

# 氕恩扎鲁胺软胶囊（海纳安®）

国内**唯一**获批接受醋酸**阿比特龙**及化疗后出现**疾病进展**  
mCRPC适应症的口服新型雄激素受体拮抗剂

海创药业股份有限公司

氕赴前腺  
海纳百安

——唯一中国自主研发新一代新型AR拮抗剂



1

基本信息

国内**唯一**获批阿比特龙和化疗经治mCRPC**新型雄激素受体拮抗剂**

2

有效性

INV及IRC评估结果**均显示rPFS显著获益**，影像学进展或者死亡**风险降低42%**

3

安全性

III期临床研究TEAE与对照组相似，**未见**癫痫或者皮疹等发生

4

创新性

本土源头创新，**创新氙代技术**，**减少**给药剂量 **提高**安全性

5

公平性

氙恩扎鲁胺**填补**医保目录内阿比特龙及化疗后mCRPC患者的治疗空白

# 基本信息——国内唯一获批阿比特龙及化疗经治mCRPC适应症



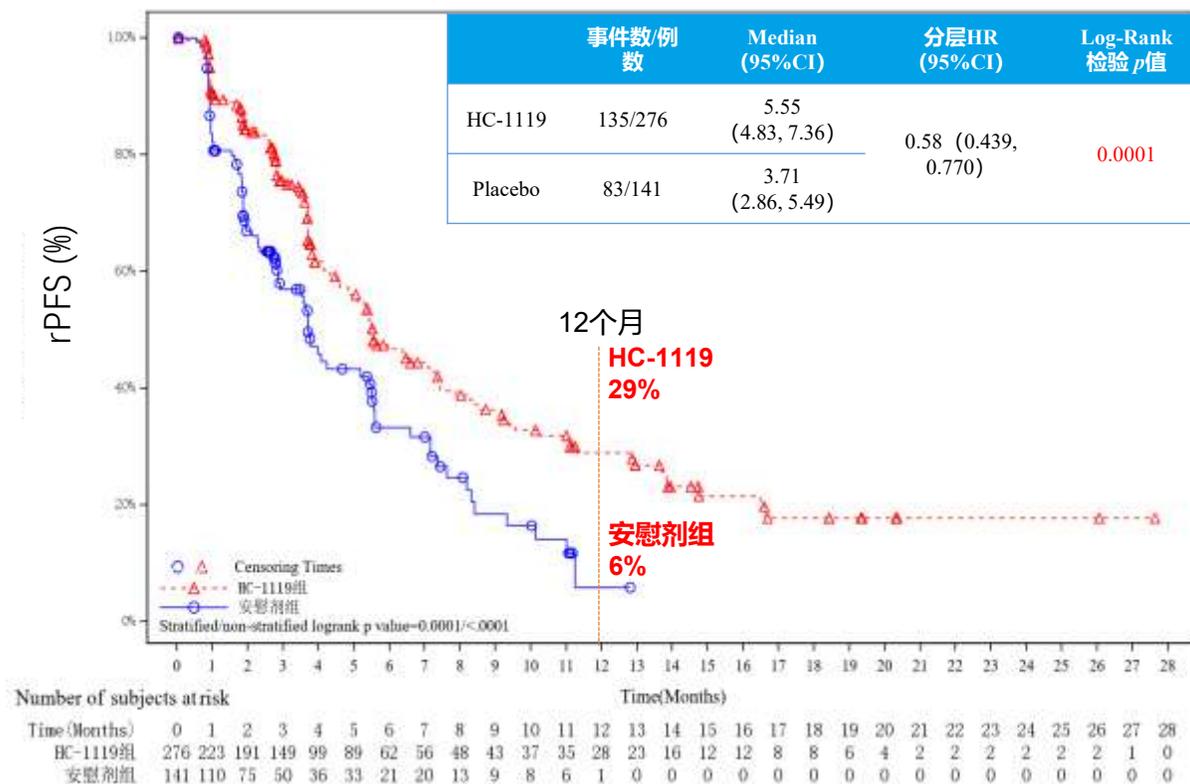
通用名	氩恩扎鲁胺软胶囊		
注册分类	化学药品1类		
注册规格	40mg		
适应症	本品适用于接受醋酸阿比特龙及化疗后出现疾病进展，且既往未接受新型雄激素受体抑制剂的转移性去势抵抗性前列腺癌（mCRPC）成人患者。		
用法用量	氩恩扎鲁胺的推荐剂量为80mg（2粒40mg/粒软胶囊），每日一次，口服。		
疾病情况	前列腺癌是男性泌尿生殖系统中最常见的恶性肿瘤，2022中国癌症报告数据显示2022年我国前列腺癌新发病例约13.4万，死亡例数约4.75万。我国高达54%的患者在初诊时已发生转移，预后较差，特别是进展至转移性去势抵抗性前列腺癌（mCRPC）阶段后仍存在大量未被满足的治疗需求。		
中国大陆首次上市时间	2025年5月	目前大陆地区同通用名药品的上市情况	无
全球首次上市国家/地区及上市时间	中国，2025年5月	是否为OTC药品	否



