

布比卡因脂质体注射液（艾恒平®）

国内首款超长效局麻药

持久镇痛 加速康复

江苏恒瑞医药股份有限公司

目录

CONTENTS



01 药品基本信息

国内**首款超长效局麻药**，拟新增腓窝坐骨神经、收肌管神经阻滞产生术后区域镇痛适应症

02 创新性

全球首仿上市的化药3类新药，**突破**国际工艺壁垒，**填补**国内超长效局麻药**空白**

03 有效性

术后疼痛强度**显著降低**，阿片类药物用量**显著减少**，国内外多个外科指南共识一致推荐

04 安全性

安全性良好，具有更高的**中枢及心脏安全**，无需借助镇痛设备

05 公平性

本品已大幅降价准入国家医保，惠及广大术后镇痛患者

国内首款超长效局麻药，拟新增腓窝坐骨神经阻滞、收肌管阻滞产
生术后区域镇痛适应症

恒瑞

药品名称		布比卡因脂质体注射液
注册规格		20ml:266mg, 10ml:133mg
注册类别		化药3类
适应症		医保目录内适应症： ①12岁及以上的患者单剂量浸润产生术后局部镇痛 ②成人肌间沟臂丛神经阻滞产生术后区域镇痛 本次拟新增适应症： ③成人腓窝坐骨神经阻滞产生术后区域镇痛 ④成人收肌管阻滞产生术后区域镇痛
用法用量		适应症①：成人最大推荐剂量266mg，12岁至17岁儿童推荐剂量4mg/kg（最高266mg） 适应症②：推荐剂量133mg（10ml） 适应症③：推荐剂量133mg（10ml） 适应症④：推荐剂量133mg（10ml）与50 mg（10ml）0.5%盐酸布比卡因混合使用
中国大陆上市情况		本品2022年11月上市 湖南科伦制药同通用名产品2024年8月上市，仅获批适应症①、②
全球首次上市国家及时间		美国，2011年10月

参照药建议：连续神经阻滞镇痛技术

选择理由

- 本品是**国内首款且唯一超长效**局麻药，单次注射镇痛时长远远超当前局麻药，尚无其他同类药品
- 本品与其他剂型布比卡因没有生物等效性
- 本品临床效果最接近的是借助导管、镇痛泵等设备延长镇痛疗效的连续神经阻滞技术

与参照药/同类竞品相比的优势：

- 持久镇痛**：利用DepoFoam技术，实现药物平稳缓释，术后镇痛长达**72小时**
- 安全方便**：具有更高的中枢及心脏**安全性**，无需借助镇痛设备，操作更**方便**
- 减少阿片**：**显著减少65%-78%**术后阿片类药物用量，提高镇痛质量
- 加速康复**：促进术后早期恢复，**显著缩短36%**住院时间

现有镇痛技术存在镇痛时长短、疗效弱、阿片用量大、需导管输注、技术要求高等临床未满足需求



术后镇痛

- 2022年，我国住院病人手术高达**8271.75万**人次，约**68%**手术患者经历术后疼痛，**48.7%**为中度至重度疼痛。
- 本次新增适应症针对**骨科下肢手术**（如全膝关节置换术、踝关节手术）后镇痛，均需**长时间镇痛**。
- 术后镇痛控制不当会引发：各类并发症（如呼吸道感染、心理症状、深静脉血栓和慢性疼痛），延迟术后康复，延长住院时间，影响患者生活质量，增加患者经济负担。

