

布立西坦口服溶液（青瑞坦®）

第二代突触囊泡蛋白2A结合剂（SV2A）

对吞咽困难、需按体重给药的特殊人群患者是**急需剂型**
被列入**《第二批鼓励仿制药品目录》**

目录

- 01 基本信息** 吞咽困难和需按体重给药的患者的急需剂型
- 02 安全性** 安全性佳，药物相互作用少；是WHO推荐的**唯一**的起始剂量=治疗剂量的抗癫痫药
- 03 有效性** 在**老年**和儿童患者中均显示稳定疗效；国内外指南一致推荐的局灶性癫痫的治疗药物
- 04 创新性** 结构优化的全新衍生物：**更高亲和力、更高选择性、更高大脑渗透性**
口服液**树莓口味**，可以按体重精准给药
- 05 公平性** 填补目录空缺，仅特殊人群使用，对基金预算影响小

对需要精准给药的患者，口服溶液是必需剂型

通用名：布立西坦口服溶液			
适应症	适用于16岁及以上癫痫患者部分性发作的单药治疗和添加治疗。		
注册规格	300ml:3g	全球首个上市国家和时间	2016.1.14, 欧盟上市
注册分类	化学药品 3类	申报目录类别	基本医保目录
中国大陆首次上市	2026年	大陆同通用名药品的上市情况	独家首仿
用法用量	成人（16岁及以上）推荐起始剂量为每日2次，每次50mg(100mg/天)；最小和最大维持剂量为每日2次，每次25-100mg（50-200mg/天）。开始治疗时无需逐步增加药物剂量。根据临床应答及耐受性进行剂量调整。		
重要资质	《第二批鼓励仿制药品目录》内产品		
其他补充	布立西坦片剂型2024年纳入医保，对于无法服用片剂的患者，口服溶液可作为替代使用		

参照药品建议：布立西坦片	
选择理由	<ul style="list-style-type: none"> ①同一个化合物，不同剂型 ②适应症完全相同 ③布立西坦片是医保用药

申报品在特殊人群的价值

- 适用于吞咽困难的患者
- 适用于需要胃管给药的重症患者
- 适用于低龄儿童
 - 低龄儿童需要按体重给药，口服液可以精准量取
 - 树莓口味，儿童患者更易接受，避免呕吐导致治疗中断
 - 可与牛奶或果汁同服，进一步改善儿童服药依从性

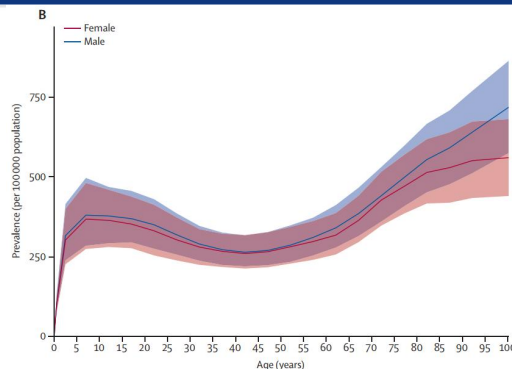
1、布立西坦口服溶液说明书
 2、中国癫痫诊疗指南2023年版
 3、Fine A, et al. Seizures in Children. *Pediatr Rev.* 2020 Jul;41(7):321-347.
 4、Wheless JW, et al. *Neurol Clin Pract.* 2025 Feb;15(1):e200362.

老年癫痫、重症、儿童癫痫患者亟需口服液剂型

疾病信息

■ 癫痫的发病呈现老年和儿童双峰分布

- 根据2015年流行病学数据²，预估目前60岁以上癫痫患者**217**万人、0-5岁癫痫患儿**45**万人。



- **老年癫痫** 多为继发性，30%-50%的脑血管疾病、10%-20%的神经退行性疾病、25%的外伤性脑损伤、**10%-30%**卒中患者合并吞咽困难³。

■ 重症患者

颅脑术后癫痫发作发生率3%-50%⁴，因禁食而需要**胃管给药**的患者较多。

- **儿童癫痫** 多1~3岁起病，难治性癫痫较多，需要新型抗癫痫药控制症状，儿童患者**无法吞服片剂**，同时需要按**体重给药**³。

未满足需求

- 当前仍有**30%**的癫痫无法控制¹，需要新机制的治疗选择
- **吞咽片剂困难的患者** 布立西坦片说明书要求整片吞服，不应咀嚼或压碎，口服溶液更易吞咽
- **重症需要胃管给药的患者** 口服液是更优选择
- **需要精细化剂量调整的患者** 相较固定规格片剂，口服溶液可支持更灵活的个体化剂量调整，准确量取。

1. 中国癫痫诊疗指南2023年版
 2. Prevalence of epilepsy in China between 1990 and 2015: A systematic review and meta-analysis
 3. Wheless JW, et al. Neurol Clin Pract. 2025 Feb;15(1):e200362.
 4. Liang S, et al. Ther Adv Neurol Disord. 2022 Aug 16;15:17562864221114357.