# 有效性(1/3)——INV及IRC评估结果均显示rPFS显著获益

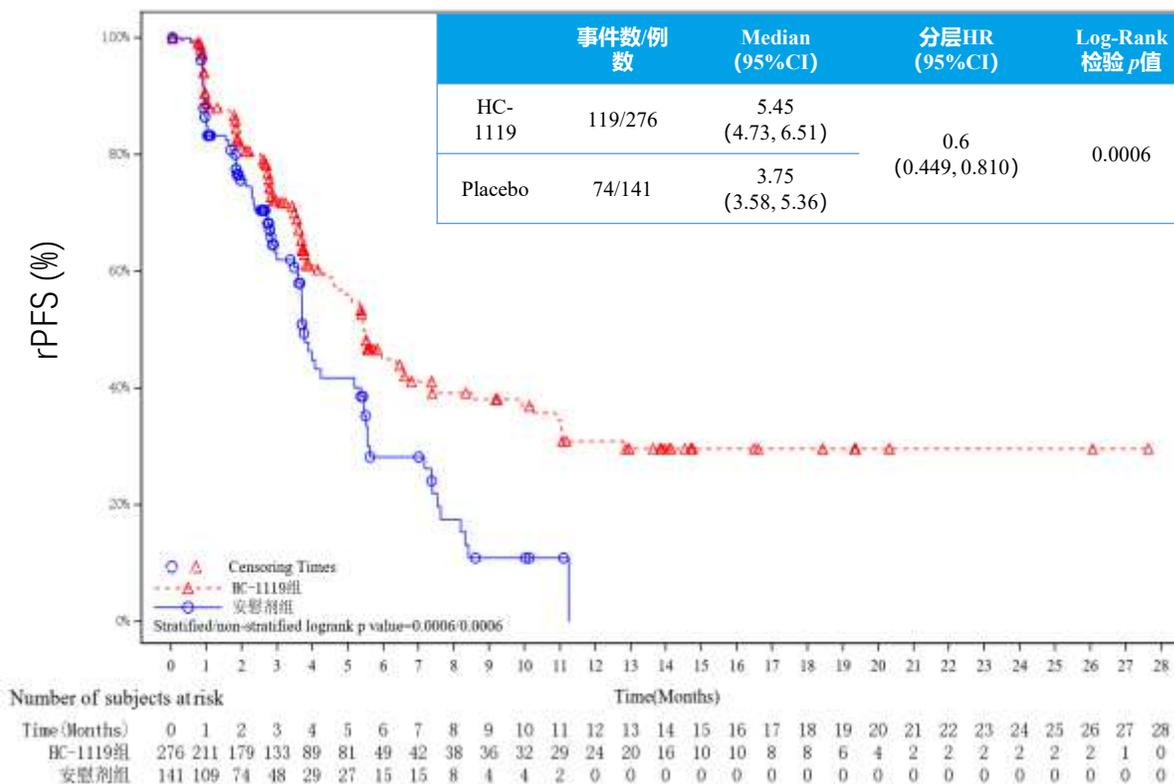
## III期随机双盲安慰剂平行多中心对照临床试验-rPFS显著获益

### INV评估的rPFS



➤ 与安慰剂组相比，昂恩扎鲁胺组显著延长rPFS至**5.5个月**，降低影像学进展或死亡风险**42%**，达到主要疗效终点。两组12个月的rPFS率分别为**29%**和**6%**