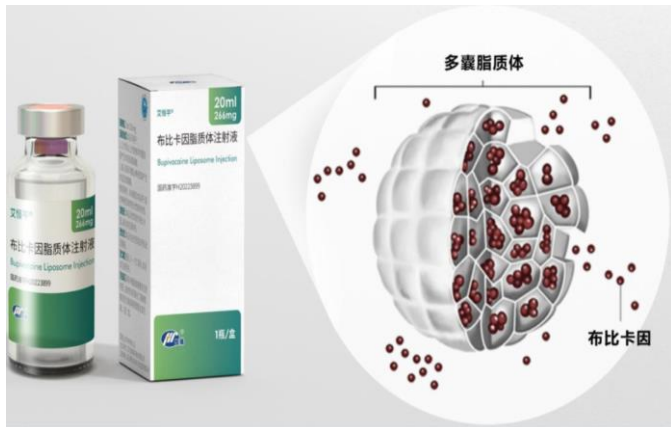
现有治疗方案	临床未满足需求	本品弥补未满足需求情况
单次镇痛技术	其他局麻药镇痛时长短，仅可维持6~8小时，难以满足骨科手术长时间镇痛需求，易出现“术后爆发痛”。	单次给药即可实现72小时持续有效镇痛，节省后续补救治疗费用。
持续镇痛技术	- 常用的PCIA（患者静脉自控镇痛）镇痛疗效较弱，阿片类药物用量大，相关不良反应多。 - 局麻药持续镇痛技术要求高，经济负担重，需导管输注，易引发渗漏、感染等风险，因此临床应用受限。 - 患者镇痛疗效不佳会延迟术后康复，延长住院时间。	显著减少阿片药品用量，避免相关不良反应处理费用。 无需置管及镇痛泵等额外设备，降低仪器成本，节省医疗耗材费用。 显著缩短住院时间，节省住院相关费用。

文献来源/说明：徐建国 成人手术后疼痛处理专家共识 [临床麻醉学杂志,2017,33(09):911-917.

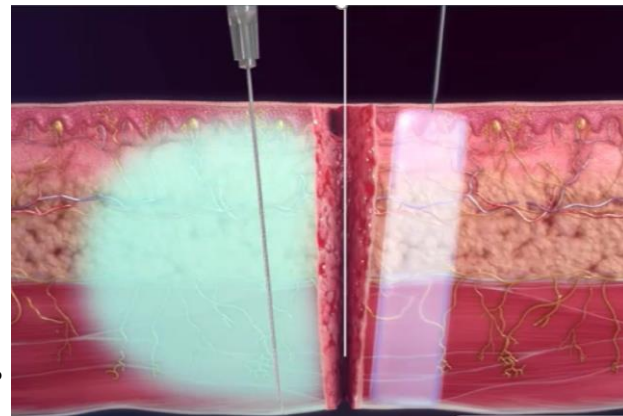
全球范围内获批上市的首仿药，突破国际工艺壁垒，并在美国成功获批上市，单次给药可提供长达72小时镇痛



全球首仿上市的化药3类新药，突破十余年高技术门槛，填补国内超长效局麻药空白，并获得美国FDA获批上市



利用特有的DepoFoam技术将布比卡因封装在多囊脂质体内，该剂型进入体内后，随着某一囊泡的破裂，布比卡因只从破裂的囊泡中释放，不同囊泡破裂的时间不同，故可延长布比卡因的释放时间，术后镇痛时长可达72h。



