

醋酸阿比特龙片 (II) (艾瑞吉®)

全球首创湿法研磨纳米晶工艺，更低剂量，更高生物利用度，消除饮食限制！

成都盛迪医药有限公司

目 录

CONTANTS



01

药品基本信息

02

安全性

03

有效性

04

创新性

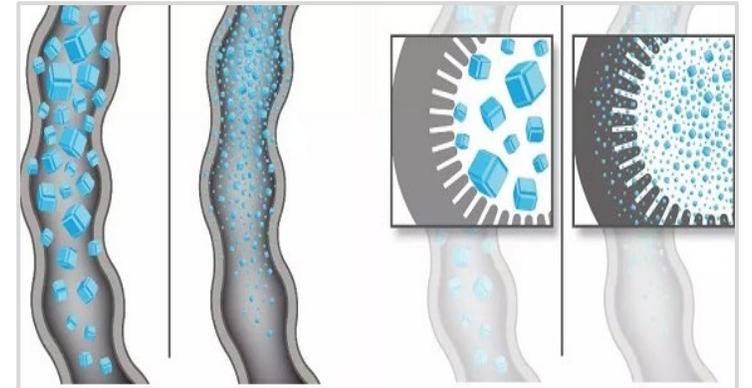
05

公平性

全球首创湿法研磨纳米晶工艺，更低剂量，更高生物利用度，消除饮食限制！



- **通用名：**醋酸阿比特龙片（II）
- **注册规格：**150mg
- **注册分类：**2.2类改良型新药，**同通用名药品情况：**独家
- **首个上市国家及上市时间：**中国，2023.12.26
- **说明书适应症：**与泼尼松或泼尼松龙合用，治疗：
 - ✓ 转移性去势抵抗性前列腺癌（mCRPC）；
 - ✓ 新诊断的高危转移性内分泌治疗敏感性前列腺癌（mHSPC），包括未接受过内分泌治疗或接受内分泌治疗最长不超过3个月。
- **用法用量：**本品的使用剂量和食物影响与其他醋酸阿比特龙产品不同。
本品**可与或不与食物同服**，推荐剂量为**300mg（150mg×2片）**，**口服每日一次**。
 - ✓ mCRPC患者：本品与泼尼松或泼尼松龙5mg口服每日2次联用；
 - ✓ 新诊断的高危mHSPC患者：本品与泼尼松或泼尼松龙5mg口服每日1次联用。



【参照药品】：醋酸阿比特龙片（原研，泽珂®）

【选择理由】：①临床指南推荐、应用广泛的目录内药品；②同活性成分；③上市RCT阳性参照为原研泽珂®，本品相比泽珂®临床疗效相当，且安全性更优。

与参照药相比：本品升级的纳米晶工艺带来**①剂量降低70%的同时疗效相当；②消除食物影响，安全性更优；③不限制服药条件，依从性更高。**

- 传统醋酸阿比特龙片存在生物利用度低、药物暴露量受食物影响大、用药依从性差等临床未满足需求：

1. 生物利用度低：需一次服用1000mg (250mg*4片) 以确保有效性

醋酸阿比特龙是生物药剂学分类系统 (BCS) IV类化合物，药物特性为低溶解性-低渗透性，传统制剂生物利用度极低，空腹口服生物利用度不足10%^[1]，传统醋酸阿比特龙片的推荐剂量为1000mg (250mg*4片)^[2]。

2. 药物暴露量受食物影响大：需严格空腹服药以确保安全性

传统醋酸阿比特龙片受食物影响大，增加药物暴露风险。低脂饮食条件下阿比特龙的 C_{max} 和 $AUC_{0-\infty}$ (暴露量) 增至7和5倍，高脂饮食条件下阿比特龙的 C_{max} 和 $AUC_{0-\infty}$ 增至17和10倍^[2]。因此，传统制剂须在餐前至少1小时和餐后至少2小时空腹服用^[2]。

3. 用药依从性差：老年前列腺癌患者服药易健忘、吞咽困难、呛咳

晚期前列腺癌患者平均确诊年龄67.6岁，老年人群居多，传统醋酸阿比特龙片空腹服药对于老年健忘患者难以严格遵从，影响药物疗效；一次4片吞服量易造成患者吞咽困难或呛咳，影响用药安全。