### IRC评估的rPFS

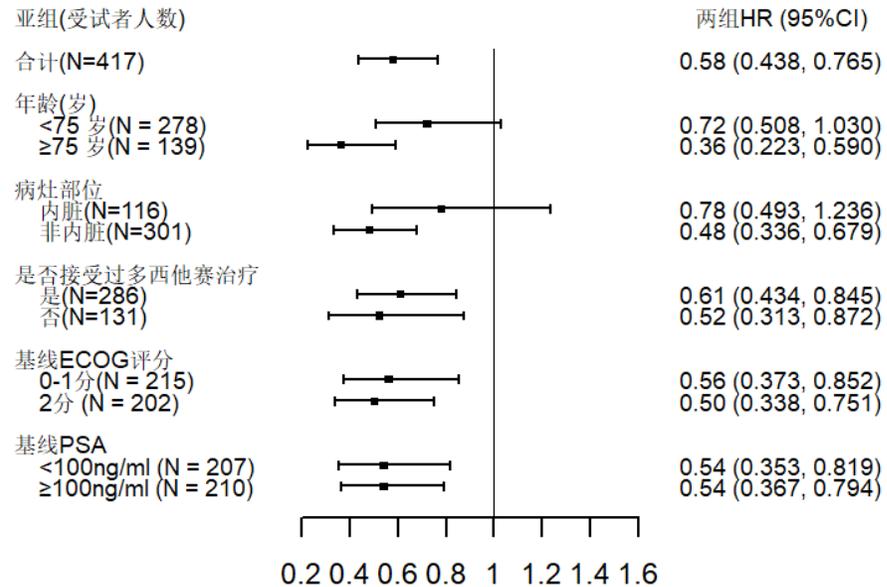


➤ 与安慰剂组相比，昂恩扎鲁胺组显著延长rPFS至**5.45个月**，降低影像学进展或死亡风险**40%**

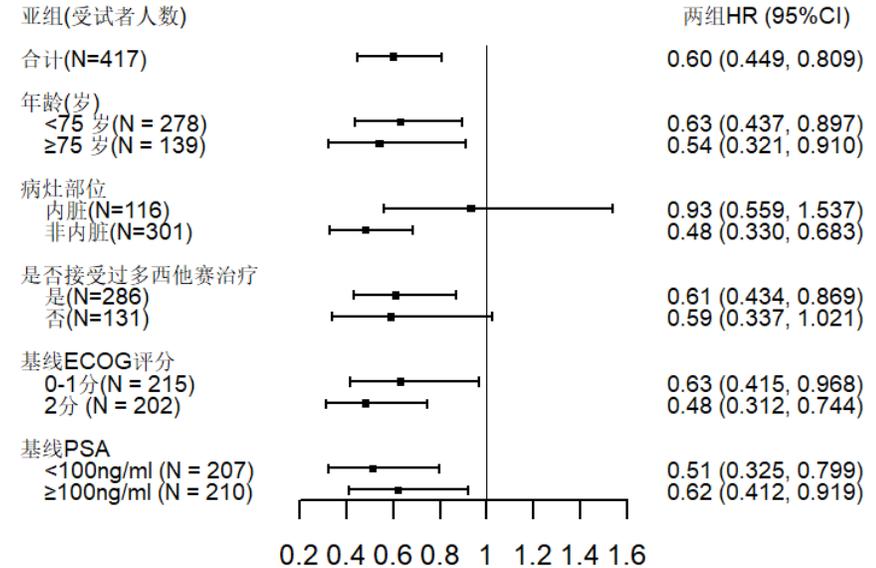
# 有效性(2/3)——预先设定亚组分析 (ITT)