多囊脂质体的粒径较大，其局部注射后不容易扩散到周围组织，处于精确的位置。

临床价值获益

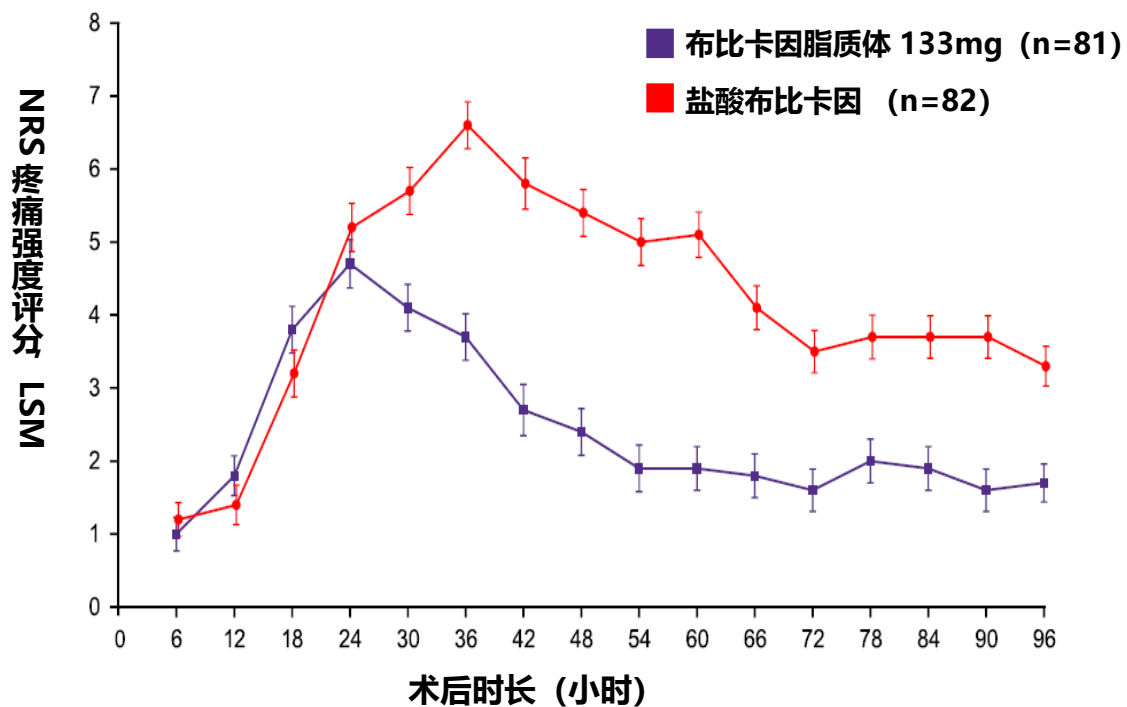
1. 突破性解决现有长效局麻药单次给药镇痛时长不足的问题，**避免现有局麻药连续或多次给药的成本和并发症风险**
2. 突破性助推了“**少阿片**”为主流的多模式镇痛的发展
3. 突破性**降低了布比卡因中枢及心脏毒性的风险**
4. 与持续镇痛技术相比，**避免导管、镇痛泵等额外设备**带来的安全性风险和费用，简化医护人员操作

