

注射用戈舍瑞林微球

(百拓维®)

百济神州（北京）生物科技有限公司

## 产品基本信息

- 通用名：注射用戈舍瑞林微球
- 注册分类：化学药品2类-“境内外均未上市的改良型新药”（2.2类-新剂型、新给药途径）
- 注册规格：3.6mg（按  $C_{59}H_{84}N_{18}O_{14}$  计）
- 适应症：本品适用于需要雄激素去势治疗的前列腺癌患者
- 用法用量：肌肉注射，每次一支，每28天注射一次
- 首个上市国家及上市时间：中国，2023.6.30
- 同通用名药品情况：无

## 参照药品为“醋酸戈舍瑞林缓释植入剂”

## ➤ 参照药品选择原因

1. **同活性成分**：活性成分均为“醋酸戈舍瑞林”
2. **临床应用广泛**：临床应用广泛的医保目录内药品
3. **上市审评对照**：关键性III期临床试验的阳性对照药



左：戈舍瑞林植入剂（16G外径1.6mm）  
右：戈舍瑞林微球（21G外径0.8mm）

## 对比参照药：

- ① 适应症数量更少
- ② 升级的微球剂型
- ③ 可多部位肌肉注射

# 前列腺癌发病率高，生存率低，严重影响患者身心健康和生活质量

## 发病率高，生存率低<sup>1-4</sup>

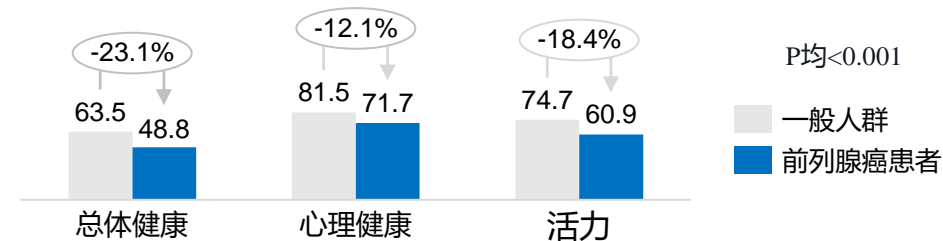
2020年中国前列腺癌发病率为15.6/10万，新增前列腺癌患者为11.5万

中国前列腺癌呈逐年高发态势，发病率年增速7.1%，位列男性肿瘤首位

中国前列腺癌患者5年生存率低于其他亚洲国家（中国：韩国：日本=69%：90%：93%）

## 严重影响患者身心健康，降低生活质量<sup>5, 6</sup>

SF-12量表得分



### 影响患者生活质量因素

- 1 肿瘤引起的疼痛
- 2 疾病引起的心理压力（包括疾病进展）
- 3 注射引起的不适感
- 4 注射后睾酮短暂升高

以戈舍瑞林为代表的GnRH激动剂是前列腺癌治疗的基石<sup>1</sup>。足剂量、足疗程的ADT治疗是保证前列腺癌患者预后的关键，此前中国市场上仅有一款戈舍瑞林植入剂，其未满足需求：

- 1 注射时常伴有剧烈疼痛和出血，腹部皮下注射**疼痛感更强，患者耐受性差**
- 2 由于针头较粗，患者易产生恐惧心理，从而**降低患者依从性，影响治疗效果**
- 3 多国说明书中均提示**注射部位损伤、疼痛、出血等警告，必要时需要输血和手术干预**<sup>2</sup>

