

苯甲酸福格列汀片

(商品名：信立汀)

深圳信立泰药业股份有限公司

2024年7月

目 录

01

药品基本信息

02

创新性

03

安全性

04

有效性

05

公平性

中国自主研发的DPP-4*抑制剂类降糖药

- 【通用名】 **苯甲酸福格列汀片** 【注册分类】 **化药1类**
- 【注册规格】 6mg; **12mg**** 【专利期】 化合物专利, 至2030年
主规格
- 【是否OTC药品】 否 【首个上市国家及时间】 **中国, 2024年**
- 【适应症】 **本品适用于改善成人2型糖尿病患者的血糖控制。**
单药治疗: 本品单药可配合饮食控制和运动, 用于改善成人2型糖尿病患者的血糖控制。
与盐酸二甲双胍联合治疗: 当单独使用盐酸二甲双胍仍不能有效控制血糖时, 本品可与盐酸二甲双胍联合使用, 在饮食和运动基础上改善成人2型糖尿病患者的血糖控制。重要的使用限制: 本品不适用于1型糖尿病或糖尿病酮症酸中毒的患者。
- 【用法用量】 本品单药治疗或与二甲双胍联合治疗的**推荐剂量为12 mg, 每日一次**。本品可与食物同时或分开服用。

疾病情况

- 我国成人2型糖尿病患者**患病率高达11.2%¹**, 60岁及以上的老年患者糖尿病患病率达30%², 患者数量呈逐年上升的趋势, 但整体控制率低下;
- **传统降糖药在治疗时易导致患者发生低血糖等严重不良反应, 降低患者的生活质量, 部分患者因恐惧低血糖发作而停药, 是达到血糖控制的重大阻碍。**