腓窝坐骨神经阻滞：本品术后疼痛强度显著降低45%，阿片类药物用量显著减少61%，无需阿片患者增加近5倍

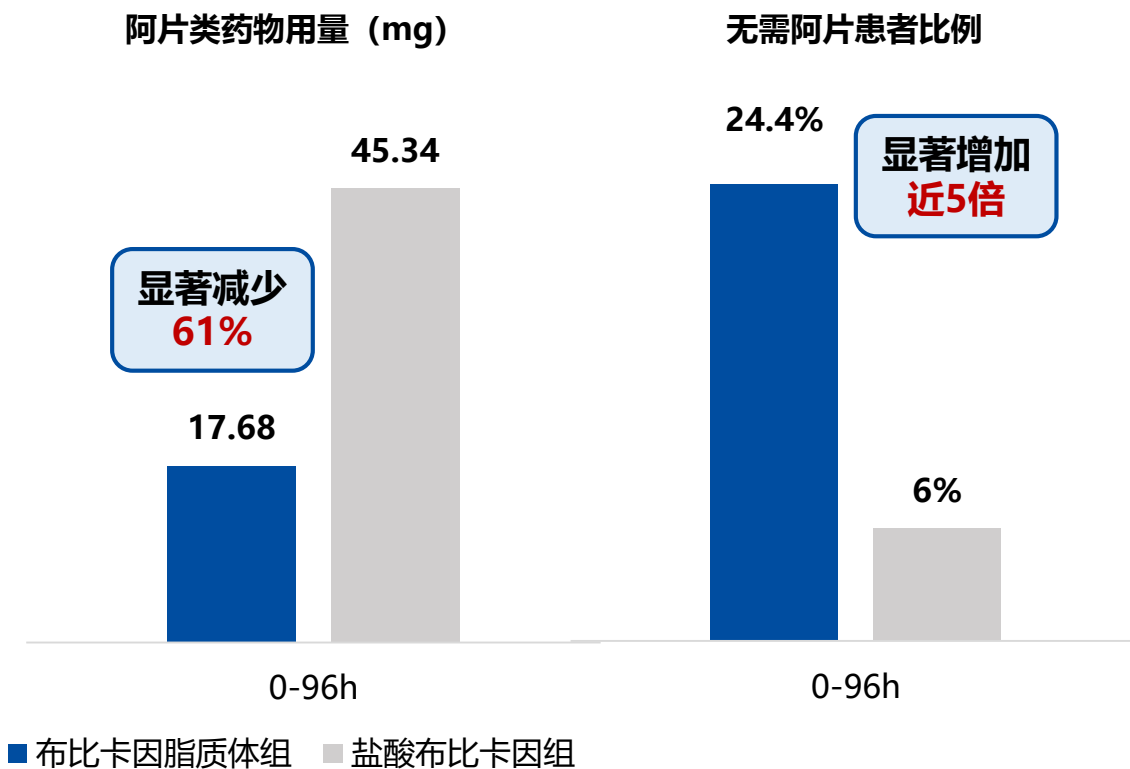


术后疼痛强度显著降低45%

主要疗效指标疼痛强度评分AUC₀₋₉₆为**207.4 vs 371.4** ($P < 0.00001$)



