

醋酸阿比特龙片 (II) (艾瑞吉®)

全球唯一湿法研磨阿比特龙纳米晶片, 2.2类改良新

剂量降低70%增效低毒高依从, 消除食物效应服药更方便

企业: 江苏恒瑞医药股份有限公司

MAH: 成都盛迪医药有限公司

目录

CONTENTS



01 药品基本信息

全球唯一湿法研磨阿比特龙纳米晶片，2.2类改良型新药，国产工艺创新升级

02 创新性

国产独家专利纳米晶技术，提高生物利用度，消除食物效应

03 有效性

剂量降低70%增效低毒，PSA 50缓解率持续给药更优

04 安全性

血药控制水平全球最优，AE发生率更低，尤其降低血糖血脂风险

05 公平性

优效替代传统原研阿比特龙，高质量满足前列腺癌患者

全球首创湿法研磨阿比特龙纳米晶片，2.2类改良型新药，提高生物利用度，消除食物效应

| | |
|-------------------|--|
| 药品名称 | 醋酸阿比特龙片 (II) |
| 申报目录类别 | 基本医保目录、商保创新药目录 |
| 注册规格 ¹ | 150mg |
| 注册类别 | 化药2.2类 |
| 适应症 ¹ | 与泼尼松或泼尼松龙合用，治疗： <ul style="list-style-type: none"> 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 ¹ | <p>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。</p> <p>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。</p> <ul style="list-style-type: none"> 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。 |
| 目前大陆地区同通用名药品的上市情况 | 独家 |
| 全球首次上市国家及时间 | 中国，2023.12.26 |

参照药建议：醋酸阿比特龙片原研 (泽珂®)

- 本品**注册临床阳性对照为原研阿比特龙，唯一头对头证据**
- **同剂型、同活性成分**：均为醋酸阿比特龙
- **同适应症、临床指南推荐、应用广泛的目录内药品**

与参照药相比本品优势

- **全球首创湿法研磨纳米晶工艺，联合促吸收剂SNAC，实现增效、低毒、高依从多重临床价值提升：**
- **剂量降低70%，增效低毒²：**
对标传统原研阿比特龙，本品长期给药后PSA 50缓解更优
- **血药控制水平全球最优，血糖血脂发生少^{2,3}：**
可随餐服用，餐后血药变化控制在2倍以内，个体变异度低，血糖发生风险降低75%，血脂发生风险降低48%

说明：SNAC：8- (2-羟基苯甲酰胺基) 辛酸钠，一种高效促吸收剂。

1. 醋酸阿比特龙片 (II) 说明书; 2. Feng Z, et al. Drug Des Devel Ther. 2022 Jan 3;16:3-12; 3. Lu X, Dai T, et al. BMC Med. 2025 May 9;23(1):271.

传统醋酸阿比特龙低溶-低渗特性导致生物利用度极低，且存在高食物效应和变异性、血药浓度不稳定、依从性差等临床未满足需求

➤ 传统醋酸阿比特龙：BCS IV类化合物，低溶解性和低渗透性、高亲脂性，空腹口服生物利用度 < 10%¹

高食物效应和高变异性

- **食物影响极大**：高脂餐后传统阿比特龙 C_{max} 和 $AUC_{0-\infty}$ 相比空腹增至 **17和10倍**²
- **空腹服药**：患者须在餐前至少1小时和餐后至少2小时**空腹服药**²
- **个体变异高**： C_{max} 个体内变异高达 **~58.19%**，个体间变异高达 **~46.58%**^{1,3}

血药不稳定影响疗效和安全

- **血药浓度过高**：1) 阿比特龙750mg达到CYP17酶抑制平台期，过量的代谢产物5 α -Abi会导致**肿瘤进展和阿比特龙耐药**⁴；2) 醛固酮水平升高，糖代谢异常，导致**血糖、血脂升高**⁵
- **血药浓度过低**：1) CYP17酶抑制不充分**前列腺癌进展**，2) 泼尼松补充过量有**安全性风险**

患者无意识随餐服药比例高

- 研究显示：**33%**患者在进食条件下服药，且**无意识随餐服用**⁶；
- **不依从导致一系列问题**：阿比特龙暴露量升高，治疗持续时间**缩短2个月**、不良反应发生率**增加21%**、患者**生活质量降低**⁶