结构优化的全新衍生物：更高亲和力、更高选择性、更高大脑渗透性

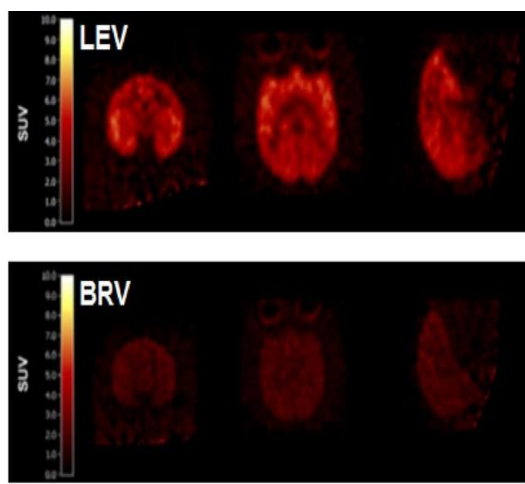
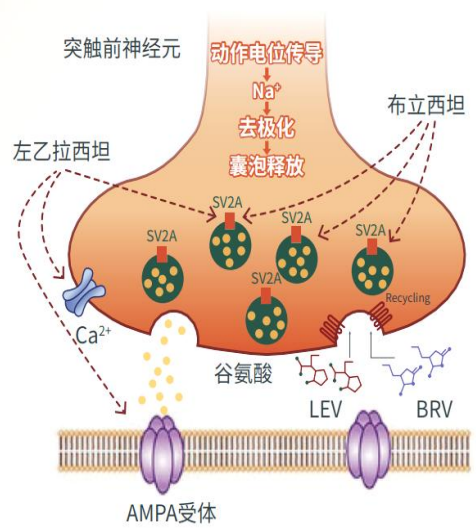
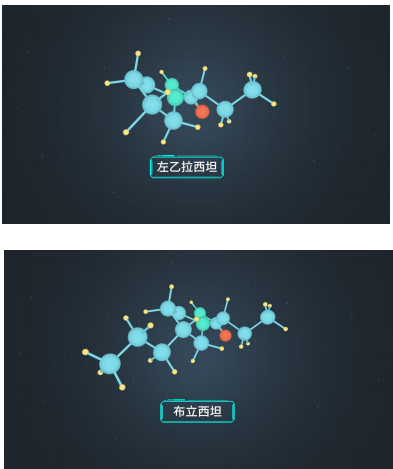
布立西坦结构及靶点结合机制带来药理及成药性双重提升

作为左乙拉西坦的 4 - 正丙基类似物，布立西坦经疏水基团结构优化，**改变分子与SV2A靶点的结合位点及分子空间构象关系**，形成差异化作用机制：

■ **更高亲和力**：与SV2A亲和力是左乙拉西坦的**15-30倍¹**，日剂量是左乙拉西坦的1/10²，**疗效更强**；

■ **更高选择性**：不抑制Ca²⁺通道和AMPA受体，**激越、攻击性发生率低³**，**安全性更高**

■ **更高大脑渗透性**：大脑渗透和SV2A靶点结合速度比左乙拉西坦快至少**7倍⁴**，**起效速度更快**。



布立西坦中间体化合物及其中间体制备方面已获得两项**发明专利^{6,7}**

脑内示踪剂颜色越深，代表药物置换越彻底，进入大脑越快。结果显示：进入大脑速度 **BRV 3min vs LEV 23 min**

1. Wood MD, Gillard M. Epilepsia. 2017;58:255-262.
 2. Abaira L, et al. Epilepsy Behav Rep. 2021;16:100504.
 3. Gillard M, et al. Eur J Pharmacol. 2011;664:36-44.
 4. Naganawa M, et al. EJNMMI Res. 2022 Nov 8;12(1):71
 5. Nicolas JM, et al. Epilepsia. 2016 Feb;57(2) 201-9