阿片类药物用量显著减少61%，近5倍患者无需阿片

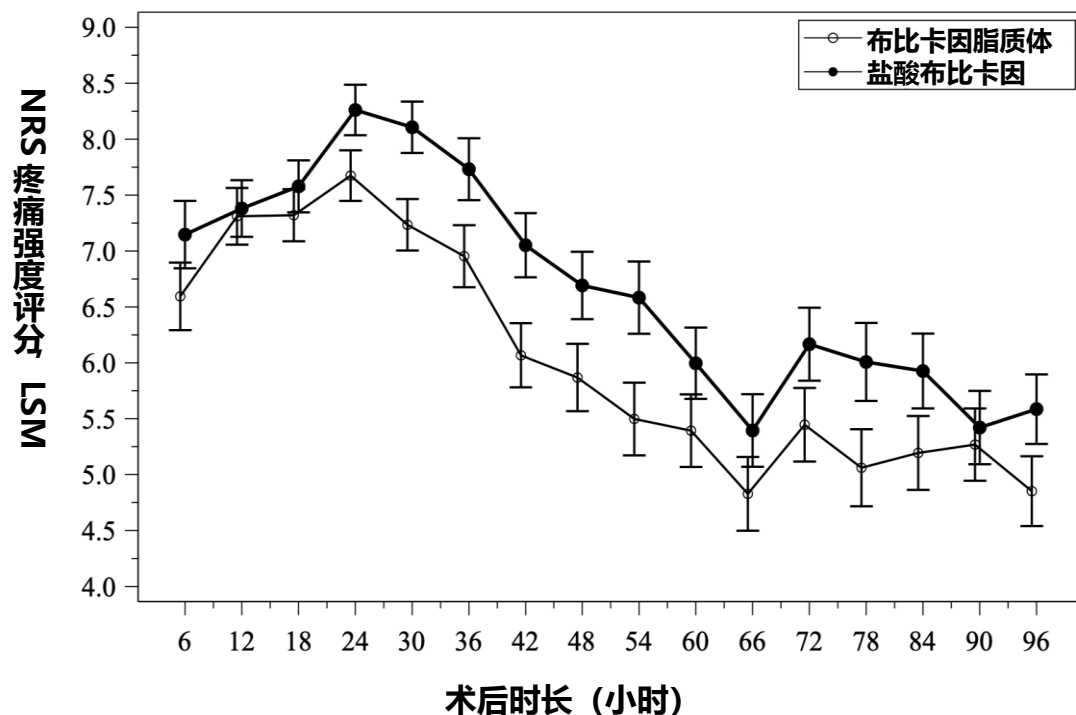


收肌管神经阻滞：本品术后疼痛强度显著降低11%，阿片类药物用量显著减少24%



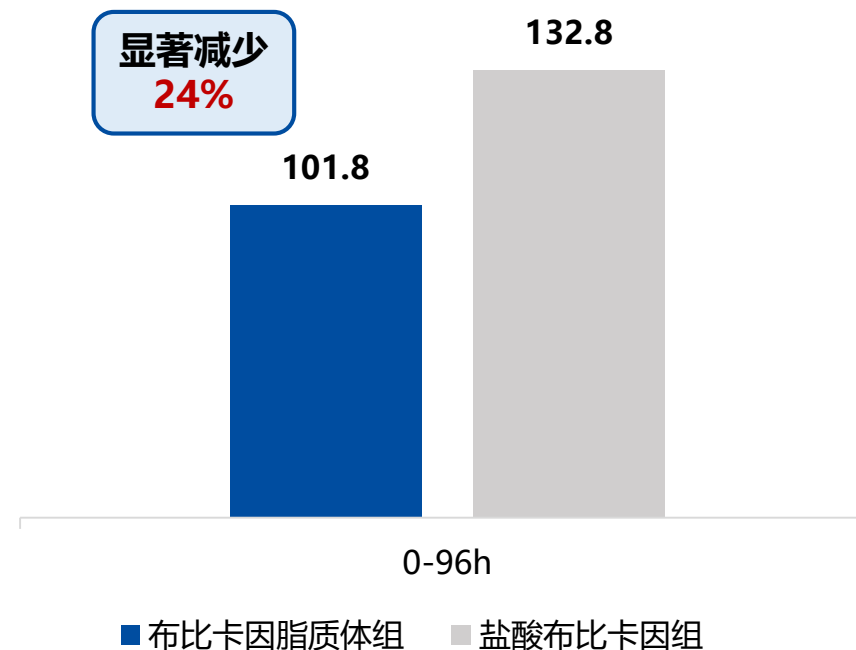
术后疼痛强度显著降低11%

主要疗效指标疼痛强度评分AUC₀₋₉₆为**568.9 vs 634.7** (P=0.0074)



阿片类药物用量显著减少24%

阿片类药物用量 (mg)

