

注射用醋酸曲普瑞林微球 (维宝宁[®])

申报企业：丽珠医药集团股份有限公司

目录

01 基本信息

02 安全性

03 有效性

04 创新性

05 公平性

基本信息：**唯一**国家级微球研发平台 **唯一**国产曲普瑞林微球



通用名	注射用醋酸曲普瑞林微球
适应症	需要雄激素去势治疗的前列腺癌患者
注册分类	化药 2.2 类
研发平台	长效微球技术国家地方联合工程研究中心
发明专利	醋酸曲普瑞林缓释微球及其制备方法
注册规格	3.75 mg
用法用量	本品为1个月缓释制剂。臀部肌肉注射，一次1支，每4周注射一次
中国大陆首次上市时间	2023年05月06日
目前大陆地区同通用名药品上市情况	无 (独家产品)
全球首个上市国家及上市时间	中国；2023年
是否为OTC药品	否

参照药品：注射用醋酸曲普瑞林（3.75 mg, 达菲林®）

选择理由

- **医保目录内药品**：本治疗领域内药理作用一致的药物有曲普瑞林、亮丙瑞林、戈舍瑞林3类
- **指南/共识推荐用药**：曲普瑞林、亮丙瑞林、戈舍瑞林均被推荐用于前列腺癌的去势治疗
- **适应症一致**：均可用于需要雄激素去势治疗的前列腺癌患者
- **活性成分一致**：本品与注射用醋酸曲普瑞林（3.75 mg, 达菲林®）活性成分均为曲普瑞林
- **规格一致**：3.75 mg/支
- **用法用量一致**：1个月缓释制剂，臀部肌肉注射，一次1支，每4周注射一次

疾病情况

中国前列腺癌发病率快速增长¹⁻²

- 前列腺癌是我国男性最高发的泌尿系统肿瘤，疾病负担持续增加
- 2020年新发人数**11.5万**，年死亡人数5.1万；发病率年增速7.1%

未满足的临床需求

现有瑞林类药物深度降酮率不佳³⁻⁶

- 以瑞林类为主的药物去势疗法是治疗前列腺癌的基石
- 权威指南推荐**深度降酮(< 20 ng/dL)**可明显延长患者总生存期
- 现有瑞林类药物的深度降酮能力存在显著差异，降酮效果不佳时需联用其他药物或换药

与同治疗领域药品相比的优势

单药深度降酮同类最优、安全性好

- **第二次给药后**（第8周）实现**100%深度降酮**，相比其他瑞林类提高10%~23%
- **明显降低常见不良反应的发生**

[1]刘宗超 等. 2020全球癌症统计报告解读[J]. 肿瘤综合治疗电子杂志, 2021, 7(2):1-1310001;
[2]ZHENG R S, et al. Chin J Oncol, 2019, 41(1): 19-28
[3]卫健委前列腺癌诊疗指南, 2022.

[4]中国前列腺癌药物去势治疗专家共识, 2016.
[5]前列腺癌睾酮管理中国专家共识, 2021
[6]顾伟杰, 叶定伟. 促性腺激素释放激素激动剂治疗前列腺癌的现状调查[J]. 中华泌尿外科杂志, 2021, 42(10):5.

安全性：明显降低常见不良反应发生率

说明书载载的安全性信息

- 安全性良好，**未发生严重不良反应**
- **降低常见不良反应的发生率**

1月剂型瑞林类药物常见不良反应发生率 (%) ⁷⁻¹¹

	本品	双羟萘酸曲普瑞林	注射用亮丙瑞林微球	醋酸戈舍瑞林缓释植入剂
注射部位痛	2.4	3.6	8.1	---
勃起功能障碍	3.2	---	---	18
性欲降低	3.2	---	---	21
潮热	9.6	58.6	45	62
骨痛	2.4	12.1	---	---

国内外不良反应发生情况

- 各国家药监部门5年内**未发布曲普瑞林相关的任何安全性警告、黑框警告、撤市信息**

[7]注射用醋酸曲普瑞林微球（维宝宁®）III期临床研究总结报告

[8]注射用醋酸曲普瑞林微球（维宝宁®说明书）

[9]双羟萘酸曲普瑞林 TRELSTAR® (3.75mg) FDA 说明书

[10]M. Marberger et al. Clinical Therapeutics (2010) 32: 744-757.