说明：BSC：生物药剂学分类系统，IV类为低溶解性-低渗透性药物； C_{max} ：最高血药浓度；AUC：血药浓度-时间曲线下面积；5 α -Abi：5 α -阿比特龙，可直接与AR结合并激活下游信号通路剂相关基因表达，促进前列腺癌组织生长，是阿比特龙药物抵抗的重要原因之一。

1. Schultz HB, et al. Int J Pharm. 2020 Mar 15;577:119069; 2. 醋酸阿比特龙药品说明书; 3. Feng Z, et al. Drug Des Devel Ther. 2022 Jan 3;16:3-12; 4. 杨涛, 等. 中国男科学杂志 35.1(2021):4; 5. 李晓玉, 等. 中国临床保健杂志 26.3(2023):419-424.; 6. Merdita S, et al. Br J Clin Pharmacol. 2024 Oct;90(10):2652-2662.

国产独家工艺创新：全球首创湿法研磨纳米晶技术，联合促吸收剂SNAC，片剂优化升级，实现本品增效、低毒、高依从临床价值提升

➤ 国产独家制备工艺专利--全球首创湿法研磨纳米晶技术

- **提高溶出速率和溶解度**：粒径减小致比表面积增加，实现溶解提升^{1,2}
- **减少食物影响**：纳米晶快速渗透到黏液层，延长药物滞留时间^{1,2}
- **提高生物利用度**：多途径细胞间、跨细胞吸收，可避免肝脏首过效应^{1,2}
- **高稳定性**：湿法介质研磨、高压均质工艺和组合稳定剂多重保障^{1,2}

➤ SNAC促吸收剂--协同提高生物利用度

- 增强活性化合物的疏水性、亲脂性，促进跨细胞吸收³
- 提高胃中片剂周围pH值，增强药物胃肠道吸收能力³

➤ 片剂优化升级--更适合吞咽困难的老年患者

- 每年服药减少730片
- 尺寸变小，增加刻痕，可掰片服用，方便调整剂量

| | 本品 | 醋酸阿比特龙片原研 |
|------------|--------------|-----------|
| 粒径 | ~500纳米 | 6毫米 |
| 生物利用度 | 提高3.3倍 | <10% |
| 用药剂量 | 300mg | 1000mg |
| 服药片数 | 每日2片 | 每日4片 |
| 食物效应 | 2倍，降低87% | 17倍 |
| 说明书服药条件 | 均可 | 严格空腹 |
| 血药个体变异 | 降低~10% | ≥33% |
| ≥3级TEAE发生率 | 8.8% | 22.9% |
| 依从性 | 好，每年服药减少730片 | 差 |

说明：SNAC：8-(2-羟基苯甲酰胺基)辛酸钠，一种高效促吸收剂。

1. 王健, 等. 纳米晶提高难溶性药物溶出及生物利用度的研究进展. 沈阳药科大学学报, 2016, 33(03):p253-258.

2. 田阳, 等. 纳米晶体药物制备技术的研究进展. 药学学报, 2021, 56(7):1902-1910.