“

患者反馈：28日下午4点打完第一针，一直到29日晚上注射部位都隐隐作痛。在这个期间也比较注意轻手轻脚，可能这个药就是比较痛<sup>3</sup>

“

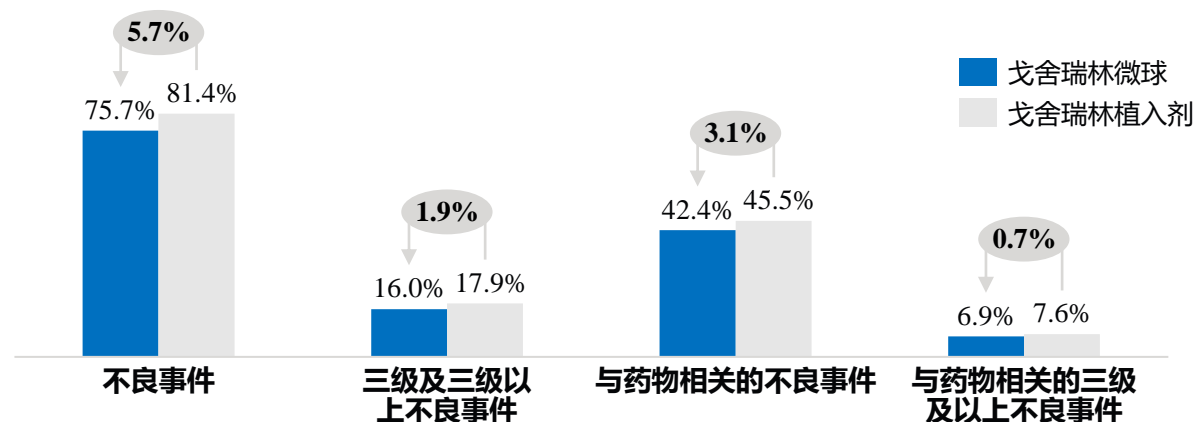
患者反馈：每次打戈舍瑞林，针头真的太粗了，赶上技术不好的护士真的疼！想想要坚持5-10年，不容易！<sup>4</sup>

**亟需改善患者注射体验的治疗方案，提高患者依从性**

# 相较植入剂，本品整体安全性和患者耐受性更优

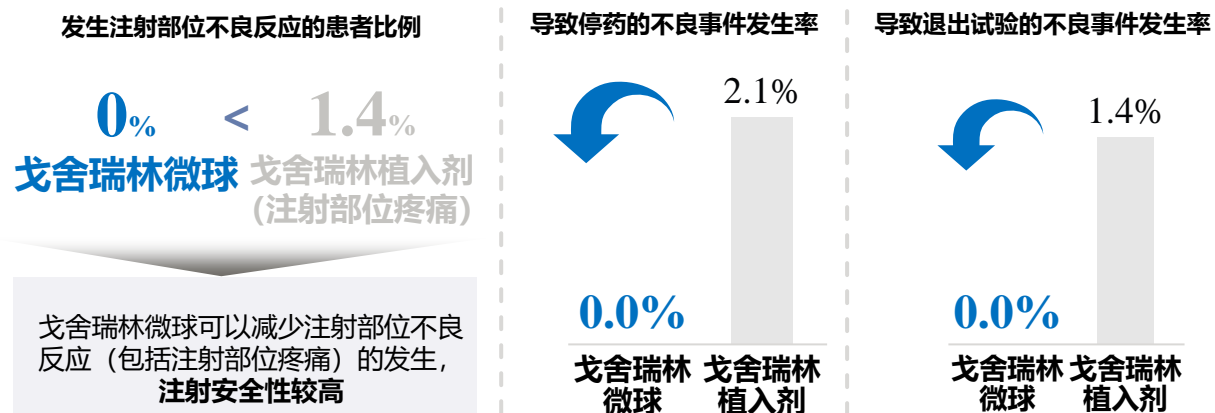
1

与植入剂型相比，  
戈舍瑞林微球整体不良事件发生率更低，临床用药风险更小



2

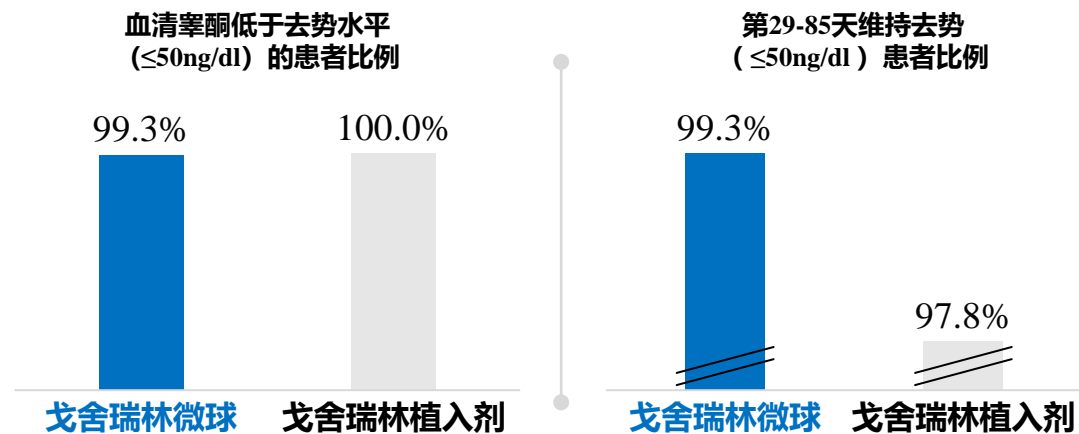
与植入剂型相比，  
戈舍瑞林微球未发现注射部位不良反应，无导致停药和退出试验的不良事件



