



甲磺酸瑞厄替尼片 (圣瑞沙®)

南京圣和药业股份有限公司

CONTENTS

目录



01

药品基本信息

非小细胞肺癌患者治疗**新选择**

02

安全性

相比同类产品**安全性更优**

03

有效性

显著**延缓疾病进展**，具备持久药效

04

创新性

结构创新，拥有多项专利，兼具有效性、安全性和给药便捷性

05

公平性

符合**“保基本”**原则，有效弥补目录短板，便于临床管理

- 通用名：**甲磺酸瑞厄替尼片
- 注册规格：**100 mg
- 用法用量：**本品推荐剂量为 200 mg，每天一次口服使用，直至出现疾病进展或无法耐受的毒性
- 中国大陆首次上市时间：**2024年6月11日
- 目前大陆地区通用名药品上市情况：**独家创新药
- 全球首个上市国家/地区及上市时间：**2024年6月，中国
- 是否为OTC药品：**否
- 适应症：**具有表皮生长因子受体（EGFR）外显子19缺失或外显子21（L858R）置换突变的局部晚期或转移性非小细胞肺癌（NSCLC）
成人患者的一线治疗。既往经表皮生长因子受体（EGFR）酪氨酸激酶抑制剂（TKI）治疗时或治疗后出现疾病进展，并且经检测确认存在EGFR T790M突变阳性的局部晚期或转移性非小细胞肺癌（NSCLC）成人患者的治疗
- 参照药品：**甲磺酸奥希替尼片

不良反应情况

不良反应：

- 未发生非预期的不良反应，主要为EGFR-TKI类药物常见的不良反应。
- 瑞厄替尼的一项III期随机对照多中心临床试验（SHC013-III-01；一线治疗）和一项II期多中心临床试验（SHC013-II-01；二线治疗）的数据进行汇总分析。两项试验总计有478例晚期NSCLC患者接受瑞厄替尼治疗，其中最常见的不良反应包括腹泻、血肌酸磷酸激酶升高、白细胞计数降低、转氨酶升高等，多数为1-2级，仅4.8%的患者发生了严重不良反应，总体耐受性良好。
- QT间期延长（6.3%）、心肌收缩力改变（0.2%）、眼部疾病（2.1%）等第三代EGFR-TKI关注的重要不良反应发生率均较低，无间质性肺病发生。

剂量调整：

- 无需因为患者的年龄、体重、性别和吸烟状态对剂量进行调整，轻度肝功能损害、轻中度肾功能损害患者无需进行剂量调整。

安全性优势：

- 在常见不良反应上，本品**皮疹**发生率为目录内同类药品中最低，仅**10.7%**。
- 与同类药品奥希替尼、阿美替尼、贝福替尼相比，本品**血液系统不良反应（白细胞计数降低）**发生率**最低**。
- 在其他重点关注的不良反应上，本品**间质性肺病**发生率为**0%**，为目录内同类药品中最低，**对于有肺部基础疾病的患者，基本不会产生严重而不可逆的肺功能损伤**，瑞厄替尼或为更好选择！

主要 不良反应类型	产品说明书中的发生率				
	瑞厄替尼	奥希替尼	阿美替尼	伏美替尼	贝福替尼
间质性肺病	0%	2.9%	0.4%	0.4%	2.1%
皮疹	10.7%	41%	23.7%	14.8%	26.1%
血小板计数降低	10.7%	54%	13.5%	7.4%	61.0%
白细胞计数降低	14.2%	67%	16.5%	14.6%	23.0%
中性粒细胞数降低	4.7%	33%	12.6%	9.2%	-