[11]醋酸戈舍瑞林缓释植入剂 FDA说明书

有效性：深度降酮同类最优

3期临床 有效性数据

- **主要疗效终点：**单药使用后4、8、12周，去势达标率均为100%
- **次要疗效终点：**单药持续深度降酮率95.1%，本品单药使用后4、8、12周，深度降酮率分别为95.1%、100%、100%

CDE暂未公布《技术审评报告》

CDE审评去势标准为睾酮<50ng/dL，指南推荐深度降酮 (<20ng/dL) 是更优标准

单药提高深度降酮率 10%~23%

1月剂型瑞林类药品在给药后不同时间点的深度降酮率(%)^{7-8,10,12-14}

	注射用醋酸 曲普瑞林微球	注射用醋酸 曲普瑞林	注射用醋酸 戈舍瑞林微球	醋酸戈舍瑞林 缓释植入剂	注射用醋酸 亮丙瑞林微球
4周	95.1	80.0	79.7	83.6	73.1
8周	100	---	77.6	78.4	95.0
12周	100	92.0	77.6	78.4	97.0

深度降酮率提高15%~23% (VS. 醋酸戈舍瑞林微球) **深度降酮率提高8%~15% (VS. 醋酸曲普瑞林)**

[7]注射用醋酸曲普瑞林微球（维宝宁®）III期临床研究总结报告

[8]注射用醋酸曲普瑞林微球（维宝宁®说明书）

[10]M. Marberger et al. Clinical Therapeutics (2010) 32: 744-757.

[12]Ju`rgen Breul. et al. Adv Ther. (2017) 34:513-523.

[13]Chengyuan Gu, et al. Chinese Medical Journal 2023;136(10).

[14]Neal D. Shore. et al. BJU Int 2017; 119: 239-244.

有效性：曲普瑞林已获多部权威指南与共识推荐



时间	地区	指南	推荐内容	推荐等级
2022	中国	CSCO前列腺癌诊疗指南	常用的去势治疗药物包括 曲普瑞林 、戈舍瑞林、亮丙瑞林	局限性及转移性前列腺癌（ I级 ） 前列腺癌根治术后复发（ II级 ）
2022	加拿大	雄激素剥夺治疗不良事件和管理指南	常用的去势治疗药物包括 曲普瑞林 、戈舍瑞林、亮丙瑞林	---
2021	中国	前列腺癌睾酮管理中国专家共识	常用的去势治疗药物包括 曲普瑞林 、戈舍瑞林、亮丙瑞林	---

创新性：自有专利技术，提升临床疗效

制备工艺创新

制备工艺创新，显著降低药物突释效应

- **提升降酮效果**：**专利技术¹⁵**，突释最大浓度仅为达菲林®的**1/5**，稳态血药浓度更高，提升临床疗效，维持去势率100%，第二次给药后深度降酮率100%，单药降酮效果更佳
- **减少不良反应**：降低短暂快速释放导致药物浓度过高诱发的不良反应发生

[15]发明专利号：ZL201510520722.4

递送技术创新

- 粒径均一，跨度更小（1.6 μ m VS. 达菲林® 2.3 μ m），减少注射中药物损失
- PLGA量为达菲林®的**1/6**，减少对肌肉的刺激性，**减轻注射部位疼痛**

应用创新

本品**已开展儿童适应症**（中枢性性早熟）**III期**
临床试验

对公共健康的影响

- 前列腺癌是我国男性最为高发的泌尿系统肿瘤，新发人数11.5万/年，疾病负担持续增加
- 本品**提高了药物的疗效及安全性**，可以有效控制疾病进展，**降低患者疾病负担**

符合“保基本”原则

- 相较于其他瑞林类药物，本品的疗效及安全性更好，**总成本及不良反应处理费用最低，节省医疗支出**

弥补目录短板

- 新版《药品注册管理办法》颁布后，本品是唯一获批的国产曲普瑞林微球，突破了高端微球技术壁垒
- **单药深度降酮同类最优、安全性好**，弥补了现有瑞林类深度降酮效果的不足

临床管理难度

- 本品适应症明确，不增加医保管理负担

唯一国家级微球研发平台 **唯一**国产曲普瑞林微球

注射用醋酸曲普瑞林微球

(维宝宁®)