口服液树莓口味，可以按体重精准给药

实现“易、准、悦”三大临床获益

传统固体抗癫痫药物存在不足

- 老人、重症、儿童患者存在吞咽困难、服药不便、依从性差
- 多数抗癫痫药需逐步调量，过程复杂且见效慢

- 对于需按体重给药的患者，存在药量把控不准，药效不稳、易过量中毒的问题

- 药剂口感差患者容易抗拒吃药

口服液剂型创新改进

■ 易—利于老人、重症、儿童等吞咽困难等特殊人群服用

患者服药便利性和依从性更高

布立西坦起效快，无需滴定，起始剂量等于治疗剂量

■ 准—剂量精准

按体重精准给药，确保疗效，避免过量造成的中毒风险

■ 悦—树莓口味，口感更佳

安全性佳，药物相互作用少

是WHO推荐的**唯一**的起始剂量=治疗剂量的抗癫痫药

说明书不良反应¹

布立西坦最常见的不良反应 (>10%) 是嗜睡 (14.3%) 和头晕 (11.0%)，严重程度通常为轻度至中度

上市后不良反应监测

本品截止6月10日通过技术审批但未获批上市，暂无不良反应报告

布立西坦与常用处方抗癫痫药无临床相关的药物相互作用²

AED	AED对BRV的影响	BRV对AED的影响	是否调整剂量
丙戊酸钠	无	无	否
左乙拉西坦	无	无	否
奥卡西平	无	无	否
拉莫三嗪	无	无	否
拉考沙胺	无数据	无	否

无需滴定，快速减少发作频率 ≥75%

- 布立西坦**无需滴定**，可从目标剂量起始治疗^{3,4}

化学名	WHO DDD	起始剂量	滴定时间
布立西坦	100mg/日	100mg/日	0
吡仑帕奈	8mg/日	2mg/日	3-6周
丙戊酸	1500mg/日	10-15mg/kg/日	1-2周
左乙拉西坦	1500mg/日	500mg/次，每日2次	2周

- 约**80%**⁵的患者在口服布立西坦**第一天即实现**
癫痫发作频率减少≥75%

降低因滴定不当导致的发作风险及医疗资源利用⁶

1. 布立西坦口服溶液说明书

2. Moseley BD, et al. Epilepsy Res. 2020 Jul;163:106327.

3. Chen Y, et al. EClinicalMedicine. 2024 Feb 28;70:10251

4. Klein P et al. Epilepsia. 2015 Dec;56(12):1890-8.

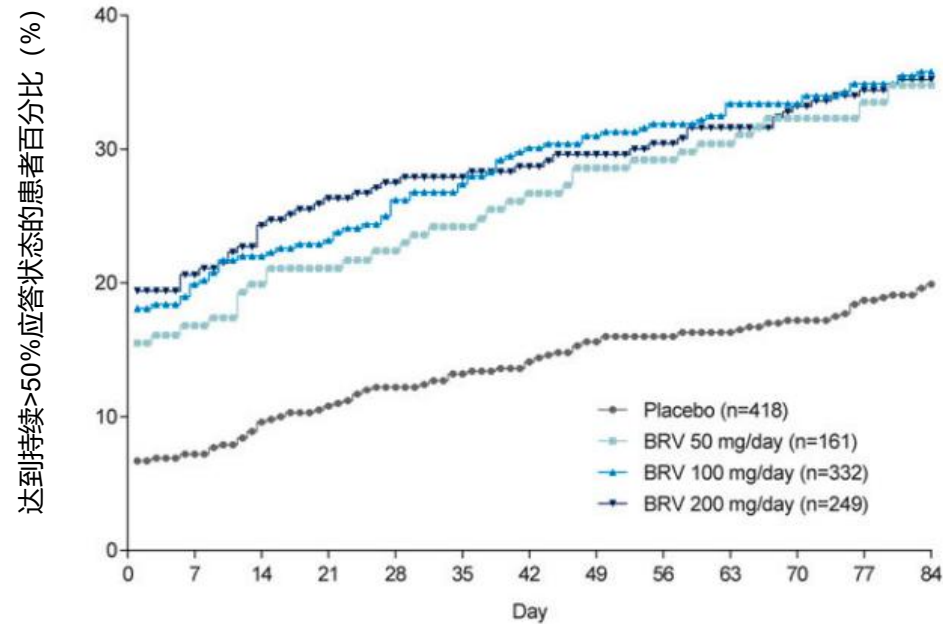
5. Klein P, et al. Acta Neurol Scand. 2020 Aug;142(2):175-180.