03 有效性：中位无进展生存期与中位缓解持续时间更长

瑞厄替尼一线治疗具有表皮生长因子受体（EGFR）外显子19缺失或外显子21（L858R）置换突变的局部晚期或转移性非小细胞肺癌（NSCLC）成人患者：

- **中位无进展生存期（mPFS）为19.3个月、中位缓解持续时间（mDoR）为20.7个月，数值上优于同类药品奥希替尼。**

一线治疗：瑞厄替尼与奥希替尼疗效比较（非头对头数据）

疗效指标	瑞厄替尼	奥希替尼
mPFS（月）	19.3	18.9
mDoR（月）	20.7	17.2

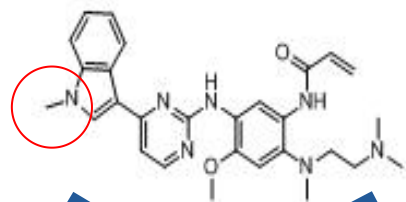
参考信息：

1. 瑞厄替尼、奥希替尼产品说明书

2. AURA3研究结果：N Engl J Med. 2017 Feb 16;376(7):629-640.

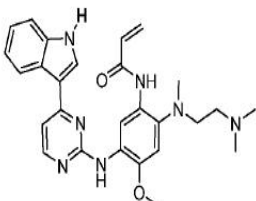
瑞厄替尼采用6,7,8,9-四氢吡咯[1,2-a]吡啶结构，结构较稳定，具有独特代谢途径，可减轻常见的EGFR-TKI不良反应，降低不良反应发生率

奥希替尼

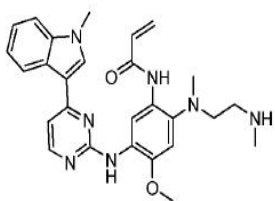


CYP3A4/5

活性成分
选择性差
(对野生型
有效)

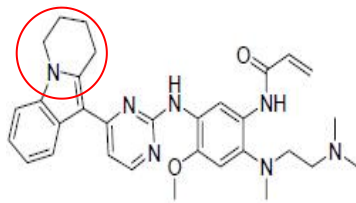


AZ5104

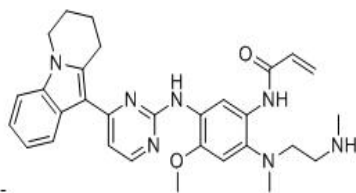


AZ7550

瑞厄替尼



CYP3A4/5



Imp3

- 据奥希替尼代谢途径的研究结果表明，其甲基吡啶结构中的甲基在人体内代谢时易脱去，产生的独有活性**代谢产物**（AZ5104）对野生型的EGFR突变也有较强的抑制作用，**但与奥希替尼不良反应的发生有关¹**。
- 相较于奥希替尼，瑞厄替尼在吡啶环上进行了结构修饰，由原先的甲基吡啶结构改造成6,7,8,9-四氢吡啶[1,2-a]吡啶结构；**新结构更稳定**，具有独特的代谢途径，**可减轻常见的EGFR-TKI不良反应，并降低不良反应的发生率，解决了现有药物不良反应控制的技术难题。**

创新性：瑞厄替尼是由南京圣和药业股份有限公司独立研制开发，具有自主知识产权的1.1类创新药，拥有中国、美国、欧洲、日本、加拿大、韩国等国家和地区的13项专利。

EDITORIAL



And Still They Come Over Troubled Waters: Can Asia's Third-Generation EGFR Tyrosine Kinase Inhibitors (Furmonertinib, Aumolertinib, Rezivertinib, Limertinib, Befotertinib, SH-1028, and Lazertinib) Affect Global Treatment of *EGFR*+ NSCLC



Sally C. M. Lau, MD, MPH,^a Sai-Hong Ignatius Ou, MD, PhD^{b,*}



Sai-Hong Ignatius Ou

Chao Family Comprehensive Cancer Center, University of California Irvine School of Medicine · Medicine-Hematology/Oncology
MD PhD

Concluding Remarks

In summary, of the four 3G EGFR TKIs that formed the basis of this editorial, SH-1028 and rezivertinib seem to have both good clinical efficacy and safety and once-daily dosing convenience. The dosing regimens of limertinib and befotertinib will likely need to be optimized in non-Chinese/non-Asian patients if they are going to be developed outside the People's Republic of China given the high incidence of diarrhea (limertinib) and headache and thrombocytopenia (befotertinib). Furthermore, twice-daily dosing (limertinib) or step-up dosing (befotertinib) will limit their adaptability globally in face of first-mover effects of aumolertinib furmonertinib and lazertinib.