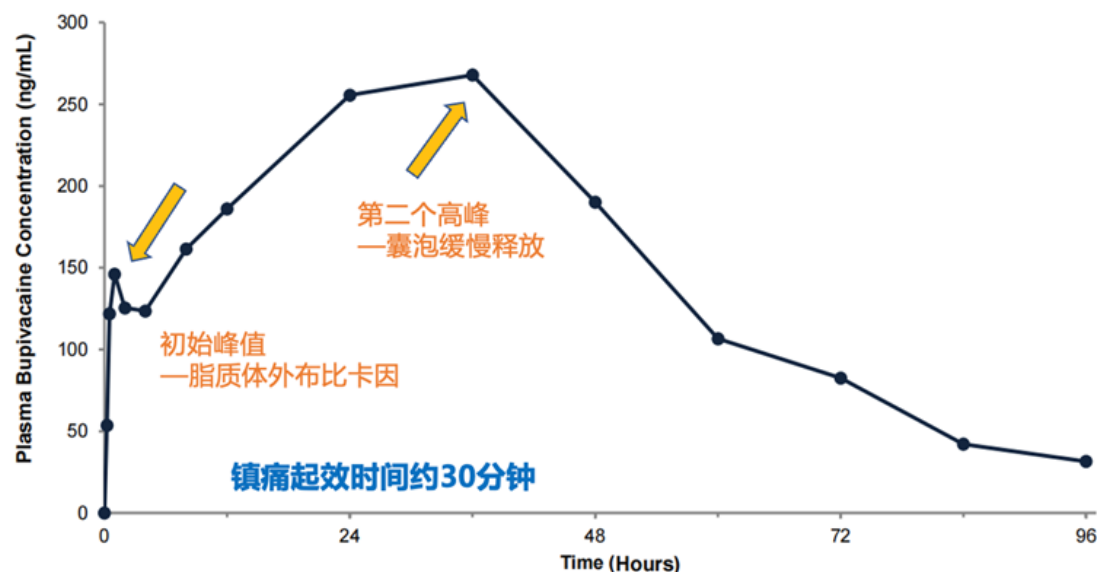


布比卡因脂质体持久镇痛疗效佳，安全性好，国内外多个外科指南共识一致推荐



持续镇痛超72h

时间	4h	24h	48h	72h
体外释放度	25%	51%	68%	87%



文献来源/说明: 1. Carmichael JC, Keller DS, et al. Dis Colon Rectum. 2017;60(8):761-784.
2. Temple-Oberle C, Shea-Budgell MA, et al; ERAS Society. Plast Reconstr Surg. 2017;139(5):1056e-1071e.
3. Nelson G, Bakkum-Gamez J, et al. Int J Gynecol Cancer. 2019;29(4):651-668.
4. Batchelor TJP, Rasburn NJ, et al. Eur J Cardiothorac Surg. 2019;55(1):91-115.
5. 国家老年疾病临床医学研究中心(湘雅). 等. 直肠肛门日间手术临床实践指南(2019版)[J]. 中国普通外科杂志, 2019(011):028.
6. 国家卫生健康委加速康复外科专家委员会骨科专家组. 等. 骨科加速康复围手术期疼痛管理专家共识[J]. 中华骨与关节外科杂志, 2022, 15(10):7.
7. 世界中医药学会联合会肛肠病专业委员会. 等. 痔的围手术期管理专家共识[J]. 中国微创外科杂志, 2023, 23(6):401-408.

