

# 奥美沙坦酯口崩片

(商标名：坦络定<sup>®</sup>)

广州一品红制药有限公司

# 01：基本信息

## 奥美沙坦酯口崩片 首仿产品 强效稳压

通用名	奥美沙坦酯口崩片	中国获批时间	2024年6月
注册规格	20mg		
适应症	本品适用于高血压的治疗。		
用法用量	<p>剂量应个体化。在血容量正常的患者中，作为单一治疗的药物，通常推荐<b>起始剂量为20mg，每日一次</b>。对经2周治疗后仍需进一步降低血压的患者，剂量<b>可增至40mg</b>。</p> <p>剂量大于40mg未显示出更大的降压效果。当日剂量相同时，每日2次给药与每日1次给药相比没有显示出优越性。</p> <p>无论<b>进食与否</b>本品<b>都可以服用</b>。本品可以与其他利尿剂合用，也<b>可以与其他抗高血压药物联合使用</b>。</p> <p>对老年人、中度到明显的<b>肝肾功能损害</b>（肌酐清除率&lt;40mL/分钟）的患者服用本品，<b>无需调整剂量</b>（见【药代动力学】之特殊人群）。</p> <p>对可能的<b>血容量不足的患者</b>（如：接受利尿剂治疗的患者，尤其是那些肾功能损害的患者）必须在周密的医学监护下使用奥美沙坦酯，而且可以考虑使用<b>较低的起始剂量</b>。</p>	全球首次上市时间及国家/地区	2015年12月 日本
	目前大陆地区同通用名药品的上市情况	无	
	是否为OTC药品	否	

# 01: 基本信息

## 奥美沙坦酯口崩片 满足不同人群、不同情况的降压需求

奥美沙坦酯口崩片可满足不同人群不同情况下的降压需求，填补目录内口服降压药仅有口服常释剂型、缺乏口服液体剂的空白，有助于高血压控制率的提高。

### 填补未被满足的临床需求

- 我国18岁及以上高血压的患病人数达2.45亿，患病率为27.9%，控制率低于全球平均水平<sup>[1]</sup>。随着人口老龄化及生活水平提升，高血压患病率仍呈升高趋势，**高血压的控制率亟待提高与改善。**
- **老年高血压患者：**患病率在53.10% ~ 55.69%，
  - ✓ 老年期痴呆患病率为 5.6%，约1千多万。
  - ✓ 高血压和认知障碍在老年人中常伴发，显著降低老年人生活质量，并造成沉重的社会医疗负担。
- **长期卧床患者：**我国长期卧床失能、部分失能的老人约4065万人，行动不便患者无法改变体位，喝水容易发生呛咳，其中高血压患者的降压治疗亟待关注。
- **其他患者：**吞咽困难者、精神障碍患者、不易获得饮用水的户外工作者、沙漠地区及旅途、或突发饮水不便状况的高血压患者

### 参照药品

参照药品：原研奥美沙坦酯片（商品名：傲坦®）

参照药品选择理由：

- ① 有效成份一致，化学式和分子量均相同
- ② 适应症一致，均用于高血压的治疗
- ③ 奥美沙坦酯片已被纳入医保目录乙类
- ④ 两者均为口服制剂，作为BE参比制剂的**原研奥美沙坦酯口崩片未在中国上市**

备注：2020年1月20日国家药品监督管理局药品审评中心发布关于《化学仿制药参比制剂目录（第二十七批）》公示<sup>[3]</sup>，奥美沙坦酯口崩片指定参比制剂为第一三共株式会社未进口原研药品Olmetec®奥美沙坦酯口崩片。

1. 高血压患者高质量血压管理中国专家建议

2. 2016年全国老龄办公布数据。

3. 化学仿制药参比制剂目录（第二十七批）

## 02: 安全性

# 联合用药顾虑少，肝肾功能不全者不需要调整剂量

### 说明书载载的 安全性信息

#### 说明书中不良反应载清晰详实:

- 说明书详尽列出系统可能会发生不良反应，如：血液、精神神经系统、消化系统、循环系统、肝脏
- 一旦发现妊娠应尽快停止使用本品。直接作用于肾素-血管紧张素系统的药物，可导致发育中的胎儿损伤和死亡。

### 国内外不良反应 发生情况

- 奥美沙坦酯口崩片于2024年06月25日获得首次注册批件；暂未销售，尚未收集到上市后不良反应数据。查阅近5年内监管机构发布的警示信息，未发现本品或本品活性成份“奥美沙坦酯”相关的警示信息。
- 通过pubmed检索奥美沙坦酯文献相关安全性信息，文章报道奥美沙坦酯主要不良反应为头痛（3.3%）、鼻咽炎（2.3%）、眩晕（2.3%）、咳嗽（1.1%）、背痛（1.5%）。