- 美国加利福尼亚大学Sai-Hong Ignatius Ou教授在国际权威期刊《胸部肿瘤学杂志 (Journal of Thoracic Oncology) 》上发表了一篇社论，对亚洲已上市或在研的第三代EGFR-TKI的疗效与安全性进行了对比总结。
- Ou教授在文中评价：**SH-1028（瑞厄替尼）兼具了临床有效性、安全性和每天一次口服的给药便捷性。**

瑞厄替尼获CSCO《非小细胞肺癌诊疗指南2025》I级推荐：

新增瑞厄替尼作为EGFR敏感突变一线治疗I级推荐；

新增瑞厄替尼作为EGFR敏感突变耐药后T790M阳性二线治疗I级推荐。

瑞厄替尼纳入2025
版中华医学会肺癌
临床诊疗指南推荐

EGFR 突变非小细胞肺癌的治疗（一）

分期	分层	I 级推荐	II 级推荐	III 级推荐
IV 期 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗 ^{a,b,c}	三代 奥希替尼 阿美替尼 伏美替尼 贝福替尼 瑞厄替尼 瑞齐替尼 二代 阿法替尼 达可替尼 一代 吉非替尼 厄洛替尼 埃克替尼 联合 佐利替尼（伴脑转移患者） 联合 奥希替尼+化疗	吉非替尼或厄洛替尼+化疗（PS=0-1）（2A类） 厄洛替尼+贝伐珠单抗（2A类） 含铂双药化疗+贝伐珠单抗（非鳞癌） ^d （2A类）	• 瑞万至单抗联合 Lactuzumab	
IV 期 EGFR T790M 阳性 复发 NSCLC 一线治疗	瑞万至单抗+化疗		• 参考 IV 期无驱动基因 NSCLC 的一线治疗	

【注释】
a. 本部分主要针对多线转移患者，需转移至全身系统其他相应治疗。
b. 确诊 EGFR 突变前由多学科团队综合评估了治疗选择，在确诊 EGFR 突变后，除参考本指南外，还可参考最新指南或最新指南未提及但参考本指南一线治疗。
c. 部分患者确诊晚期 NSCLC 后应进行各种检测以明确驱动基因类型，一线治疗选择应基于最新指南明确诊断为 EGFR 突变，治疗参考本指南一线治疗。
d. 部分患者确诊晚期 NSCLC 后应进行各种检测以明确驱动基因类型，一线治疗选择应基于最新指南明确诊断为 EGFR 突变，治疗参考本指南一线治疗。
e. 瑞厄替尼联合奥希替尼治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。
f. 厄洛替尼联合贝伐珠单抗治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。
g. 瑞厄替尼联合奥希替尼治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。
h. 瑞厄替尼联合奥希替尼治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。
i. 瑞厄替尼联合奥希替尼治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。