- 中国前列腺癌2022年发病率为18.6/10万，新增前列腺癌患者为13.4万，发病率年增速5.4%，位列男性泌尿生殖系统恶性肿瘤首位^[3]。

本品消除食物影响，药物暴露水平安全稳定，说明书无饮食限制

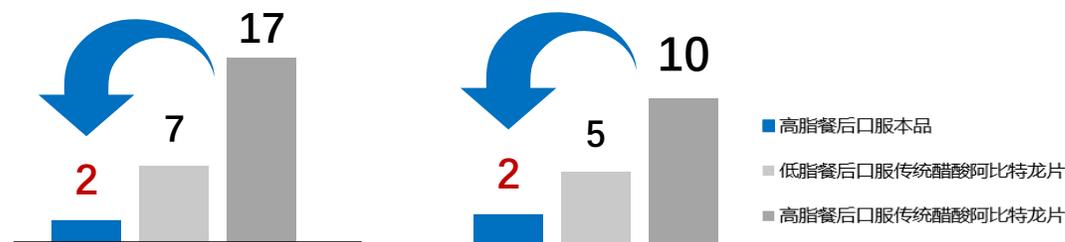
- 本品I期药代动力学研究显示本品消除食物影响，说明书无饮食限制。

1

传统醋酸阿比特龙片受食物影响巨大，药物暴露风险高。研究结果显示**本品消除食物影响，暴露水平安全稳定**^[1]。

相比空腹服药的 C_{max} 倍数

相比空腹服药的 $AUC_{0-\infty}$ 倍数



2

本品说明书用法用量中无饮食限制^[2]

为避免用药错误和用药过量，请注意本品的使用剂量和食物影响与其他醋酸阿比特龙产品不同。
本品**可与或不与食物同服**。

传统醋酸阿比特龙片有严格限制空腹条件^[3]

必须每日空腹，单次服用。
传统醋酸阿比特龙片必须在餐后至少2小时服用，且在服用本品后至少1小时内不得进食。

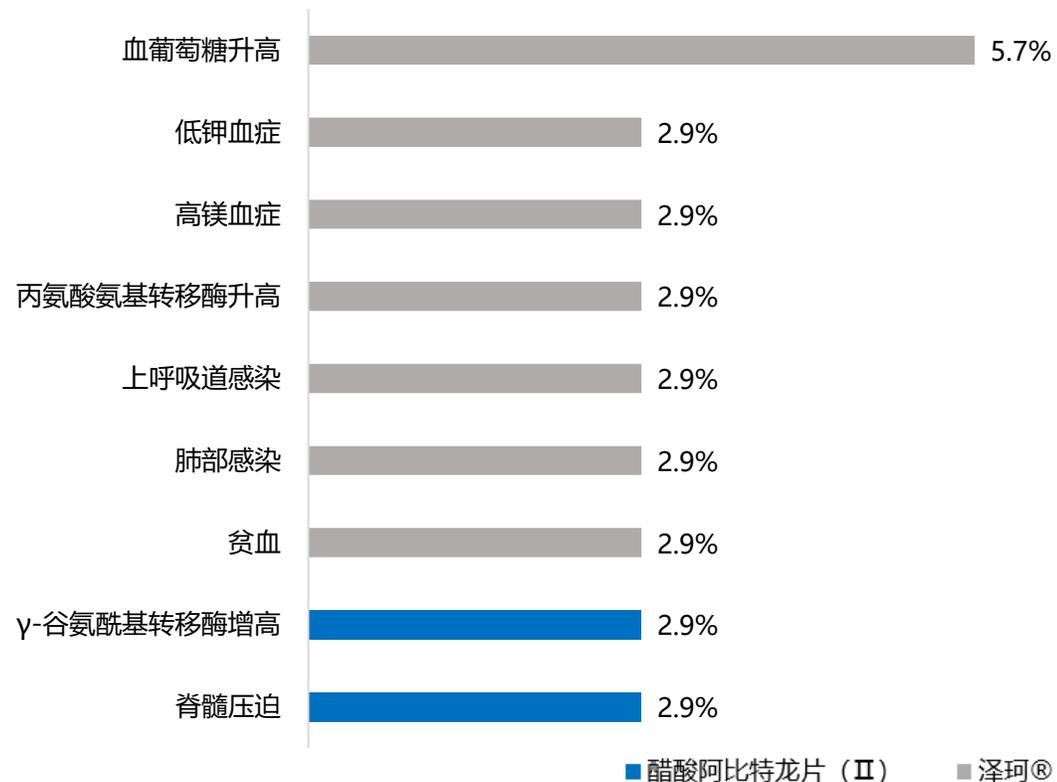
头对头RCT表明本品整体安全性更优，不良事件严重程度和发生率更低

- 本品国内多中心II期临床研究显示：与醋酸阿比特龙片（原研，泽珂®）1000mg相比，本品300mg试验期间**所有不良事件（TEAE）、≥3级TEAE、严重不良事件（SAE）、与试验药物相关不良事件（TRAE）和≥3级TRAE发生率均更低，整体安全性更优**^[1]。