## 各亚组均显示与总体人群一致的rPFS获益

### 研究者评估



### IRC评估



氘恩扎鲁胺获得：**I级**推荐既往新型内分泌和多西他赛化疗失败的mCRPC患者

氘恩扎鲁胺获得：**II级**推荐既往未经新型内分泌治疗和化疗的mCRPC患者

氘恩扎鲁胺获得：**II级**推荐既往既往新型内分泌失败且未经化疗的mCRPC患者

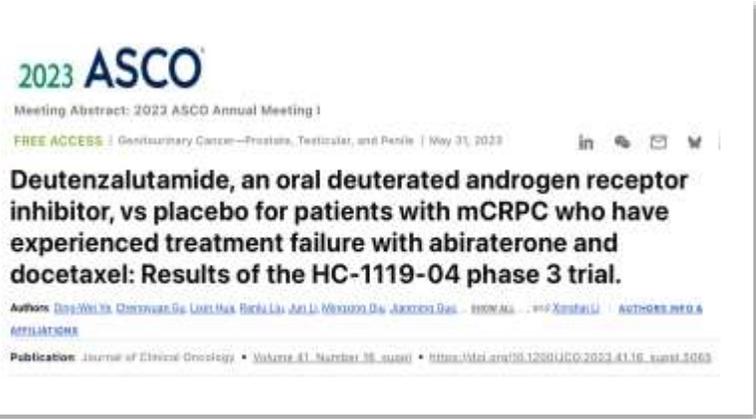


## 转移性去势抵抗性前列腺癌的治疗选择

8.2 转移性去势抵抗性前列腺癌的诊疗

分级治疗阶段	I 级推荐	II 级推荐	III 级推荐
既往未经新型内分泌治疗和化疗	阿比特龙/泼尼松 <sup>a</sup> (1A类) 恩扎卢胺 <sup>a</sup> (1A类) 多西他赛 <sup>a</sup> (1A类) 镭-223 <sup>a</sup> (骨转移患者) (1A类) 奥拉帕利+阿比特龙 <sup>a</sup> (HRR突变) (1A类) 他拉唑帕利+恩扎卢胺 <sup>a</sup> (HRR突变) (1A类) 厄拉帕利+阿比特龙 <sup>a</sup> (BRCA突变) (1A类) 镭-223+恩扎卢胺 (骨转移) (1A类)	他拉唑帕利+恩扎卢胺 (2A类) Sipuleucel-T (1B类) 瑞维鲁胺 <sup>a</sup> (2B类) <b>氘代恩扎卢胺<sup>a</sup> (2B类)</b>	阿帕他胺 <sup>a</sup> (3类) 达罗他胺 <sup>a</sup> (3类) 霏转移灶SBRT+阿比特龙I (2B3类) 奥拉帕利+阿比特龙 (3类) 他拉唑帕利+恩扎卢胺 (3类)
既往新型内分泌治疗失败且未经化疗	多西他赛 (1A类) 奥拉帕利 <sup>a</sup> (HRR突变) (1A类) 镭-223 (骨转移患者) (1A类)	177Lu-PSMA-617Y (1A类) 恩扎卢胺/阿比特龙/泼尼松 (2A类) 卡巴他赛 <sup>a</sup> (1B类) Sipuleucel-T (1B类) <b>氘代恩扎卢胺 (2B类)</b> 恩扎卢胺+多西他赛 <sup>a</sup> (2B类)	阿比特龙/地塞米松 <sup>a</sup> (3类)
既往多西他赛化疗失败且未经新型内分泌治疗	阿比特龙 (1A类) 恩扎卢胺 (1A类) 奥拉帕利 (HRR突变) (1B类) 镭-223 (骨转移患者) (1A类)	卡巴他赛 (4B2A类) 瑞维鲁胺 (2B类)	他拉唑帕利 (HRR突变) <sup>z</sup> (2B类)
既往新型内分泌治疗和多西他赛化疗失败	奥拉帕利 (HRR突变) (1B类) 177Lu-PSMA-617+SOC <sup>a</sup> (1A类) <b>氘代恩扎卢胺 (1A类)</b>	<sup>177</sup> Lu-PSMA-617+SOC <sup>a</sup> (1A类) 镭-223 (骨转移患者) (1B类) 卡巴他赛 <sup>a</sup> (1B类) 多西他赛再会试 <sup>a</sup> (2A类)	他拉唑帕利 (HRR突变) <sup>z</sup> (2B类) 帕博利珠单抗 <sup>a</sup> (3类) 镭-223+恩扎卢胺 <sup>a</sup> (3类) 米托蒽醌 <sup>a</sup> 含铂类化疗药物 <sup>a</sup> 依托泊苷 <sup>a</sup>

