

吗替麦考酚酯干混悬剂 (赛祈安®)

精准调节 吞咽无忧 狼疮肾炎患者的剂型新选择

杭州中美华东制药有限公司

01

基本信息：全国**首家通过生物等效性评价**的吗替麦考酚酯干混悬剂

02

安全性：**安全可控**，安全性与原研干混悬剂一致

03

有效性：本品**与原研干混悬剂等效**，且适应症相同

04

创新性：国内**首家可精准给药**，且具有狼疮性肾炎适应症

05

公平性：满足狼疮性肾炎患者的**精准用药需求**，
保障不同疾病患者公平可及

目
录

本品为全国首家通过生物等效性评价的吗替麦考酚酯干混悬剂



药品基本信息^{1,2}

通用名	吗替麦考酚酯干混悬剂 (赛祈安®)				
注册分类	化学药品3类				
注册规格	34.98g/瓶/盒				
适应症	<p>1、本品与皮质类固醇以及环孢素或他克莫司同时应用，适用于治疗： 接受同种异体肾脏移植的患者中预防器官的排斥反应。 接受同种异体肝脏移植的患者中预防器官的排斥反应。</p> <p>2、本品适用于III-V型成人狼疮性肾炎患者的诱导期治疗和维持期治疗。</p>				
现行医保目录支付范围	<p>✓ 常规目录乙类，限口服吞咽困难的器官移植后抗排异反应</p>				
用法用量	<p>✓ 肾脏移植：成人推荐口服剂量为每次 1g，每日 2 次。</p> <p>✓ 肝脏移植：成人推荐口服剂量为每次 0.5~1 g，每日 2 次。</p> <p>✓ 狼疮性肾炎患者：诱导期治疗：成人推荐剂量为每日 1.5~2g，分两次口服给药。 维持期治疗：成人推荐剂量为每日 0.5~1.5g，分两次口服给药。</p>				
同通用名药品中国大陆首次上市时间	2008年11月18日	本品获批时间	2025年2月25日， 已过评	目前大陆地区同通用名药品的上市情况	含本品共3家

目录内条件3



申请新增适应症纳入医保支付范围

将说明书所载“III-V型成人狼疮性肾炎患者的诱导期治疗和维持期治疗”适应症申请新增纳入医保支付范围

参照药品建议：吗替麦考酚酯胶囊

- 参照药品和本品为**同一药物的不同剂型**，主药成分相同
- 参照药品和本品**适应症相同**：均包括器官移植和狼疮性肾炎
- 参照药品是国内**临床应用较广**的吗替麦考酚酯制剂
- 参照药品为**医保乙类，无限定支付范围**

与参照品相比的优势

- ✓ **可精准给药，方便剂量调整，长期用药更安全**
- ✓ **液体制剂，吞咽困难的患者服药无忧**

本品为狼疮性肾炎和器官移植患者的有效选择，可根据需求精准调整剂量



所治疗疾病基本情况

» 狼疮性肾炎是由系统性红斑狼疮（SLE）累及肾脏，表现为血尿、蛋白尿、水肿等。SLE发病率：30.13~70.41/10万，40%~60% SLE初诊即伴狼疮性肾炎¹；**狼疮性肾炎是继发性肾小球肾炎最常见的疾病类型，其中III-V型（包括混合型）占比达93.76%。**

» **狼疮性肾炎死亡率约7.6%²**，是普通人群的6倍；且狼疮性肾炎患者ESRD发生率高，ESRD累积发生率5年时10%，10年时为13%³；且狼疮性肾炎复发率较高，约30-40%⁴。