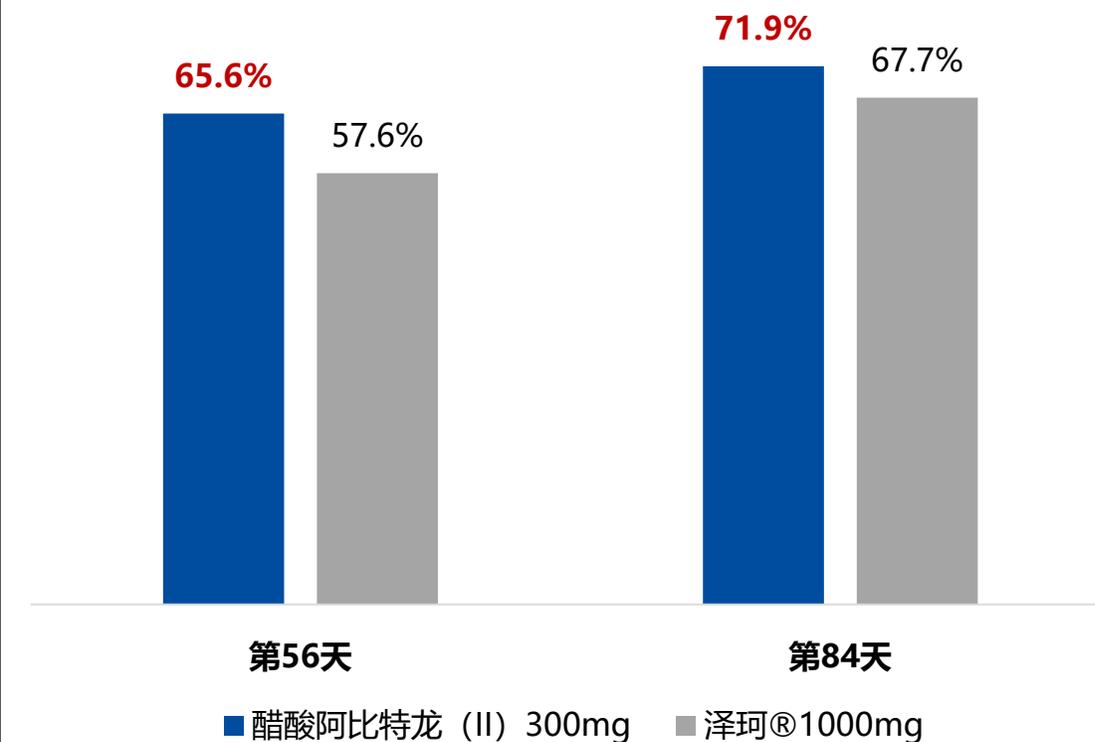
3. Feng Z, et al. Drug Des Devel Ther. 2022 Jan 3;16:3-12.

本品300mg对标传统阿比特龙原研1000mg，起效速度快，达峰时间短，长期给药PSA 50持续缓解效果更优，第56天后达标65%以上

剂量降低70%，增效低毒

| 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) | | |
| 几何均值比 (90%CI) | 1.053 (0.998, 1.110) | |
| Day28 | | |
| 几何均值比 (90%CI) | 1.015 (0.991, 1.041) | |
| Day56 | | |
| 几何均值比 (90%CI) | 1.020 (0.987, 1.054) | |
| Day84 | | |
| 几何均值比 (90%CI) | 1.042 (0.988, 1.100) | |

长期给药PSA50缓解率更优



国内外指南一致推荐阿比特龙为转移性前列腺癌一线治疗，本品醋酸阿比特龙片（II）国际认可，荣登国内两大权威指南 I 级推荐

- 醋酸阿比特龙片（II）临床研究相继发表于《Drug Design, Development and Therapy》、《BMC Medicine》等国际期刊，结果显示本品相比原研醋酸阿比特龙增效低毒，食物效应更小，安全性更优。



2024

《CSCO前列腺癌诊疗指南》

- 醋酸阿比特龙片（II）写入mCRPC既往未行新型内分泌治疗和化疗 I 级推荐注释部分

“醋酸阿比特龙片（II）是基于原研阿比特龙的2.2类改良型新药。在一项II期研究（ABTL-PD-01中 69例转移性去势抵抗前列腺癌患者随机入组至醋酸阿比特龙片（II）组和阿比特龙普通片组，结果发现：口服300 mg醋酸阿比特龙片与口服1000 mg阿比特龙普通片药效相当（Day 9/10血清睾酮浓度几何均值比90% CI 80.0%-125.0%）”