去势抵抗性前列腺癌的诊疗



# 安全性(1/3)——相关不良事件 (TEAE) 与对照组无显著差异

- 氬恩扎魯胺組治療相關不良事件 (TEAE) 與安慰劑組**无显著差异**，試驗期間**无药物相关**的死亡發生，整體安全耐受性好
- 氬恩扎魯胺組分別22.6%和7.3%報告≥3級不良反應和嚴重不良反應
- 導致藥物調整的TEAE在氬恩扎魯胺組相對略低

	HC-1119+ADT組 (N = 276)	Plac+ADT組 (N = 141)
所有治療期不良事件 (TEAE)	265 (96.7)	130 (92.9)
CTCAE 3級及3級以上	137 (50.0)	59 (42.1)
與研究藥物相關的TEAE	201 (73.4)	100 (71.4)
CTCAE 3級及3級以上	57 (20.8)	21 (15.0)
嚴重不良事件 (SAE)	94 (34.3)	36 (25.7)
與研究藥物相關的SAE	20 (7.3)	6 (4.3)
導致研究中止的TEAE	17 (6.2)	8 (5.7)
導致研究藥物減少的TEAE	6 (2.2)	4 (2.9)
導致研究藥物暫停用藥的TEAE	27 (9.9)	14 (10.0)
導致研究藥物永久停藥的TEAE	21 (7.7)	11 (7.9)
導致死亡的TEAE	6 (2.2)	5 (3.6)

- Data Cut Date: 2021-12-23
- Data on file

# 安全性(2/3)——氩恩扎鲁胺显示出更优的安全性

- 氩恩扎鲁胺安全性良好且可控，III期临床试验未见癫痫、脊髓压迫马尾综合征、跌倒、骨折、皮疹、缺血性心脏病、肝脏毒性

药物	氩恩扎鲁胺 <sup>1</sup>	瑞维鲁胺 <sup>2</sup>	恩扎卢胺 <sup>2</sup>	阿帕他胺 <sup>2</sup>	达罗他胺 <sup>2</sup>
TEAE导致的治疗终止	6.2% (食欲减退、乏力)	1.5% (ALT/AST升高)	4.9%~16% (乏力、癫痫、AST/ALT升高)	8%~11% (皮疹)	9% (心力衰竭、死亡)
TEAE导致的剂量降低/中断	12% (食欲减退、乏力)	13.6% (ALT/AST升高)	4.4% (乏力)	23%~33% (皮疹、腹泻、乏力、高血压等)	13%~19% (乏力、高血压、恶心、腹泻、肺炎)