### 奥美沙坦酯口崩片 安全性优势

#### 联合用药顾虑少

- 不经过P450酶代谢，不会引起干咳，血管神经性水肿发生率低，提升联合治疗的安全性。
- 肝肾双通道代谢，肝肾功能不全者不需要调整剂量。

#### 口腔内迅速崩解 快速起效

# 03: 有效性

## 奥美沙坦酯口崩片与原研口崩片相比**具有生物等效性**

### 生物等效性研究结果表明:

奥美沙坦酯口崩片 (规格:20mg, 受试制剂) 与第一三共株式会社生产的奥美沙坦酯口崩片 (规格:20mg, 商品名: Olmetec<sup>®</sup>, 参比制剂) 在健康人群中吸收程度和速度, 受试制剂与参比制剂具有生物等效性, 且安全性和耐受性良好。

- **方法:** 采用单中心、随机、开放、单剂量、两制剂、两周期、两序列交叉给药设计,
- **制剂:** 奥美沙坦酯口崩片 (规格: 20 mg, 受试制剂) 与奥美沙坦酯口崩片 (20 mg/片, 第一三共株式会社商品名: Olmetec<sup>®</sup>, 参比制剂)
- 在健康人群中吸收程度和速度的差异, 评价受试制剂与参比制剂是否具有生物等效性。并评价受试制剂和参比制剂在中国健康成年受试者中的安全性和耐受性。

空腹研究-生物等效性的置信区间结果

主要PK参数	最小二乘几何均值			个体间变异(%)	个体内变异(%)	90%置信区间	等效性判定结果	事后把握度(%)
	受试制剂T(N=26)	参比制剂R(N=26)	T/R比值(%)					
C <sub>max</sub> (ng/mL)	608.23	649.66	93.62	24.38	19.05	85.60%~102.40%	生物等效	89.82
AUC <sub>0-t</sub> (ng·h/mL)	4180.87	4332.31	96.50	23.37	10.68	91.75%~101.51%	生物等效	100.00
AUC <sub>0-∞</sub> (ng·h/mL)	4249.93	4408.57	96.40	23.27	10.73	91.63%~101.42%	生物等效	100.00

餐后研究-生物等效性的置信区间结果

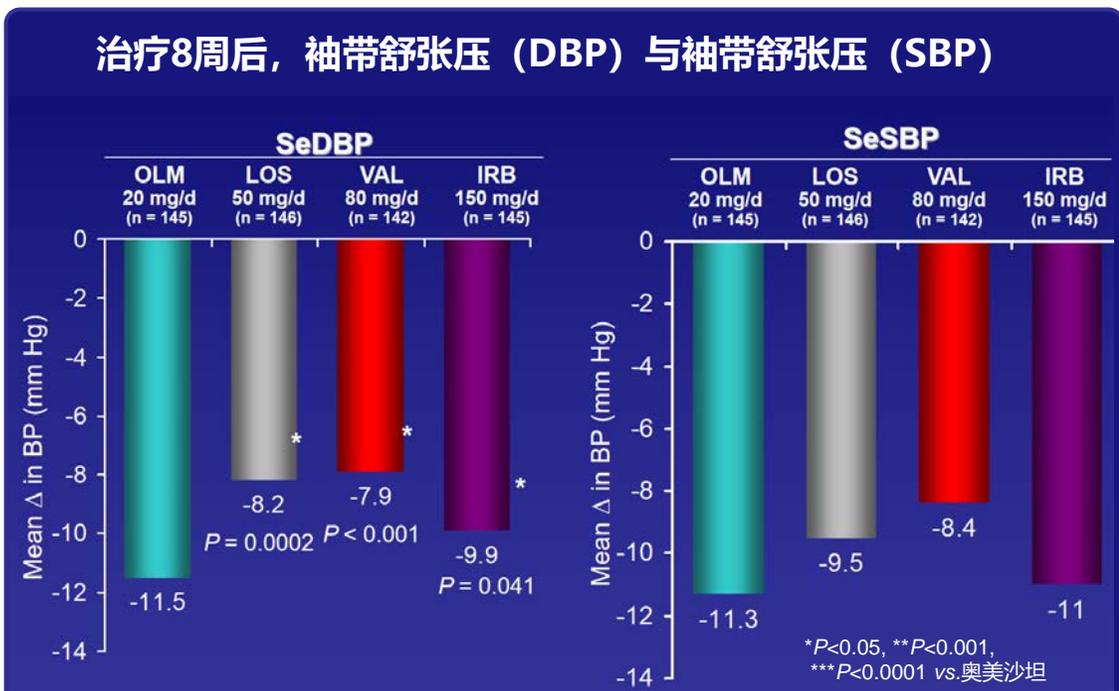
主要PK参数	最小二乘几何均值			个体间变异(%)	个体内变异(%)	90%置信区间	等效性判定结果	事后把握度(%)
	受试制剂T(N=26)	参比制剂R(N=26)	T/R比值(%)					
C <sub>max</sub> (ng/mL)	608.23	649.66	93.62	24.38	19.05	85.60%~102.40%	生物等效	89.82
AUC <sub>0-t</sub> (ng·h/mL)	4180.87	4332.31	96.50	23.37	10.68	91.75%~101.51%	生物等效	100.00
AUC <sub>0-∞</sub> (ng·h/mL)	4249.93	4408.57	96.40	23.27	10.73	91.63%~101.42%	生物等效	100.00

