

# 吗替麦考酚酯干混悬剂 (赛祈安®)

特色给药 精准调节 守护器官移植儿童安全成长

液体剂型 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

02

有效性

03

安全性

04

创新性

05

公平性

目录

# 本品为全国首家且**唯一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<sup>1,2</sup>

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	✓ 限口服吞咽困难的器官移植后抗排异反应				
用法用量	<p>✓ 肾脏移植：成人推荐口服剂量为每次 <b>1g</b>，每日 <b>2</b> 次。</p> <p>✓ 肝脏移植：成人推荐口服剂量为每次 <b>0.5~1 g</b>，每日 <b>2</b> 次。</p> <p>✓ 狼疮性肾炎患者：诱导期治疗：成人推荐剂量为每日 <b>1.5~2g</b>，分两次口服给药。维持期治疗：成人推荐剂量为每日 <b>0.5~1.5g</b>，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2家

### 📄 申请新增适应症纳入医保支付范围并解限

该剂型“成人狼疮性肾炎”为国内独家获批适应症，申请新增纳入医保支付范围，并解除医保限制，按照产品说明书进行支付。

### 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，儿童用药更安全**
- ✓ **液体制剂，特殊用药需求患者服药无忧**

1. 赛祈安药品说明书; 2. 国家基本医疗保险、工伤保险和生育保险药品目录 (2024 年)

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<sup>1</sup>；狼疮性肾炎死亡率：7.6%<sup>2</sup>。

» 移植后排斥反应为受者免疫系统攻击供体抗原，导致发热、移植物疼痛及功能丧失。肾移植排斥率：6%~11%<sup>3</sup>；肝移植排斥率：急性20.5%<sup>4</sup>、慢性2%~5%<sup>5</sup>。移植后3年死亡率为1.9%<sup>6</sup>。

» 中国患者器官移植现状<sup>7</sup>：截至2021年（2015-2021年），我国肝移植共35566例，其中儿童6465例，占比18.2%；肾移植共75081例，其中儿童2171例，占比2.9%。2021年当年儿童肝、肾移植分别为1156和680例，占全国当年肝/肾移植人群的19.8%和5.6%。

### 同疾病治疗领域内或同药理作用药品上市情况

- 1997年吗替麦考酚酯原研产品在中国上市，现在国内已上市有胶囊、片剂、缓释胶囊和干混悬剂等多种剂型。目前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。
- 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。
- 本品为唯一过评干混悬剂，适应症包括III-V型狼疮性肾炎患者，而同通用名产品的适应症仅限器官移植后抗排斥。
- 目前有一家同类产品上市（未过评），虽然本品和其同属干混悬剂，但本品是先配制为200mg/mL吗替麦考酚酯混悬液后取药注射器抽吸定量药液口服，可有效解决患者用药精准性问题，显著区别于国内已上市的固定剂量冲服的同类产品。

# 国内唯一过评, 与原研干混悬剂等效

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。

# 国内与国际权威指南推荐**吗替麦考酚酯**是狼疮性肾炎一线治疗方案

有效性  
2/2

## 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)。

# 安全可控，安全性与原研干混悬剂一致

## 药品说明书<sup>1</sup>记载的安全性信息

- 基于吗替麦考酚酯临床试验和上市后经验的数据，且已被证明在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。
- 存在黑框警告：免疫抑制剂会增加感染易感性，可能促进淋巴瘤和其他肿瘤的发生，具有致突变和致畸效应。但基于长期维持治疗研究<sup>2</sup>和网状Meta分析<sup>3</sup>等多项研究数据证明吗替麦考酚酯长期不良反应可控，安全性良好。

## 药品说明书记载的药物相互作用

- 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。

## 药品说明书记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。

本品为国内**首家且唯一可精准给药**，同时可应用于狼疮性肾炎的**吗替麦考酚酯干混悬剂**

本品被纳入优先审评审批品种<sup>1</sup>，为国内**唯一过评**的干混悬剂，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**<sup>2</sup>，可为患者提供精准给药，避免浪费。而同类产品为固定剂量500mg/袋<sup>3</sup>，无法精准给药。且本品使用**杂果粉末香精等辅料改善味道**<sup>2</sup>，可提高患者用药的依从性。

应用创新  
与  
技术创新

◆ 吗替麦考酚酯是窄治疗指数药物<sup>4</sup>，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**等狼疮性肾炎和器官移植患者的**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. <https://www.cde.org.cn/main/xxgk/listpage/2f78f372d351c6851af7431c7710a7312> 赛祈安药品说明书； 3. 弥他乐药品说明书； 4. 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>.

# 满足器官移植及狼疮性肾炎患者的精准用药需求，无滥用风险

## ◆ 狼疮性肾炎造成严重的疾病负担，中国儿童移植患者领跑全球

- 狼疮性肾炎（LN）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 LN<sup>1</sup>，超过30%的狼疮性肾炎患者可在20年内进展为终末期肾脏病<sup>2</sup>，且狼疮性肾炎是SLE患者死亡的重要原因，死亡率为7.6%<sup>3</sup>。
- 截至2021年（2015-2021年），我国肝移植共35566例，其中儿童6465例，占比18.2%；肾移植共75081例，其中儿童2171例，占比2.9%。2021年当年儿童肝、肾移植分别为1156和680例，占全国当年肝/肾移植人群的19.8%和5.6%<sup>4</sup>。

## ◆ 适用不同年龄、体重或特殊需求的患者人群，给药剂量精准易调

- 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，并且避免用药浪费，降低患者的经济负担，节约医保资金；
- 不同年龄、体重或特殊需求的患者需要精准给药，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。

## ◆ 弥补目录短板，为患者提供更优用药选择

- 目前干混悬剂医保适应症未囊括特殊用药需求的器官移植患者以及狼疮性肾炎患者。
- 本品通过杂果粉末香精（果香味）等辅料改善制剂味道<sup>5</sup>，有助于提高患者的服药依从性。

## ◆ 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，降低超说明书滥用风险。