6. Fishman J, et al. J Manag Care Spec Pharm. 2018 Sep;24(9):929-938.

布立西坦有效控制癫痫发作，无发作率优于其他抗癫痫药物

三项III期临床研究结果显示¹：15%-20%的患者治疗第一天达到≥50%应答状态

- 纳入1160例16岁及以上局灶性癫痫者，予布立西坦50、100、200mg/d或安慰剂治疗。

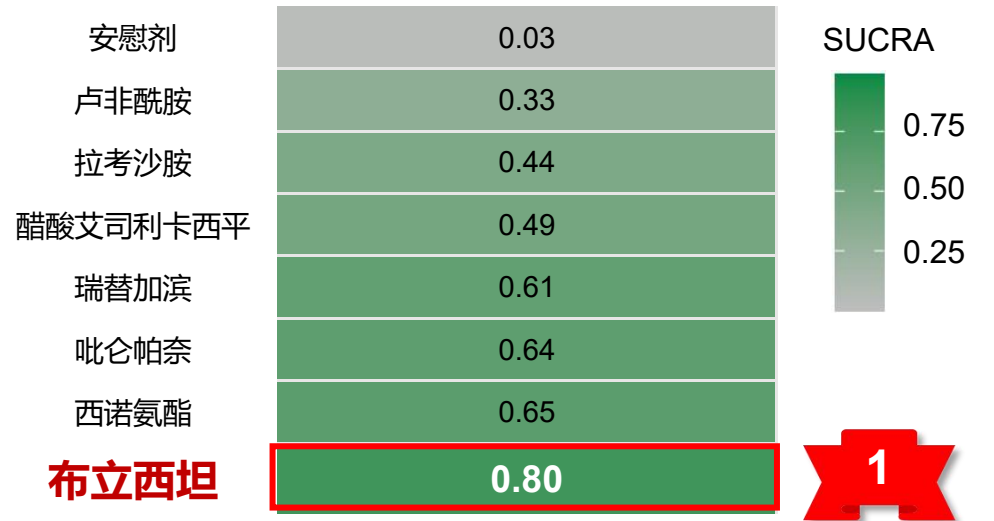


持续≥50%应答者的起效时间

癫痫无发作率优于其他药物

- 涉及11750例患者的网状Meta分析²，评估不同抗癫痫药物的疗效，**布立西坦无发作疗效排名第一**

抗癫痫药物无癫痫发作疗效排名



1. Klein P, et al. Epilepsia. 2017;58(2):e21-e25.

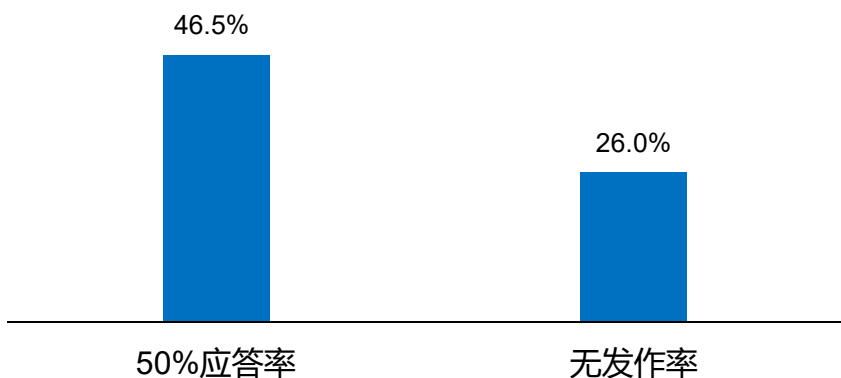
2. Chen Y, et al. EClinicalMedicine. 2024 Feb 28;70:102513.