# 03: 有效性

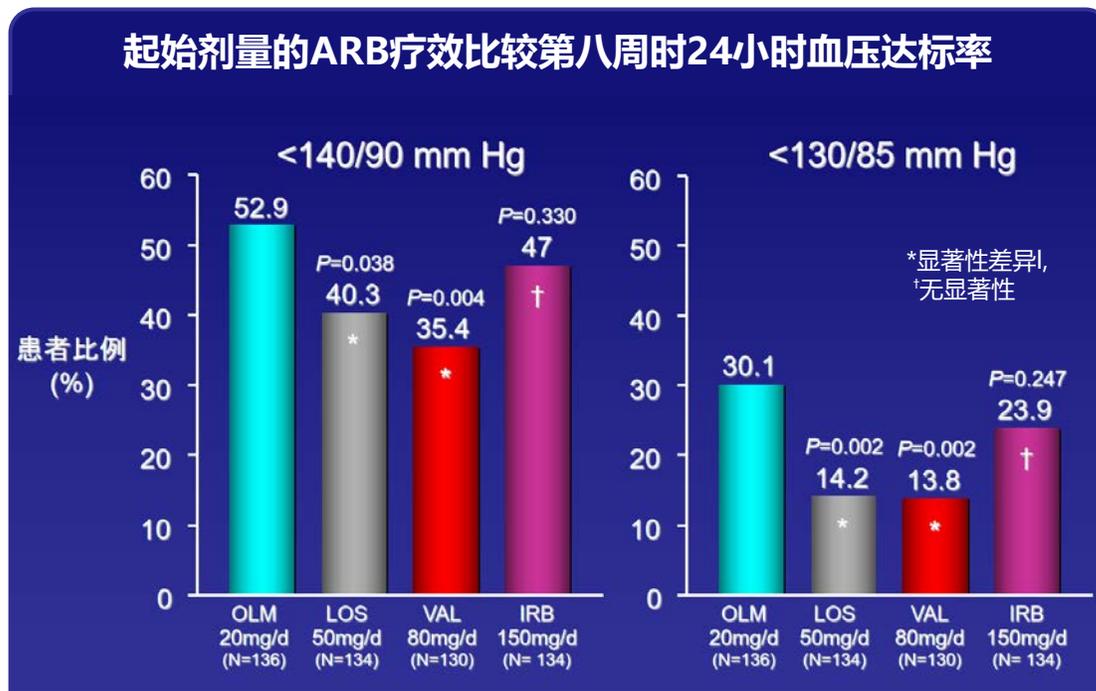
## 奥美沙坦降压幅度及达标率优于其他ARB类，能使患者长期获益

研究表明，奥美沙坦治疗8周后DBP的降低要大于氯沙坦、缬沙坦或厄贝沙坦。奥美沙坦也有SBP的减少，数值上大于三种比较药物的减少，虽没有统计学上的显著差异，但在几项临床试验中观察到，DBP和SBP的微小差异与主要心血管事件发生率的显著降低相关，这表明ARB之间血压降低的微小差异可能具有重要的长期影响。

美国一项随机，双盲，多中心研究，奥美沙坦、氯沙坦、缬沙坦、厄贝沙坦控制原发性高血压的疗效比较  
588例患者，袖带坐位DBP: 100–115 mm Hg ABPM: 白天DBP 90–120 mm Hg 首要终点: 8周时，袖带DBP相比基线血压的变化



OLM: 奥美沙坦    LOS: 氯沙坦    VAL: 缬沙坦    IRB: 厄贝沙坦



参考文献: Oparil S, Williams D, Chrysant S G, et al. Comparative efficacy of olmesartan, losartan, valsartan, and irbesartan in the control of essential hypertension[J]. The Journal of Clinical Hypertension, 2001, 3(5): 283-318.