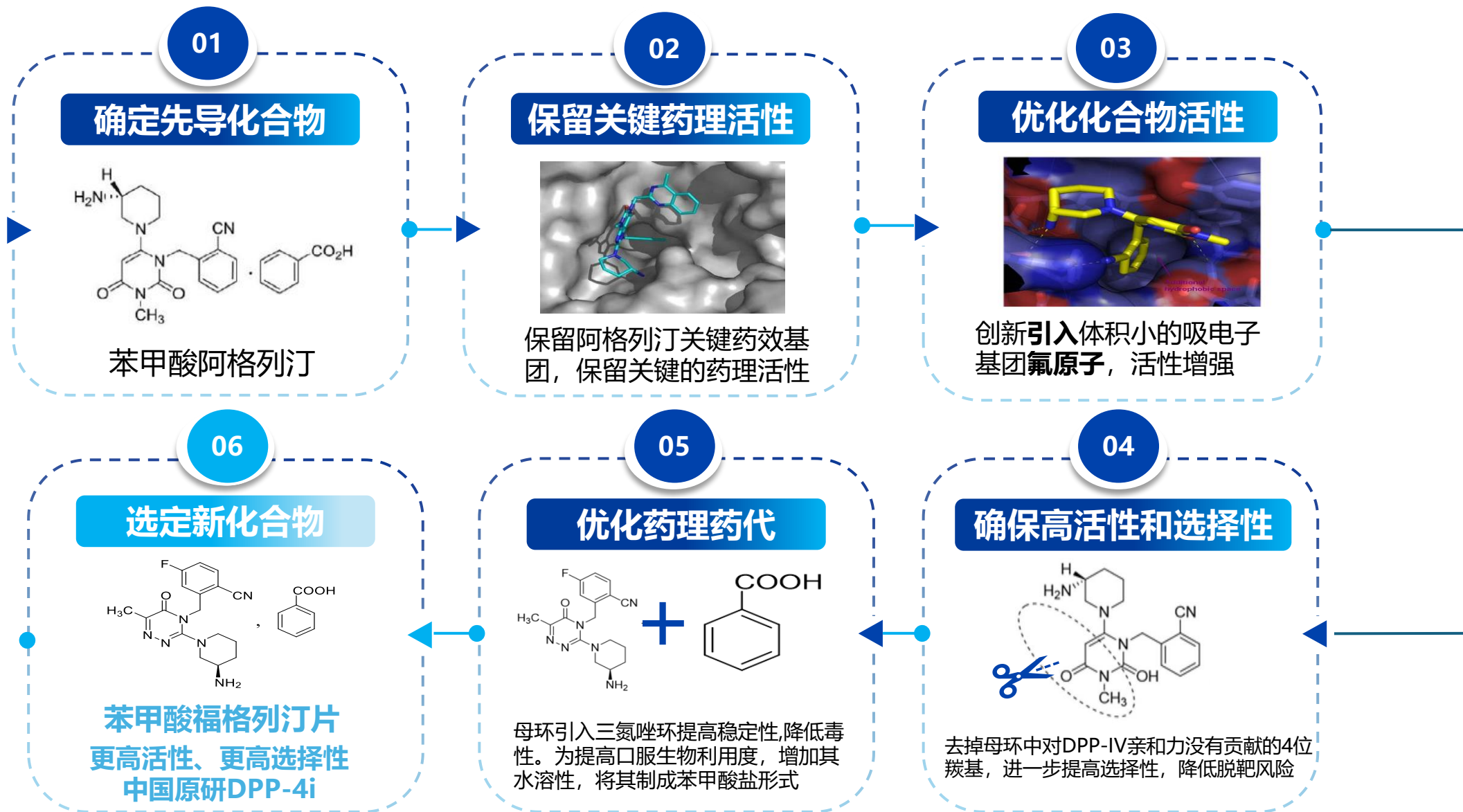
参照药建议

建议选择 苯甲酸阿格列汀片(尼欣那®) 作为参照药

- 福格列汀单药治疗的III期临床试验中, **选择阿格列汀原研药进行头对头试验**, 临床证据可靠性高;
- 福格列汀片**基于阿格列汀化学结构创新改构**, 且二者均为DPP-4抑制剂, 在化学结构、药理机制、临床应用等方面均相近。

*DPP-4i: 二肽基肽酶IV抑制剂; **本品2项III期临床试验均为12mgQD的给药方案, 说明书推荐剂量同样为12mg, 每日一次使用;

1. BMJ, 2020, 369:m997.2. 中华内科杂志,2022,61(1):12-50.



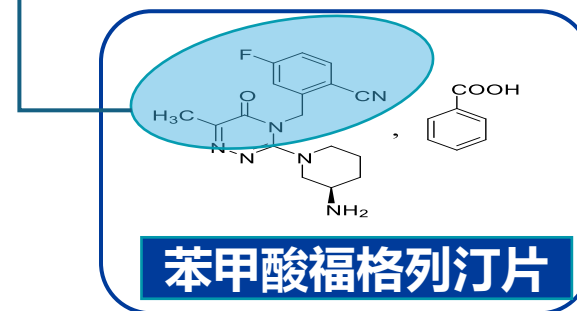
■ 自主研发的1类创新药，福格列汀片实现低剂量、低毒性、有效避免靶外作用



中国自主研发的DPP-4抑制剂

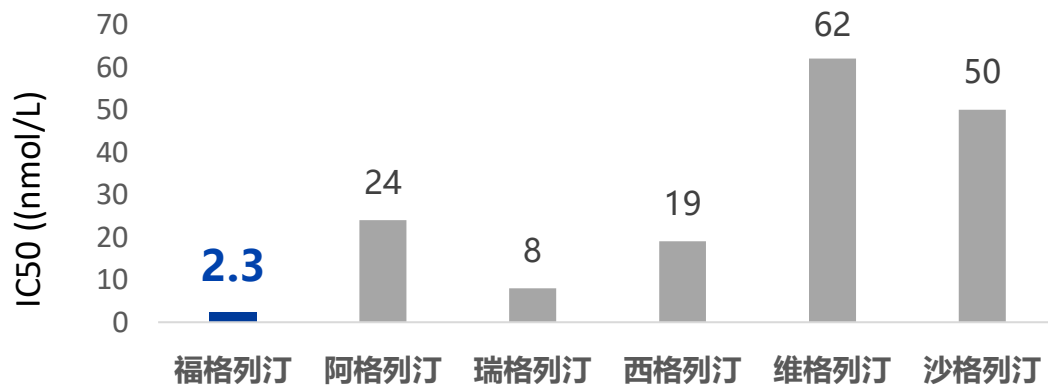
- **国家1类创新药**
- **全新化学分子体**
- **独家品种，自主知识产权，专利已获授权**
- **荣获国家十二五“重大新药创制”科技重大专项支持**