SUCRA：累积排名曲线下面积

SUCRA值通常在 0 到 1 之间，数值越接近 1，说明该治疗方案效果越好

布立西坦在老年和儿童癫痫患者中均显示稳定疗效

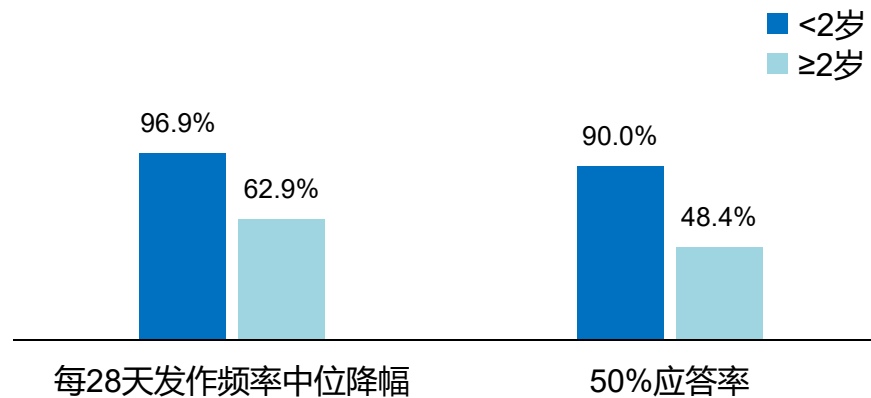
**多国独立、非干预性队列研究¹：
老年患者布立西坦添加治疗12个月
50%应答率为46.5%，无发作率为26.0%**



老年局灶性癫痫亚组疗效

- 纳入1160例≥16岁局灶性癫痫者，其中≥65岁147例(8.9%)，予布立西坦治疗，至少随访6个月，观察12个月

**III期、开放标签、10年长期随访研究²：
布立西坦长期疗效显著，50%应答率超48%，低
龄患儿可达90%**



局灶性癫痫亚组疗效

- 纳入257例1个月~17岁癫痫患儿（72%局灶性癫痫），70.4%的患儿既往使用≥2种ASMs无效。予布立西坦片剂或口服液添加治疗，平均暴露3.2患者年，最长9.5年

1. Faught E, et al. EPILEPSY BEHAV,2024,158:109922.

2. Lagae L,et al.Epilepsia. 2023 Nov;64(11):2934-2946.

布立西坦是国内外指南一致推荐的局灶性癫痫的治疗药物

发表时间	指南/共识	布立西坦推荐意见
2025	NICE指南：儿童，青少年和成人癫痫 ¹	✓ 推荐用于儿童，青少年和成人局灶性发作的添加治疗
2025	突触囊泡蛋白2A结合剂治疗癫痫的中国专家共识 ²	<ul style="list-style-type: none"> ✓ 对于老年癫痫患者，推荐使用BRV（A级推荐，共识率：94.4%） ✓ 推荐用于局灶性发作的单药/添加治疗（A级推荐，共识率：100%） ✓ 推荐用于儿童和青少年癫痫患者
2025	新诊断癫痫初始抗癫痫发作药物治疗指南 ³	✓ 可作为局灶性发作单药初始治疗药物（Ⅲ级证据，B级推荐）
2024	布立西坦临床应用：局灶性癫痫首选添加治疗及拓展应用的德尔菲法共识 ⁴	✓ 基于疗效、耐受性和安全性数据，布立西坦被视为老年患者的合适治疗选择（共识率100%）
2022	中国成人局灶性癫痫规范化诊治指南 ⁵	✓ 可用于局灶性癫痫的单药治疗（Ⅲ级证据，B级推荐）

1. NICE guideline Published: 27 April 2025

2. 中华医学会神经病学分会脑电图与癫痫学组. 癫痫杂志. 2025, 11(6).

3. 新诊断癫痫初始抗癫痫发作药物治疗指南[J]. 中华神经科杂志, 2025, 58(11):1137-1151.

4. Lattanzi S, Neurol Sci. 2024 Sep;45(9):4519-4527.

5. 中华医学会神经病学分会. 中华神经科杂志. 2022;55(12):1341-1352.

填补药品目录空缺，仅特殊人群使用，对基金预算影响小

弥补目录短板

- 目录中**没有布立西坦口服溶液剂型**，弥补这一短板。
- 口服溶液剂型仅用于老年、吞咽困难、需按体重给药，或者胃管给药的患者，**对基金预算影响小**。

符合“保基本”原则

- 申报品被列入国家《**第二批鼓励仿制药品目录**》，体现了临床的迫切需求。
- 作为三代抗癫痫药，布立西坦的治疗价值受到国内外指南一致推荐，应用广泛，目录中口服液剂型空缺，影响老年等弱势群体获得平等治疗。

对公共健康影响

- 快速终止癫痫发作，对**降低脑损害、致残率和致死率**都至关重要，对公共健康影响较大。
- 癫痫是有明显**病耻感**的疾病，癫痫发作不能控制会引发身心疾病，形成公共体系压力和社会负担。

临床管理便利

- 无黑框警告和严重不良反应，起始剂量=治疗剂量，安全简便，医护应用便利。
- 仅特殊人群使用，没有被滥用的风险，不会增加临床和医保管理难度。