EGFR 突变非小细胞肺癌的治疗（二）

分期	分层	I 级推荐	II 级推荐	III 级推荐
IV 期 EGFR 敏感突变 NSCLC 耐药后治疗 ^a	进展或 CNS 进展 广泛进展	继续原 EGFR-TKI 治疗+局部治疗（2A类） 广泛进展 一/二代 TKI 一线治疗失败再次治疗 T790M 阳性患者 奥希替尼 阿美替尼 伏美替尼 贝福替尼 瑞厄替尼 瑞齐替尼 二代 TKI 治疗失败含铂双药化疗+贝伐珠单抗（非鳞癌） • 瑞万至单抗联合化疗 • 依沃西单抗联合化疗 • 培美曲塞+瑞厄替尼+贝伐珠单抗 • 依沃西单抗联合化疗 • 培美曲塞+瑞厄替尼+贝伐珠单抗	再次评估其他驱动基因 再次评估 T790M 阴性患者 • 含铂双药化疗+贝伐珠单抗（非鳞癌）（2A类） • 瑞万至单抗联合化疗 再次评估其他驱动基因 再次评估 T790M 阴性患者 • 含铂双药化疗+贝伐珠单抗（非鳞癌）（2A类） 再次评估其他驱动基因 再次评估 T790M 阴性患者 • 含铂双药化疗+贝伐珠单抗（非鳞癌）（2A类） 再次评估其他驱动基因 再次评估 T790M 阴性患者 • 含铂双药化疗+贝伐珠单抗（非鳞癌）（2A类）	
IV 期 EGFR 敏感突变 NSCLC 耐药后治疗 ^a	PS=0-2	单药化疗	单药化疗+贝伐珠单抗（非鳞癌）（2A类） 安罗替尼（2A类）	
IV 期 EGFR T790M 阳性 复发 NSCLC 一线治疗		舒沃替尼	参考 IV 期无驱动基因 NSCLC 的一线治疗	瑞万至单抗（3类）

【注释】
a. 本部分主要针对多线转移患者，需转移至全身系统其他相应治疗。
b. 确诊 EGFR 突变前由多学科团队综合评估了治疗选择，在确诊 EGFR 突变后，除参考本指南外，还可参考最新指南或最新指南未提及但参考本指南一线治疗。
c. 部分患者确诊晚期 NSCLC 后应进行各种检测以明确驱动基因类型，一线治疗选择应基于最新指南明确诊断为 EGFR 突变，治疗参考本指南一线治疗。
d. 部分患者确诊晚期 NSCLC 后应进行各种检测以明确驱动基因类型，一线治疗选择应基于最新指南明确诊断为 EGFR 突变，治疗参考本指南一线治疗。
e. 瑞厄替尼联合奥希替尼治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。
f. 厄洛替尼联合贝伐珠单抗治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。
g. 瑞厄替尼联合奥希替尼治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。
h. 瑞厄替尼联合奥希替尼治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。
i. 瑞厄替尼联合奥希替尼治疗 EGFR 敏感突变 NSCLC 一线治疗。



01.所治疗疾病对公共健康的影响

- 肺癌是全球对人类健康和生命威胁最大的恶性肿瘤之一，在中国发病率与死亡率位居癌症首位。
- 瑞厄替尼可显著改善19Del或L858R突变阳性患者的治疗，中位无进展生存期为19.3个月、中位缓解持续时间为20.7个月。
- 纳入国家医保目录能提高药物可及性，降低患者疾病负担。

02.符合“保基本”的原则

- 本品临床价值高，可有效满足参保人员的治疗需求，在同类产品中具备良好的成本效果优势，可有效保障医保基金的安全。
- 瑞厄替尼服用便利，可显著改善19Del或L858R突变人群的疾病预后，患者可获得更为持久的药效；治疗相关不良反应发生率低，可有效降低患者因治疗相关不良反应处理而产生的住院、检查等医疗花费。

03.弥补“目录”的短板

- 瑞厄替尼兼顾疗效，安全性及给药便捷性，可有效弥补目录短板。
- 瑞厄替尼是所有第三代EGFR-TKI一线治疗突变19Del或L858R阳性患者中安全性更好的产品，其中间质性肺病发生率为0%，皮疹发生率仅10.7%，血液系统不良反应发生率与同类相比较低，可基于此安全性替代目录内的同类产品，为不同患者提供差异化的治疗选择。

04.医保管理难度

- 本品适应症明确，诊断流程和确诊标准清晰，诊断基于基因检测结果，且必须凭医生开具处方，便于管理人群界定清晰、路径明确、精准靶向治疗，无滥用风险，不造成临床管理难度等问题。医保经办机构无需进行特殊管理。