2017 ASCRS/SAGES: 结直肠术后加速康复临床实践指南

布比卡因脂质体伤口浸润或腹横肌平面阻滞对接受开放式和腹腔镜结直肠手术的患者有利。

2017 ERAS: 乳房重建最佳围术期管理共识

单次注射布比卡因脂质体可长效镇痛，避免持续导管输注。

2018 ERAS/ESTS: 肺部手术后加速康复指南

推荐胸外科手术应用椎旁阻滞进行镇痛，指出布比卡因脂质体能提供长达96小时的肋间神经阻滞。

2019 ERAS: 妇科肿瘤围术期管理指南

布比卡因或布比卡因脂质体切口浸润合理使用，无全身性副作用，应作为多模式镇痛的组成部分，纳入ERAS方案。

2019 直肠肛门日间手术临床实践指南

布比卡因脂质体可以明显减少术后96 h内的疼痛；术后前3d，长效脂质体布比卡因组患者阿片类药物的人均用量明显减少。

2022 骨科加速康复围手术期疼痛管理专家共识

布比卡因脂质体可延长阻滞后的镇痛时间。

2023 痔的围手术期管理专家共识

局部麻醉是多模式疼痛控制策略的基石，术后注射布比卡因脂质体可实现长效术后镇痛。

本品安全性良好，具有更高的**中枢及心脏安全**，**无需借助镇痛设备**，安全方便

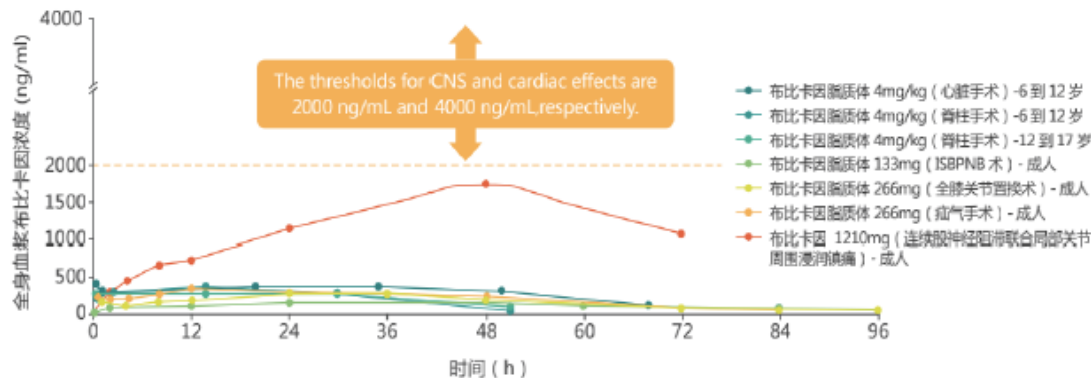


说明书刊载的安全性信息

- 布比卡因脂质体注射液单药用于膈窝坐骨神经阻滞：最常见不良反应（发生率 $\geq 10\%$ ）为恶心、便秘。
- 布比卡因脂质体注射液联合盐酸布比卡因用于收肌管神经阻滞：最常见不良反应（发生率 $\geq 10\%$ ）为恶心、便秘。
- BE 研究：本品不良反应发生率较低（12.5%），均为轻度不良反应，不需治疗或处置，总体安全性良好。

更高的中枢及心脏安全

- 本品在2种最大推荐剂量下的最高血药浓度（207、867ng/ml）均**远低于**中枢神经、心脏毒性阈值（2000、4000ng/ml）。



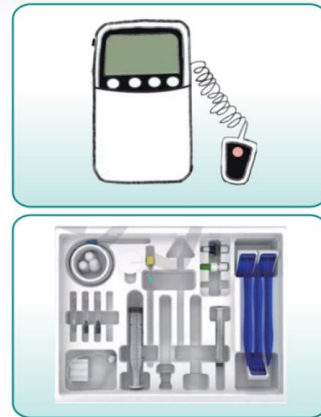
不同场景下使用布比卡因脂质体或盐酸布比卡因后的血浆布比卡因浓度与布比卡因毒性阈值

无需借助镇痛设备，安全方便

- 本品**不需要额外导管和镇痛泵**即可实现72h镇痛，规避了导管感染、移位、脱落、穿刺部位渗漏等相关安全性风险。



VS



本品已大幅降价准入国家医保，惠及广大患者，本次新增适应症将进一步满足下技术后镇痛用药需求



促进公共健康

- 术后疼痛公共影响大，本品为国内首个超长效局麻药，单次注射可实现**72h术后镇痛**，高质量满足患者镇痛管理需求。

符合“保基本”原则

- 本品2023年已大幅降价准入国家医保，极大减轻患者经济压力，确保更多中国围手术期患者能够享受到无痛治疗的关怀。

弥补目录短板

- 本品填补目录内超长效局麻药空白，且是唯一明确12岁以上儿童适应症的局麻药。
- 本次新增适应症将进一步惠及成人**下技术后持久镇痛**的临床需求。

临床管理难度小

- 本品适应症、使用方法与条件、最大用量明确，经办审核难度小、临床滥用风险小。
- 布比卡因脂质体单剂量给药，**简化医护操作**，患者依从性高，便于临床管理。

国内首个超长效局麻药，突破国际工艺壁垒，填补临床空白
显著降低术后疼痛强度、阿片类药品用量，更高心脏和中枢安全
本次新增适应症将进一步惠及下肢术后镇痛患者

江苏恒瑞医药股份有限公司