同疾病治疗领域内或同药理作用药品上市情况

- 吗替麦考酚酯为器官移植术后排斥反应的预防及治疗的一线免疫抑制用药，同时也是III-V型狼疮性肾炎一线治疗用药。现在国内已上市有胶囊、片剂、干混悬剂等多种剂型。
- 吗替麦考酚酯口服常释制剂和口服液体制剂都属于医保乙类药品，**但两者医保支付限定有区别，常释制剂没有限定，液体制剂则限定“口服吞咽困难的器官移植后抗排异反应”。**
- 本品为**首家**获批含“**III-V型成人狼疮性肾炎患者**”的**吗替麦考酚酯干混悬剂**，相比于现行目录内的干混悬剂，本品适应症范围更全面，用药剂量更加精准。
- 本品为**首家**过评干混悬剂，本品能迅速**提高狼疮性肾炎患者用药剂量准确性以及吞咽困难患者用药依从性**，有助于获得良好的临床疗效和安全性，并且**避免用药浪费。**

安全可控，安全性与原研干混悬剂一致

药品说明书载载的**安全性信息**

- 该药品说明书所呈现的【不良反应】基于吗替麦考酚酯临床试验和上市后的数据，**且已被证明再移植患者人群和狼疮性肾炎患者人群中相似。**
- 根据说明书临床试验以及上市后经验：常见不良反应包括感染及侵染类疾病、肿瘤、血液及淋巴系统疾病、部分代谢疾病、精神病类、神经系统疾病、心脏和血管类疾病、呼吸系统、胃肠系统疾病、肝胆疾病、皮肤及皮下组织类疾病。肌肉相关疾病等。

药品说明书载载的**药物相互作用**

- DNA 聚合酶抑制剂、抗酸药和质子泵抑制剂、螯合剂、抗生素或其他免疫抑制剂的合用影响吗替麦考酚酯的血药浓度，因此**应避免或谨慎合用，同时密切监测吗替麦考酚酯血药浓度，灵活调整剂量**，有助于提高用药安全性及临床疗效。

药品说明书载载的**注意事项及特殊患者用药**

- 本品用于狼疮性肾炎时，应由具有狼疮性肾炎治疗经验的专科医生进行给药；在包装上标明的有效期后不能再服用；请将药品存放于儿童接触不到的地方。
- 目前对于GFR<30 mL/min的狼疮性肾炎患者的数据尚不充分，如需使用本品，建议进行治疗药物浓度监测。
- 老年人的剂量选择要慎重，因为老年人的肾脏、心脏和肝脏功能下降和合并应用其他药物的情况较年轻人更多。与年轻人相比，老年人的不良反应可能更多见。

首家过评, 与原研干混悬剂等效, 且适应症相同(包括器官移植和狼疮性肾炎)

生物等效性试验: 与吗替麦考酚酯干混悬剂Cellcept®相比, 本品在空腹和餐后条件下生物等效和安全性良好

- 吗替麦考酚酯干混悬剂在空腹条件和餐后条件下的人体生物等效性试验, 空腹及餐后试验均采用单中心、随机、开放、两制剂、四周期、完全重复试验设计。在空腹/餐后分别开展试验, 每周期给药剂量为**1000mg**。采用随机的给药顺序, 受试者在第一、三周期早上在空腹/餐后状态下单次口服受试制剂 (T) 或参比制剂 (R), 在第二、四周期交叉服用参比制剂 (R) 或受试制剂 (T)。周期间清洗期为7天。
- 考察空腹条件 (N=36) 和餐后条件 (N=36) 下, 评价杭州中美华东制药有限公司生产的受试制剂吗替麦考酚酯干混悬剂与由中外製薬株式会社生产的参比制剂吗替麦考酚酯干混悬剂 (商品名: Cellcept®) 两制剂间的生物等效性和安全性。

空腹条件下吗替麦考酚酯的生物等效性结果 (BES, N=36)

参数 (单位)	平均生物等效性(ABE)			参比制剂标度的平均生物等效性(RSABE)			
	GMR (%)	90%置信下限 (%)	90%置信上限 (%)	S_{WR} [≥0.294]	GMR 点估计 [0.80,1.25]	95%置信上限 [<=0]	CV (%)
C_{max} (ng/mL)	107.04	95.99	119.35	0.371	108.16	-0.094	38.46
AUC_{0-t} (h*ng/mL)	106.79	97.40	117.08	0.230	106.97	-0.027	23.35
$AUC_{0-\infty}$ (h*ng/mL)	106.64	97.63	116.49	0.227	106.89	-0.027	23.00