# 相较植入剂，本品可有效降低睾酮至去势水平，维持去势疗效更优

1

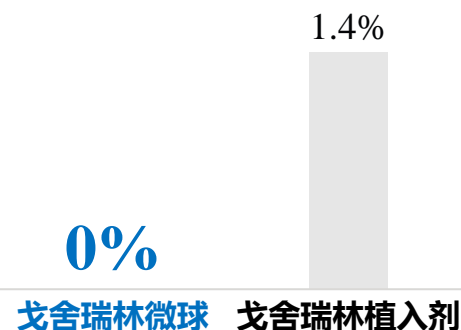
与植入剂型相比，  
戈舍瑞林微球去势疗效相当，  
维持去势效果更优<sup>1</sup>



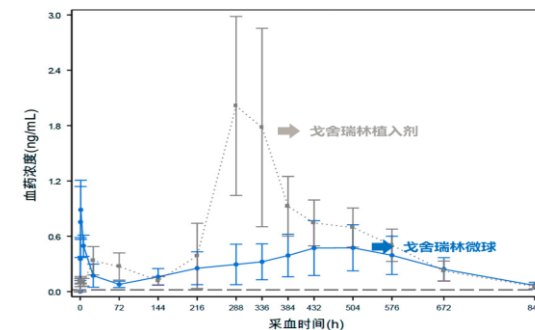
2

与植入剂型相比，  
戈舍瑞林微球释药更平稳，  
血药浓度波动更小，  
未发现“睾酮激增”现象<sup>1,2</sup>

重复给药后72小时内血清睾酮发生急性升高至去势水平以上患者的比例



血药浓度-时间图



## 包括戈舍瑞林在内的ADT已被多个权威指南推荐，临床价值获充分认可

基本信息

## CSCO前列腺癌诊疗指南(2022版)

“ ADT在前列腺癌治疗的多个阶段为**1级推荐**，ADT均包括所有GnRH激动剂 ”

安全性

## 中国泌尿外科和男科疾病诊断治疗指南(2022版)

“ 前列腺癌治疗的各阶段ADT均在推荐及**强烈推荐级别** ”

有效性

## 国家卫健委前列腺癌诊疗指南(2022年版)

“ ADT是晚期转移性前列腺癌患者的主要全身性**基础治疗**。指南提及的内分泌和ADT均包括所有的GnRH激动剂 ”

创新性

## NCCN前列腺癌指南2023 V1版

“ ADT在前列腺癌治疗多个阶段为**1类推荐**。ADT均包括所有的GnRH激动剂 ”

公平性

## EAU前列腺癌指南2023

“ ADT在前列腺癌治疗多个阶段为**1类推荐**。ADT均包括所有的GnRH激动剂 ”

组合物具有自主知识产权，已在中国、美国、欧洲、日本和俄罗斯获得授权<sup>1</sup>

## 制备工艺稳定可控，包封率更高

微球制备方式	工艺特点 <sup>2</sup>	包封率	代表药物
乳化挥发法	工艺稳定，粒径较小且分布较窄，批间一致性好，产品质量稳定	> 90% <sup>2</sup>	戈舍瑞林微球
喷雾干燥法	需要严格进行气流温度控制：高温损害微球，低温则粒径控制差	< 90%	亮丙瑞林微球
相分离法	大规模生产困难；使用大量有机溶剂，非常易残留；固化后疏水性可能过强；难以实现无菌控制	> 50%	曲普瑞林微球