II期临床试验安全性结果汇总

| 不良事件相关指标 | 醋酸阿比特龙片（II） 300mg | 泽珂® 1000mg |
|---------------------|----------------------|------------------|
| TEAE的受试者数 | 26 (76.5%) | 30 (85.7%) |
| ≥3级TEAE的受试者数 | 3 (8.8%) | 8 (22.9%) |
| SAE的受试者数 | 1 (2.9%) | 4 (11.4%) |
| 与试验药物相关TEAE的受试者数 | 18 (52.9%) | 19 (54.3%) |
| 与试验药物相关≥3级TEAE的受试者数 | 2 (5.9%) | 5 (14.3%) |

与试验药物相关≥3级TEAE发生率

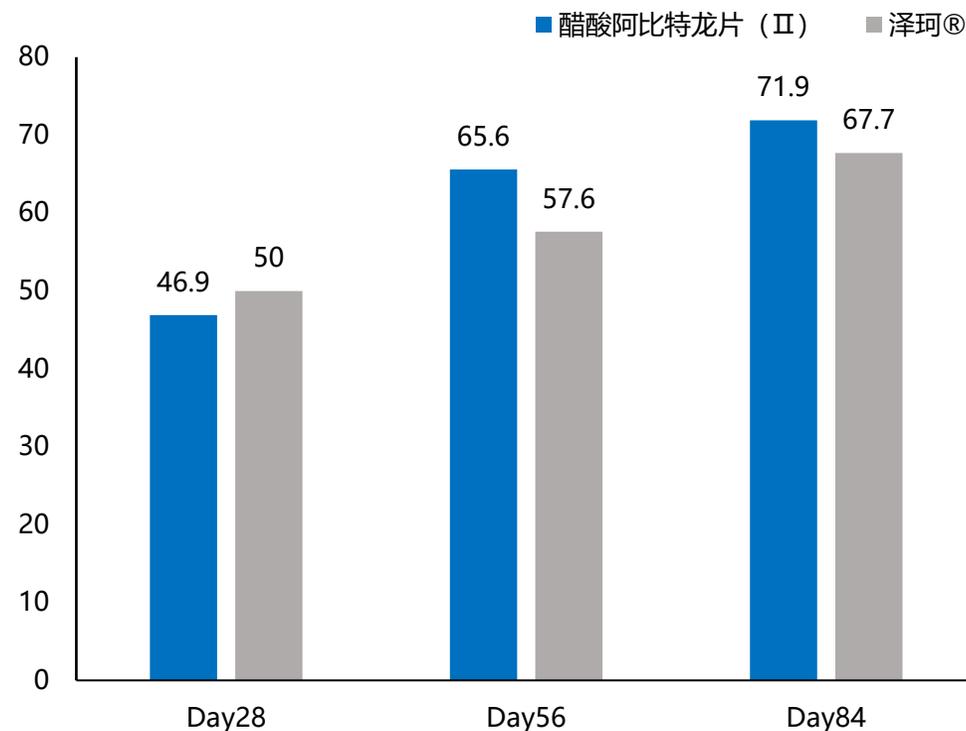


- 本品国内多中心II期临床研究显示：与醋酸阿比特龙片（原研，泽珂®）1000mg相比，本品300mg的**疗效相当，两组患者的血清睾酮浓度无统计学差异，前列腺癌特异性抗原下降50%（PSA 50）缓解率在持续给药后更优^[1]**。

II期临床试验主要疗效指标：血清睾酮浓度分析

| 血清睾酮浓度 (ng/dL) | 醋酸阿比特龙片 (II) 300mg | 泽珂® 1000mg |
|-----------------------|-----------------------|---------------|
| 基线几何均值 | 9.342 | 8.573 |
| Day9/10 (主要终点) | | |
| 几何均值 | 1.053 | 1.000 |
| 几何均值比 (90%CI) | 1.053 (0.998, 1.110) | |
| Day28 | | |
| 几何均值 | 1.015 | 1.000 |
| 几何均值比 (90%CI) | 1.015 (0.991, 1.041) | |
| Day56 | | |
| 几何均值 | 1.020 | 1.000 |
| 几何均值比 (90%CI) | 1.020 (0.987, 1.054) | |
| Day84 | | |
| 几何均值 | 1.042 | 1.000 |
| 几何均值比 (90%CI) | 1.042 (0.988, 1.100) | |

