 15mg とした本剤のみの増量試験が実施されました。本剤の最大用量は、7.5mg が 7.3%、10mg および 12.5mg が各 12.8%、15mg が 67.0%でした。二重盲検期に本剤群であった患者様における投与 64 週時の ACR 20%、50%および 70%改善率は、それぞれ 59.6%（31/52 例）、51.9%（27/52 例）および 42.3%（22/52 例）でした。継続投与期における副作用発現率は、54.1%（59/109 例）でした。主な副作用（発現率 5%以上）は、悪心 13.8%（15/109 例）、口内炎 11.9%（13/109 例）、アラニンアミノトランスフェラーゼ増加 9.2%（10/109 例）、白血球数減少および肝機能異常各 8.3%（9/109 例）でした。

3. エーザイ株式会社について

エーザイ株式会社は、患者様と生活者の皆様の喜怒哀楽を第一義に考え、そのベネフィット向上に貢献する「ヒューマン・ヘルスケア（hhc）」を企業理念とし、この理念のもと、人々の「健康憂慮の解消」や「医療較差の是正」という社会善を効率的に実現することをめざしています。グローバルな研究開発・生産・販売拠点ネットワークを持ち、戦略的重要領域と位置づける「神経領域」「がん領域」を中心とするアンメット・メディカル・ニーズの高い疾患領域において、革新的な新薬の創出と提供に取り組んでいます。

また、当社は、国連の持続可能な開発目標（SDGs）のターゲット（3.3）である「顧みられない熱帯病（NTDs）」の制圧に向けた活動に世界のパートナーと連携して積極的に取り組んでいます。

エーザイ株式会社の詳細情報は、<https://www.eisai.co.jp> をご覧ください。Twitter アカウント [@Eisai_SDGs](https://twitter.com/Eisai_SDGs) でも情報公開しています。

4. 日本メダック株式会社について

日本メダック株式会社は、medac GmbH の日本法人として、2016 年 4 月に設立されました。未だ医療ニーズが十分に満たされていない疾患における治療選択肢を広げることが可能とする新医薬品の開発に取り組んでいます。医療ニーズの高い領域での患者様やその家族皆様の生活の質を向上させるため、一日も早く良質な薬剤を届ける為、鋭意努力してまいります。

¹ Report from Study Committee on Rheumatoid Arthritis and Allergy

<http://www.mhlw.go.jp/stf/houdou/2r9852000001nfao-att/2r9852000001nfdx.pdf>

² 日本リウマチ学会 関節リウマチにおけるメトトレキサート(MTX)診療ガイドライン 2016 年改訂版