## 常见的TEAE、中枢神经系统相关TEAE、特别注意的TEAE

不良事件	氩恩扎鲁胺 <sup>1</sup>		瑞维鲁胺 <sup>2</sup>		恩扎卢胺 <sup>2</sup>		阿帕他胺 <sup>2</sup>		达罗他胺 <sup>2</sup>	
	所有级别	≥3级	所有级别	≥3级	所有级别	≥3级	所有级别	≥3级	所有级别	≥3级
肝脏毒性	/	/	30.7%	4.3%	/	/	/	/	/	/
ALT/AST升高	5.5%	0.7%	22.9%	2.2%	/	/	/	/	23%~40%	0.5%~3.7%
食欲减退	20.1%	2.2%	/	/	4.9~19%	0.2~0.3%	12%	0.1%	19%	1.8%
高血压	/	2.6%	28.8%	10.2%	12%	5%	18-25%	8-14%	14%	7%
缺血性心脏病/心脏衰竭	/	/	/	/	/	/	/	/	2.9~4%/ 2.1%	/
皮疹	/	/	11.1%	0.3%	3.8%	0	26%	6%	3%~19%	0.1%~1.8%
癫痫	0	0	0	0	0.5%	/	0.4%	/	0	0
脊髓压迫和马尾综合征	/	/	/	/	7.4%	6.6%	/	/	/	/
跌倒	/	/	/	/	11%	/	16%	1.7%	/	/
骨折	/	/	/	/	10%	/	12%	2.7%	8%	/
乏力	22.3%	3.6%	16.1%	0	24%~51%	1.6%~9%	26%~39%	1.4%~3%	16%	0.6%

<sup>1</sup>氩恩扎鲁胺的数据来自HC-1119-04研究（经阿比特龙治疗失败和多西他赛治疗失败的mCRPC患者）。<sup>2</sup>恩扎卢胺、瑞维鲁胺、阿帕他胺、达罗他胺的数据来自NMPA批准的说明书，数据来自治疗更早期前列腺癌患者的关键研究。

# 安全性(3/3)——氩恩扎鲁胺药物相互作用极少，老年合并用药安全性好

用于疾病或治疗	药物类别	相互作用类型	示例	药物相互作用				
				氩恩扎鲁胺	阿帕他胺	恩扎卢胺	达罗他胺	瑞维鲁胺
房颤 卒中 深静脉栓塞	抗血栓药物	CYP2C9底物	华法林	⚠️ (弱)	⚠️	⚠️		⚠️
		CYP2C8,CYP2B6和 OATP1B1抑制剂	氯吡格雷		⚠️	⚠️		
		P-gp底物	达比加群		⚠️	⚠️		
		CYP3A4底物	利伐沙班		⚠️	⚠️		
高血压冠心病 心律失常	钙通道阻滞剂	CYP3A4底物	尼索地平, 非洛地平		⚠️	⚠️		
		CYP3A4和P-gp抑制剂	维拉帕米		⚠️		⚠️	
		CYP3A4抑制剂	地尔硫卓		⚠️		⚠️	
		CYP3A4底物	氨氯地平		⚠️	⚠️		
消化性溃疡胃食管返流病	质子泵抑制剂	CYP2C19底物, CYP2C19抑制剂	奥美拉唑	⚠️ (潜在)	⚠️	⚠️		⚠️
发热/疼痛等	解热镇痛药	CYP2C9底物	赛来昔布		⚠️	⚠️		
心力衰竭	强心苷	P-gp底物	地高辛		⚠️	⚠️		⚠️
失眠和癫痫	助眠药	CYP2C19底物	地西洋		⚠️	⚠️		⚠️
代谢	降糖	MATE1	二甲双胍		⚠️			⚠️
	降脂药	OATP1B3	他汀类		⚠️	⚠️	⚠️	⚠️
抗癌	化疗药物	OATP1B3	甲氨蝶呤				⚠️	⚠️
感染	抗菌药	BCRP	环丙沙星		⚠️		⚠️	⚠️