PSA 50 缓解率



国内外指南一致推荐阿比特龙作为转移性前列腺癌患者的一线治疗方案



中国CSCO前列腺癌
诊疗指南2023版^[1]

I级推荐, 1A类证据: ADT联合**阿比特龙**加泼尼松治疗转移性激素敏感性前列腺癌 (mHSPC)、转移性去势抵抗性前列腺癌 (mCRPC) 患者。



中国泌尿外科和男科
疾病诊断治疗指南2023版^[2]

强推荐, 1级证据: ADT联合**阿比特龙**加泼尼松治疗mHSPC、mCRPC患者。



欧洲EAU前列腺癌
临床指南2023版^[3]

强推荐: ADT联合**阿比特龙**加泼尼松一线治疗mHSPC患者;
mCRPC患者根据既往治疗情况选择治疗方案, 推荐**阿比特龙**。



美国NCCN前列腺癌
临床指南2023版^[4]

1类推荐: mHSPC患者的系统治疗推荐首选方案为ADT联合**阿比特龙**;
mCRPC患者既往未经新型内分泌治疗推荐首选方案为**阿比特龙**。



美国AUA前列腺癌
临床指南2023版^[5]

强推荐, A类证据: ADT联合**阿比特龙**加泼尼松治疗mHSPC、mCRPC患者。

全球首创湿法介质研磨纳米晶工艺创新，兼顾安全、有效和依从性获益

- 全球首创湿法介质研磨纳米晶制备工艺，拥有中、美独家专利，带来更低剂量，更高生物利用度，消除饮食限制的临床优势。

1. 湿法介质研磨纳米晶制备工艺：提高阿比特龙溶解度和溶出速率，在不同环境下稳定溶出，降低食物影响

将原料药直接微粉化处理至纳米级药物颗粒，提高原料药在低溶解性介质中的溶解度和溶出速率；减少阿比特龙纳米晶在不同pH值介质中的体外溶出速率差异，降低食物影响^[1]。

2. 新型辅料促吸收剂SNAC：协同提高阿比特龙的口服生物利用度，降低用药剂量

8-（2-羟基苯甲酰胺基）辛酸钠（SNAC）作为一种高效促吸收剂，促进药物跨细胞转运，增强药物胃肠道吸收能力，协同提高本品口服生物利用度^[2]。

安全性优势

消除食物影响，药物暴露水平安全稳定，说明书无饮食限制，整体安全性更优，不良反应发生率更低

有效性优势

本品每日300mg（2片）的用药剂量可达到普通阿比特龙原研每日1000mg（4片）相当疗效

依从性优势

本品不限制服药条件，服药片数每年减少730片，尺寸更小，增加刻痕，可掰片使用

造福老年前列腺癌患者，保基本、补短板、临床管理难度小



适应症对公共健康的影响大

前列腺癌疾病负担高，老年群体的服药安全和便利亟需重视：

- 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；
- 转移性前列腺癌患者平均确诊年龄67.6岁，老年人群居多，老年前列腺癌患者服药易健忘、吞咽困难、呛咳。



符合“保基本”原则

本品高质量替代目录内同类药品，医保基金支出可控：

- 本品为转移性前列腺癌患者提供有效性、安全性和依从性更优的治疗选择，满足日益增长的高质量用药需求；
- 醋酸阿比特龙是转移性前列腺癌治疗的首选方案，本品可替代目录内同类产品，医保基金支出影响有限可控。



弥补药品目录短板

本品纳米晶工艺创新，兼顾安全、疗效和用药依从性：

- 相比于传统醋酸阿比特龙片，本品全球首创湿法研磨纳米晶技术提高生物利用度，剂量降低70%的同时疗效相当；消除食物影响并提高安全性；尺寸更小，老年和特殊患者服药依从性更高。



临床管理难度小

本品目标适应症人群明确，口服给药片数少，用药方便：

- 本品市场定位明确，严格把控临床滥用风险；
- 转移性前列腺癌临床诊断标准清晰，医保经办审核方便；
- 临床已使用醋酸阿比特龙多年，本品用法用量明确，口服给药方便，用药片数每年减少730片，临床管理难度小。

- **有效性：** 给药剂量降低70%的同时降低血清睾酮疗效相当，PSA 50缓解率持续给药更优
- **安全性：** 消除食物影响，整体安全性更优，不良反应发生率更低
- **创新性：** 2.2类改良型新药，中美专利，全球首创湿法介质研磨纳米晶制备工艺
- **公平性：** 造福老年前列腺癌患者，保基本、补短板、临床管理难度小