福格列汀创新引入氟原子后，将成为代谢稳定性更好，半衰期更长的低剂量DPP-4i



药品	剂量	半衰期(h)
福格列汀	12mg	26.9-38.6
阿格列汀	25mg	21.4
瑞格列汀	100mg	22
西格列汀	100mg	12.4
维格列汀	50mg	2-3
沙格列汀	5mg	2.5

福格列汀将成为半衰期更长的低剂量DPP-4i，带来更强活性、更小毒性¹



IC50，半抑制率，数值越小，说明药物抑制活性越强，药效越强



DPP-8、DPP-9对于药物在体内的毒性有明确的相关性，选择性高降低DPP-8/9抑制，实现降低免疫毒性、皮肤毒性风险，有效避免靶外作用

1. 苯甲酸福格列汀片研究者手册.

■ 福格列汀片低血糖发生率在目录内同类产品中较低，更加安全可靠，助力长期血糖达标

双盲治疗期低血糖发生率	福格列汀 12mgQD	阿格列汀 25mgQD	瑞格列汀 100mgQD	西格列汀 100mgQD	沙格列汀 5mgQD	利格列汀 5mgQD
单药治疗24周 低血糖发生率	0.9%	1.5%	2.0%	12.2%	5.6%	6.6%
联合MET治疗24周 低血糖发生率	1.9%	1.0%	2.4%	15.5%	5.8%	1.0%

注：目录内各产品低血糖发生率均为公开途径可查询到的中国III期试验数据，非头对头研究数据，仅供参考

T2DM患者治疗时低血糖发生率及风险

- T2DM患者使用药物降糖治疗期间，低血糖发生率45%，严重低血糖发生率6%，严重者威胁生命，**是降糖治疗中的主要疾病威胁**；
- 老年糖尿病患者自身调节低血糖能力下降，肠促胰岛素分泌减低，肝糖原功能减弱，在治疗中更容易出现低血糖¹，**因此，指南推荐早期治疗时应选择不增加低血糖发病风险的治疗方式，如DPP-4i**；
- 双盲治疗期，**福格列汀片单药治疗T2DM患者低血糖发生率 < 1%²，联合二甲双胍治疗低血糖发生率 < 2%³，且各组均无重度低血糖发生；延长治疗期，福格列汀片不增加低血糖发生率；在目录内同类产品中低血糖发生率较低²，更加安全可靠，可满足患者长期用药需求。**

MET：二甲双胍

1. 中华内科杂志,2022,61(1):12-50. 2. BMC Medicine (2023) 21:388. 3. 苯甲酸福格列汀片临床研究报告, SAL067-C-009.