## 创新微球制备技术，生物利用度较高，药效持久、促使戈舍瑞林稳定发挥药效；安全性好，且依从性高

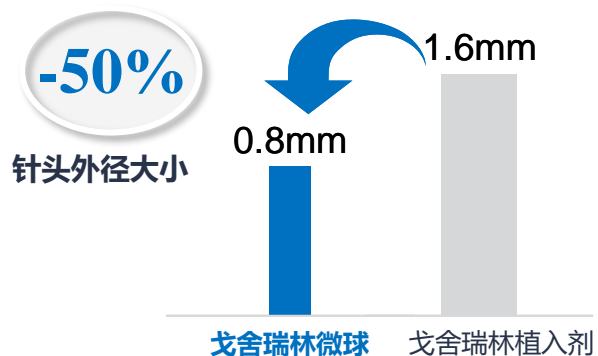
有效性	药物平稳释放	戈舍瑞林微球可实现4周药物平稳释放，保持长效、稳定的血药浓度；戈舍瑞林植入剂开始和结束阶段血药浓度非常低，波动较大 <sup>3</sup>
	药效持久稳定	戈舍瑞林微球的半衰期相较戈舍瑞林植入剂更长（105.16h vs. 90.87h），药效更稳定持久 <sup>3</sup>
	生物利用度较高	戈舍瑞林微球给药后有较高的生物利用度，促使戈舍瑞林完全发挥药效 <sup>2</sup>
安全性	安全性较高	微球在给药部位缓慢释放，减少血药浓度波动，降低不良事件发生率；聚合物属于可降解辅料，在体内降解成水和二氧化碳，安全性较高
依从性	提高依从性	微球剂型可采用更细针头注射，改善注射体验，提高用药依从性



**微球针头更细，注射部位选择更多**

1

戈舍瑞林微球的针头更细，仅为植入剂一半



2

戈舍瑞林微球为肌肉注射，注射部位选择更多

戈舍瑞林微球：肌肉注射  
注射部位：多部位戈舍瑞林植入剂：皮下注射  
注射部位：腹部皮下**更好患者体验，降低护理难度****① 针头更小，改善患者注射体验，提升患者依从性**

- 微球剂型仅需普通注射器，针头外径较植入剂型减少一半，注射疼痛感减轻，可极大改善患者注射体验
- 改善患者对传统植入剂型“粗针头”的恐惧，提高患者依从性

**② 肌肉注射，减轻患者疼痛、焦虑，注射部位选择更多**

- 植入剂型要求腹部皮下注射，部分患者出现躲避注射的情况，戈舍瑞林微球采用肌肉注射，可以明显缓解患者疼痛和焦虑等困扰
- 戈舍瑞林微球对注射部位无限制，患者有更多注射部位选择

**③ 肌肉注射更易操作，减轻护理难度，降低人员培训成本**

- 戈舍瑞林微球采用普通注射器，注射部位及注射方式常见，更易操作，降低护理难度
- 戈舍瑞林植入剂的注射部位和注射方法与传统的皮下注射不同，需进行注射技术及护理培训，需进行注射前环境准备、疼痛准备、心理护理等一系列繁琐操作

## 所治疗疾病 对公共健康的影响

- 前列腺癌是中国男性泌尿生殖系统发病率最高的恶性肿瘤，与其他发达国家相比，中国前列腺癌患者生存率低、死亡患者占比高，给中国男性健康带来严重威胁
- 本品升级的微球剂型，针头更细，可多部位肌肉注射，**改善患者注射体验，提高患者依从性**，助力实现健康中国2030目标

## 符合“保基本”原则

- 以戈舍瑞林为代表的GnRH激动剂是前列腺癌患者治疗的基石方案，**本品可替代目录内同类产品，对基金影响有限可控**
- 本土生产，保证供应链安全

## 弥补目录短板

- 本品打破了二十余年进口戈舍瑞林植入剂的垄断地位
- 相比植入剂，**升级的微球剂型和改良的注射方式，能够兼顾疗效、安全和患者体验**，为前列腺癌临床治疗提供了更优质的新选择

## 临床管理难度

- 临床已使用戈舍瑞林多年，医疗机构医保经办经验充足
- 获批用于需要雄激素去势治疗的前列腺癌患者，疾病诊断规范，治疗明确，**无临床滥用或超说明书风险**，以月为单位进行监测，可有效保证医生为患者制定精细化健康管理方案，保障患者收益最大化

- » 雄激素剥夺治疗领域，最充足循证依据化合物“戈舍瑞林”与最广泛应用剂型“微球” **强强联合的2类新药**
- » 本品**打破了二十余年进口戈舍瑞林植入剂的垄断地位**
- » 微球制备工艺复杂，技术难度大，本品基于**中国创新微球技术**平台自主开发，从关键辅料到制剂均为国内自主研发
- » 升级的微球剂型和改良的注射方式，**兼顾疗效、安全和患者体验**，为前列腺癌临床治疗提供了更优质的新选择