2024

《CACA 前列腺癌综合管理指南》

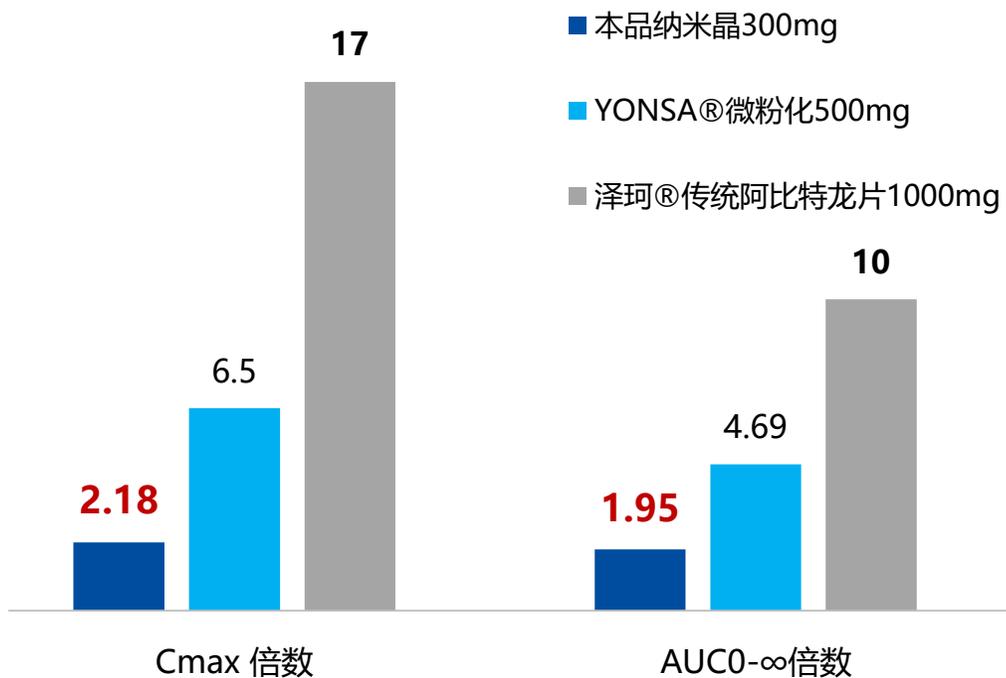
- 醋酸阿比特龙片（II）写入mCRPC一线治疗、既往多西他赛治疗失败但未行新型内分泌治疗 I 级推荐正文部分

“醋酸阿比特龙片（II）是基于原研阿比特龙采用纳米晶体技术合成的2.2类改良型新药。与 1000 毫克原研醋酸阿比特龙片相比，300 毫克醋酸阿比特龙片（II）在 C_{max} 、 AUC_{0-t} 和 $AUC_{0-\infty}$ 的生物等效性标准上符合要求，且醋酸阿比特龙片（II）的生物利用度更高。在 mHSPC 和 mCRPC 的 II 期临床试验中，醋酸阿比特龙片（II）与原研醋酸阿比特龙片相比通过了等效性验证。目前，mHSPC 和 mCRPC 适应症在中国已获批准”