# 创新性——创新氙代技术 减少给药剂量 提升安全性，疗效确切



## 全球首个氙代AR拮抗剂

- ✓ 1类创新药
- ✓ 入选“十三五”国家“重大新药创制”科技重大专项



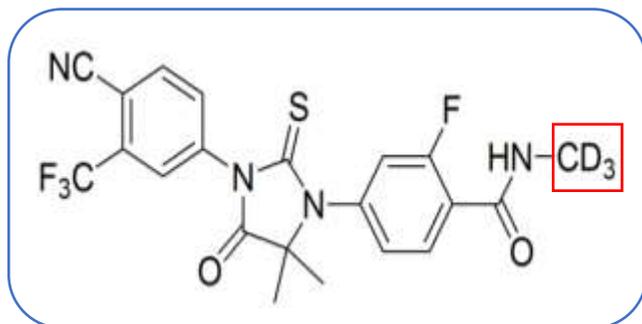
## 应用创新-填补后线治疗空白

- ✓ 适合人群：经阿比特龙及化疗治疗后进展的mCRPC患者
- ✓ 适合特殊人群：老年伴合并症患者，无需调整药物剂量，方便医生管理
- ✓ 提高患者依从性：氙恩扎鲁胺每日仅需口服一次，每次2粒，40mg/粒，而且在进餐后或空腹时均可服用，患者使用更方便。

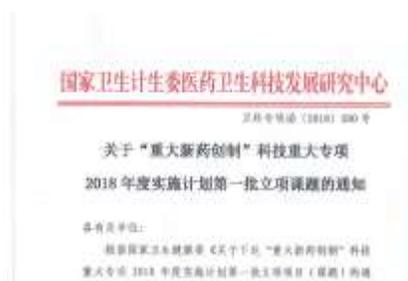


## 结构创新-提升安全性、疗效确切

- ✓ 创新性引入氙代技术
- ✓ 增强药物代谢稳定性
- ✓ 延缓降解速度
- ✓ 降低了血脑屏障通过率
- ✓ 降低了中枢神经系统相关不良反应
- ✓ 降低了药物相互作用的影响
- ✓ 疗效确切且安全性好



序号	专利名称	国别	发明人	专利号	项目号	专利所属领域	申请时间	授权时间	专利期限
1	咪唑二酮类化合物及其用途	中国	陈元伟	201280052853.9	HC1119	化合物/用途	2012/12/13	2015/7/8	2032/12/12
2	一种氙代咪唑酮化合物的晶型及其制备方法和用途	中国	陈元伟、樊磊、匡通滔、耿熙	201610609034.X	HC1119	晶型盐型/制备方法/用途	2016/7/28	2019/8/20	2036/7/27
3	一种HC-1119制剂及其制备方法和用途	中国	魏星、齐明、杜武、李兴海、陈元伟	201910394584.8	HC1119	制剂/制备方法/用途	2019/5/13	2021/7/2	2039/5/12





## 对公共健康的影响

- ✓ 国内前列腺癌患者高达54%发现即转移，特别到了mCRPC阶段新型内分泌及化疗进展后几乎无药可用，死亡率高，严重影响公共健康。
- ✓ 氙恩扎鲁胺软胶囊纳入医保能让更多患者可及，提升全民健康水平。



## 符合“保基本”原则

- ✓ 氙恩扎鲁胺软胶囊覆盖mCRPC后线治疗患者，满足这部分患者的高质量用药需求。
- ✓ 药品费用水平与基本医疗保险基金和参保人承受能力相适应，对医保基金支出影响小，符合保基本定位。



## 弥补目录短板

- ✓ 医保目录内尚无针对接受醋酸阿比特龙及化疗后出现疾病进展的mCRPC成人患者的新型雄激素受体拮抗剂。
- ✓ 氙恩扎鲁胺作为国内唯一获批接受醋酸阿比特龙及化疗后出现疾病进展的mCRPC成人患者的新型雄激素受体拮抗剂，纳入目录后填补治疗空白。



## 便于临床管理

- ✓ 本品适应症临床诊断路径清晰，肿瘤分期和治疗选择明确，医保经办审核方便。
- ✓ 本品有明确的使用条件、使用次数和剂量调整等要求，滥用等风险极低，临床管理难度小。