# 03: 有效性

## 国内外指南推荐 可单药或联合 降压治疗首选用药

	指南名称	推荐内容描述
国内指南	 <b>中国老年高血压管理指南2023</b>	<b>一线推荐。</b> 进行降压的 <b>起始和维持治疗,单药或联合用药</b> 均可( <b>I 级推荐,A类证据</b> )。ARB可降低糖尿病或肾脏病患者的蛋白尿及微量白蛋白尿,尤其适用于伴左心室肥厚、心力衰竭、糖尿病肾病、代谢综合征、微量白蛋白尿或蛋白尿患者,以及不能耐受ACEI的患者。ARB与血管紧张素II 1型受体结合的选择性越高、亲和力越强、结合时间越持久,其阻断AT1R的作用越强,降压效果越显著
	 <b>中国慢性肾脏病患者高血压管理指南 (2023年版)</b>	<b>一线推荐。</b> ACEI/ <b>ARB</b> 可作为 <b>CKD患者高血压治疗的首选用药</b> , 可单独或联合其他降压药使用
	 <b>中国高血压防治指南 (2018年修订版)</b>	<b>一线推荐。</b> 高血压合并糖尿病 <b>首先考虑</b> 使用ACEI或 <b>ARB</b> ; 如需联合用药, 应以ACEI或 <b>ARB</b> 为基础( <b>I,A</b> )。库欣综合征相关高血压起始治疗首选( <b>I 级推荐,C类证据</b> )
国外指南	 <b>2023年 ESH动脉性高血压管理指南</b>	<b>一线推荐。</b> 首选抗血管紧张素系统抑制剂 (ACEi or <b>ARB</b> )
	 <b>2020年国际高血压学会全球高血压实践指南</b>	<b>一线推荐。</b> 治疗策略应包括血管紧张素受体阻滞剂( <b>ARB</b> )和CCB和/或利尿剂, 而受体阻滞剂β1-受体选择性)可用于选定的患者(如冠心病, 心衰)。

参考资料:

- 1、《中国老年高血压管理指南2023》
- 2、中国慢性肾脏病患者高血压管理指南 (2023年版)
- 3、《中国高血压防治指南(2018年修订版)》

- 4、《ESH动脉性高血压管理指南2023》
- 5、《2020年国际高血压学会全球高血压实践指南》

## 04：创新性

# 奥美沙坦酯口崩片 快速起效，服用方便，满足个体化降压需求

- **剂型创新：**国内首仿，采用超级崩解剂及口感良好填充剂制备，仅接触少量唾液即可快速崩解。减轻药物对食管、胃肠道的刺激性，副作用也随之降低。
- **应用创新：**口崩片在口腔内崩解，释药后在通过胃粘膜前便被口腔黏膜吸收，**避免肝脏的首过效应**，可以快速发挥药效，提高药物的生物利用度。

### 创新点



- **满足不同人群不同场景下的降压需求：**满足特殊人群（老人、吞咽困难者、精神障碍患者、因体位受限饮水困难者等），或不同场景下（如抢险救灾等特殊环境下水源受污染时、沙漠地区及外出旅行、野外无水）的降压治疗。
- **起效迅速 顺应性好：**与片剂相比，本品具有更快的降压作用，可成为治疗突发高血压、高血压急症等的有效治疗手段。口感好，用药顾虑少，尤其是对于改善老人、精神障碍患者和无意识患者用药依从性具有重要作用。
- **满足个体化降压需求：**药片上的刻痕设计可分割成更小的剂量单位，便于降压治疗时的个体化剂量和方案调整。

### 创新带来的患者获益

### 服用便利、起效迅速，强效稳压、每日一片，联合用药顾虑少



#### 对公共健康的影响

- 我国高血压患病率高，控制率低于全球平均水平。
- 强化高血压的分级、分期、分型管理，**关注特殊人群、不同场景下的降压用药需求**，提升用药的依从性，有助于实现高质量血压管理，提升高血压控制率，降低心血管疾病风险，减轻家庭和社会的负担。



#### 符合“保基本”原则

- 本品属ARB类降压药，强效稳压，是降压治疗首选用药。口崩片剂型，**服用便利，起效迅速**，可单用或联用，**用药顾虑少**。
- 本品治疗费用与我国当前经济发展水平相适应，不额外增加医保负担，对医保基金影响有限、可控。



#### 弥补目录短板

- **目录内口服降压药均为口服常释剂型，缺少可满足特殊人群或不同场景下降压用药需求的适宜剂型。**
- 口崩片剂型，无需用水，避免肝脏首过效应，减少胃肠道刺激，提供新的降压用药选择。



#### 临床管理便利

- 处方药，**单一适应症范围明确**，不存在临床滥用或超说明书用药的可能，便于管理。
- 每日一片，可与食物同服，肝功能不全或肾功能不全患者无需调整剂量，**提升患者降压治疗用药依从性。**