本品餐后血药浓度变化**仅2倍**，血药个体变异度较传统阿比特龙原研**下降11%**，血药控制水平**全球最优**，安全稳定，说明书不限制空腹服药

食物效应控制水平全球最优

高脂餐后较空腹的血药浓度变化倍数



血药个体变异度下降11%，安全稳定

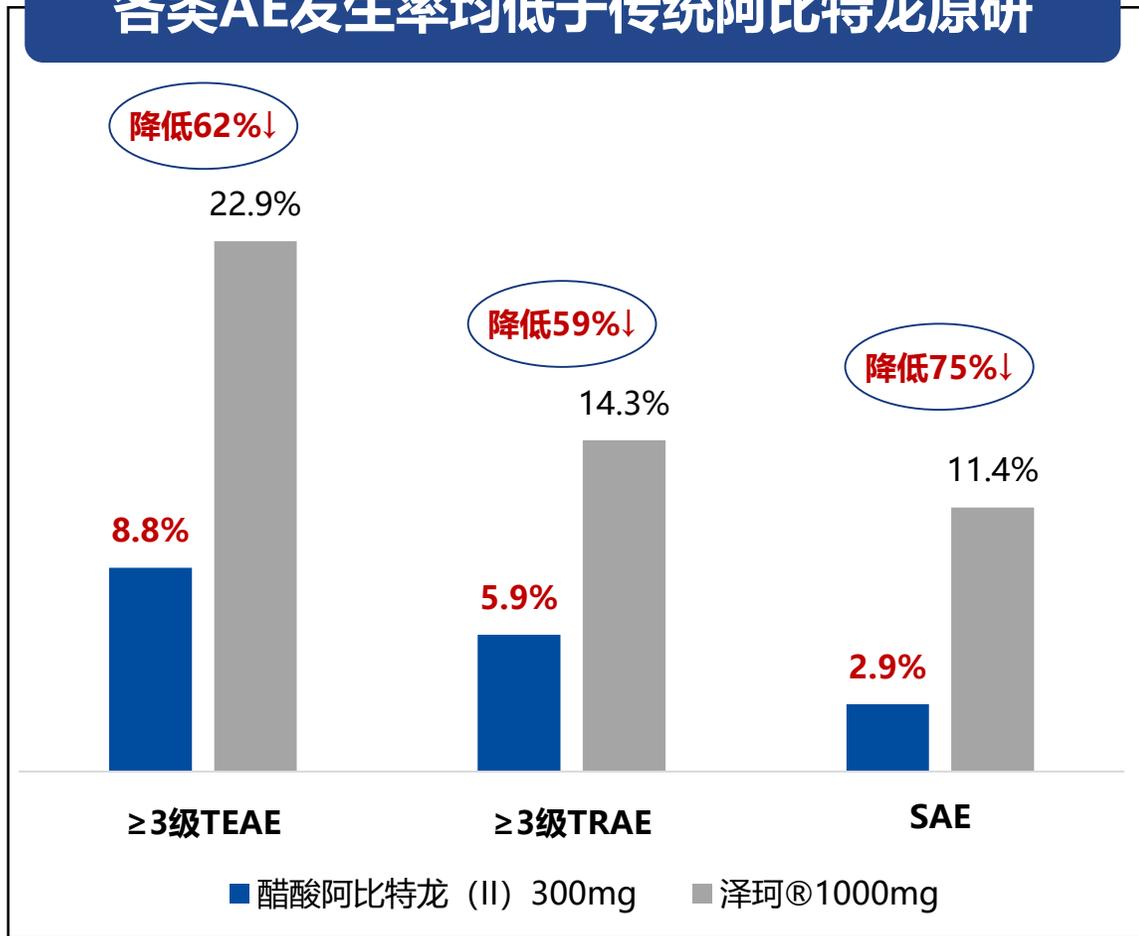
| | 醋酸阿比特龙片 (II) 300mg Intra CV% | 传统阿比特龙原研 1000mg Intra CV% |
|--------------------|------------------------------------|---------------------------------|
| C _{max} | 32.7% | 31.7% |
| AUC _{0-t} | 15.0% | 25.6% |
| AUC _{0-∞} | 15.0% | 26.3% |