餐后条件下吗替麦考酚酯的生物等效性结果 (BES, N=36)

参数 (单位)	平均生物等效性(ABE)			参比制剂标度的平均生物等效性(RSABE)			
	GMR (%)	90%置信下限 (%)	90%置信上限 (%)	S_{WR} [≥0.294]	GMR 点估计 [0.80,1.25]	95%置信上限 [<=0]	CV (%)
C_{max} (ng/mL)	95.71	87.50	104.69	0.376	95.71	-0.108	39.00
AUC_{0-t} (h*ng/mL)	95.49	90.86	100.36	0.217	95.49	-0.034	21.93
$AUC_{0-\infty}$ (h*ng/mL)	95.42	90.88	100.18	0.212	95.42	-0.032	21.47

• 空腹条件下, 受试制剂和参比制剂 C_{max} 的几何均值比 90% 置信区间为 95.99%~119.35%, AUC_{0-t} 为 97.40%~117.08%, $AUC_{0-\infty}$ 为 97.63%~116.49%, 在生物等效范围 (80.00%~125.00%) 内, 符合生物等效性标准。

• 餐后条件下, 受试制剂和参比制剂 C_{max} 的几何均值比 90% 置信区间为 87.5%~104.69%, AUC_{0-t} 为 90.86%~100.36%, $AUC_{0-\infty}$ 为 90.88%~100.18%, 在生物等效范围 (80.00%~125.00%) 内, 符合生物等效性标准。

吗替麦考酚酯做为狼疮性肾炎一线治疗，获得国内与国际权威指南强烈推荐



推荐 (1B, 推荐意见8/9/10) :

活动性 III/IV 型 (伴或不伴 V 型) 狼疮性肾炎的诱导治疗和获得肾脏缓解后的维持治疗阶段可选择激素联合**吗替麦考酚酯**、或激素联合**吗替麦考酚酯**和他克莫司 (多靶点方案)、或激素联合**吗替麦考酚酯**和贝利尤单抗治疗。

推荐 (1B, 推荐意见10.2.3.1.1)

活动性 III/IV 型、伴或不伴膜性病变的狼疮性肾炎，诱导治疗采用激素联合**霉酚酸类似物** (MPAA) 或贝利尤单抗联合**MPAA**或低剂量静脉注射环磷酰胺；**MPAA**联合钙调磷酸酶抑制剂；另外，推荐诱导治疗后，应给予**MPAA**维持治疗。

2025年
《中国狼疮肾炎诊治和管理指南》

2024年
《KDIGO临床实践指南：狼疮性肾炎的管理》



2025年
《中国系统性红斑狼疮诊疗指南》

推荐 (1B或1C, 推荐意见7.1) :

活动性 III/IV 型，伴或不伴 V 型狼疮性肾炎者的诱导治疗选择激素联合**吗替麦考酚酯**治疗，可联合贝利尤单抗进行治疗 (1B)，或激素联合**吗替麦考酚酯**与钙调磷酸酶抑制剂治疗 (1C)；维持期治疗建议使用**吗替麦考酚酯**或硫唑嘌呤进行治疗 (1B)。