说明：C_{max}：最高血药浓度；AUC：血药浓度-时间曲线下面积；

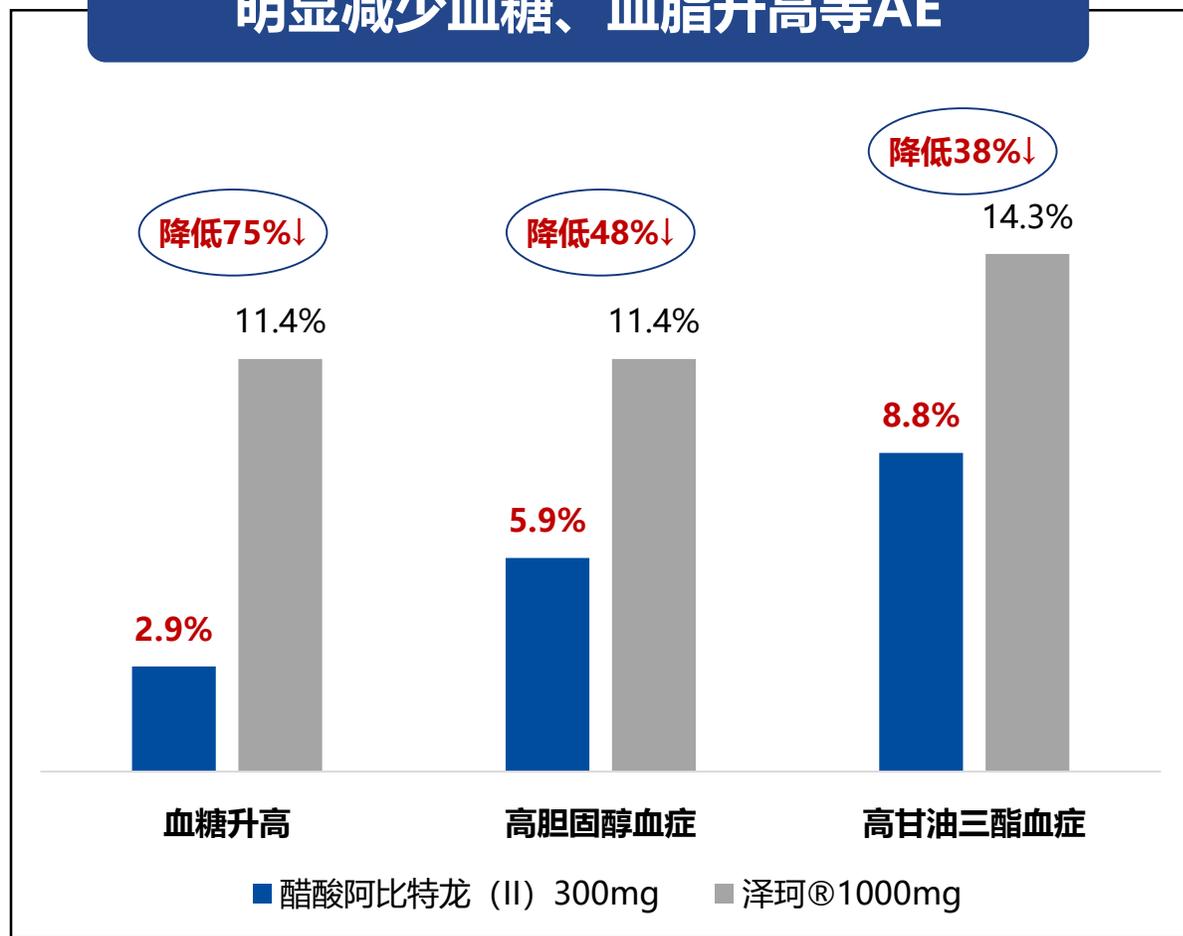
1. Feng Z, et al. Drug Des Devel Ther. 2022 Jan 3;16:3-12; 2. 醋酸阿比特龙说明书； 3. Danielak D, et al. Eur J Pharm Sci. 2022 Sep 1;176:106254.

本品整体安全性更优，不良事件严重程度和发生率更低，尤其血糖、血脂类AE发生风险分别下降75%和48%

各类AE发生率均低于传统阿比特龙原研



明显减少血糖、血脂升高等AE



1. Lu X, Dai T, et al. BMC Med. 2025 May 9;23(1):271.

弥补目录内阿比特龙疗效短板，国产**优效替代**，高质量满足老年前列腺癌患者需求，**简化用药**，每年减少730片，临床易管理

前列腺癌危害老年群体公共健康

- 老年前列腺癌患者多药合用，依从性差，伴随代谢性合并症。本品**减少服药剂量和片数，随餐方便服用，降低血糖血脂发生风险**，高质量提升中国前列腺癌患者健康水平。

弥补目录内阿比特龙短板

- 全球首创湿法研磨纳米晶工艺，中国独家阿比特龙纳米晶片，2.2类改良型新药，国产独家专利技术实现**增效、低毒、高依从多重临床价值提升**。

“保基本”，优效替代目录内同类药品

- 本品优效替代目录内同类产品，**延缓阿比特龙耐药、减少AE相关管理成本**，医保基金支出影响有限可控。

简化用药，降低临床管理难度

- 临床已使用醋酸阿比特龙多年，本品用法用量明确，用药片数**每年减少730片**，临床管理难度小。



全球首创湿法研磨纳米晶工艺，2.2类改良新药，中国独家阿比特龙纳米晶片

CSCO、CACA权威指南 I 级推荐，增效、低毒、高依从临床价值提升

剂量降低70%疗效优，血糖血脂发生风险更低，服药更方便

企业：江苏恒瑞医药股份有限公司

MAH：成都盛迪医药有限公司