国内首家获批“狼疮性肾炎”的 吗替麦考酚酯干混悬剂，弥补目录短板，为患者精准给药

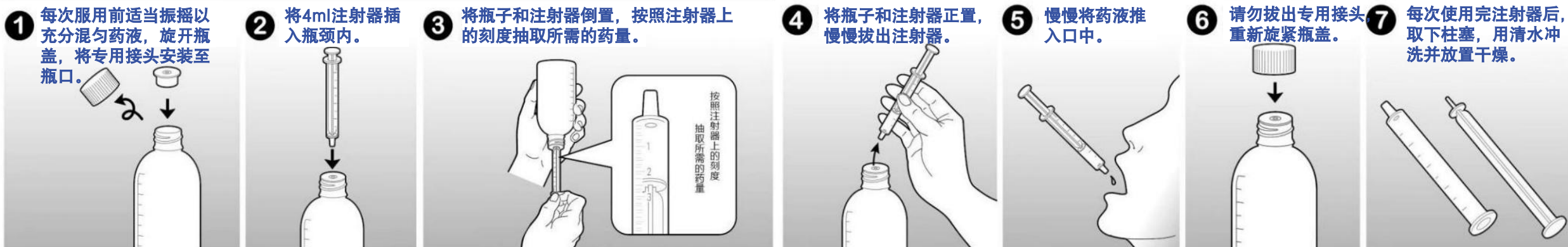
本品为国内**首仿过评**的混悬剂，增加了**狼疮性肾炎**的适应症

◆ 作为创新的干混悬剂，本品配制为**200mg/mL吗替麦考酚酯混悬液**后用**取药注射器抽吸定量药液口服**¹，可以为患者提供精准给药，同类产品为固定剂量500mg/袋²，无法精准给药。且本品使用**杂果粉末香精等辅料改善味道**¹，可提高患者用药的依从性。



◆ 吗替麦考酚酯是窄治疗指数药物³，浓度过低可导致免疫抑制不足引起疗效不佳；浓度过高则导致不良事件的发生。本品**有利于不同年龄、体重或特殊人群（如成人狼疮性肾炎患者中吞咽困难比例约达13%⁴）**等狼疮性肾炎患者的**精准给药、剂量灵活调整**，可提高患者的长期临床疗效和安全性。

使用取药注射器给药



1. 赛祈安药品说明书；2. 弥他乐药品说明书；3. Pharmacometric approach to define narrow therapeutic index (NTI) drugs & evaluate bioequivalence (BE) criteria for NTI drugs[EB/OL]. [2020-11-03]. <https://www.fda.gov/media/108490/download>; 4. 中国系统性红斑狼疮发展报告2020（主编：曾小峰、李梦涛、田新平）

满足狼疮性肾炎患者的精准用药需求，保障不同疾病患者公平可及

◆ 弥补常规目录短板，将说明书适应症全部纳入医保支付范围，保障不同疾病患者公平可及

- 目前吗替麦考酚酯干混悬剂的医保支付仅为“限口服吞咽困难的器官移植后抗排异反应”，赛祈安可填补目录短板，满足狼疮性肾炎患者的用药保障。
- 吗替麦考酚酯作为窄治疗指数药物，对用药剂量精准的要求，针对**不同年龄（包括各年龄段患者）、体重的器官移植以及狼疮性肾炎患者的长期治疗**，该剂型有助于**更精准的剂量调整**，提高患者长期疗效的稳定和良好的安全性。

◆ 狼疮性肾炎造成严重的疾病负担

- 狼疮性肾炎是由系统性红斑狼疮（SLE）累及肾脏导致，SLE是我国最常见的系统性自身免疫性疾病，**发病率为 30.13~70.41/10 万人，半数 SLE 患者并发狼疮性肾炎**，狼疮性肾炎是终末期肾脏病的常见病因之一，也是导致SLE 患者死亡的重要原因¹。

◆ 保障狼疮性肾炎患者剂量灵活调整所需，满足特殊人群用药需求

- 狼疮性肾炎纳入医保后将能迅速提高狼疮性肾炎患者用药剂量准确性，有助于获得良好的临床疗效和安全性。
- 针对各种**特殊用药需求（包括不同年龄、体重、吞咽困难等）的患者**，仍需根据患者个体化需求进行精准剂量调整，该剂型的广泛覆盖有助于提高患者对于该类药物的可及性，提高治疗依从性和临床疗效的改善。

◆ 便于临床管理，无滥用风险

- 本品处方管理严格，人群及适应症定义明确，便于临床用药管理；精准剂量给药，减少因剂型限制导致的药物浪费。