- 与目录内其他同类药品相比，福格列汀片安全性优，未发生其他DPP-4i常见的咽炎、鼻咽炎以及感染等常见不良反应，且未发生严重不良反应

DPP-4抑制剂 常见不良反应	福格列汀 12mgQD	阿格列汀 25mgQD	瑞格列汀 100mgQD	西格列汀 100mgQD	沙格列汀 5mgQD	利格列汀 5mgQD
咽炎	未发生	未报道	1.6%	未报道	未报道	未报道
鼻咽炎		4.8%	未报道	6.3%	未报道	7%
头晕		4.3%	1.6%	5.9%	6.5%	6.4%
尿路感染		未报道	未报道	未报道	6.5%	未报道
上呼吸道感染		4.5%	未报道	6.2%	7.7%	8.0%
严重不良反应发生率	0	0	0	0.8%	未报道	未报道



说明书中不良反应¹：基于2项III期临床试验汇总分析显示，接受本品治疗24周的受试者，发生率≥1%且高于安慰剂的不良反应有脂肪酶升高（5.5%），尿潜血阳性[#]（1.8%），尿红细胞阳性[#]（1.3%），**提示苯甲酸福格列汀片具有良好的安全性和耐受性。**

上市后不良反应监测情况：未查询到各国药监网站对本品的安全性警告、黑框警告、撤市信息等

注：感染等相关不良反应发生率数据来源于阿格列汀、瑞格列汀、西格列汀、利格列汀、沙格列汀中文说明书；严重不良反应总发生率来源于各自说明书列出的三期临床试验结果。

- 老年T2DM患者患病率高、但控制率低，已成为糖尿病的主流人群，福格列汀片对体重的波动小，且药物间相互作用少，单药或联合用药时更安全，可满足老年患者长期用药需求



中国老年糖尿病诊疗指南（2024年版）

- DPP-4抑制剂是近年来国内外指南和（或）共识推荐的**老年T2DM患者一线降糖药之一**，该类药物**单独应用时一般不出现低血糖，对体重影响中性**，胃肠道反应少，较适用于老年患者，是老年T2DM患者的一级推荐降糖药物。
- 单药应用二甲双胍、**DPP-4i**、 α -糖苷酶抑制剂、...等**低血糖风险较低**，但由于老年糖尿病患者常合并多种疾病，使用前述药物时仍应**警惕与其他药物相互作用**而导致的低血糖风险增加。



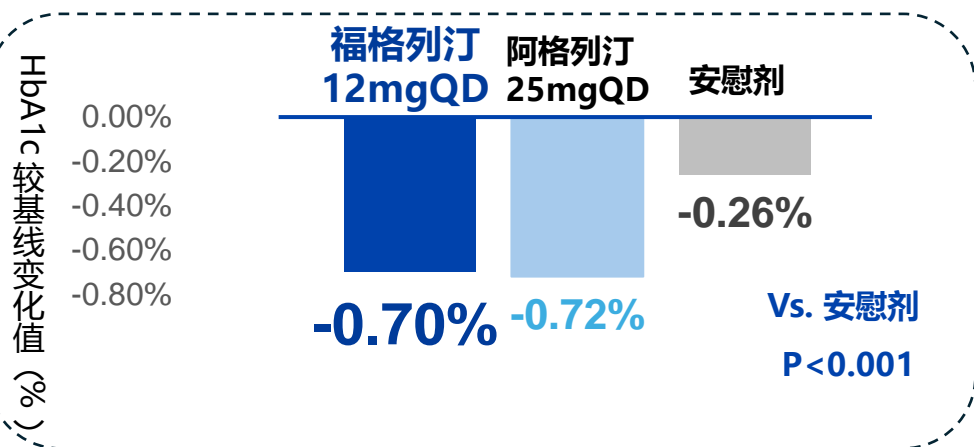
中国成人2型糖尿病口服降糖药联合治疗专家共识

- 联合治疗的要点：①作用机制互补的药物联合；②**联合方案应使低血糖风险和严重程度最小化，不良反应无叠加**；③对于超重或肥胖的T2DM患者，**尽量选择联合减重或不增加体重的药物**，以改善胰岛素抵抗和减少血糖控制的难度。
- 二甲双胍与DPP-4抑制剂联合可以发挥机制互补、协同增效的作用。**二者联合可兼顾空腹血糖和餐后血糖，低血糖风险小，对体重影响中性，耐受性良好**。该联合方案适用于多数T2DM患者起始联合治疗，尤其是低血糖风险大患者。

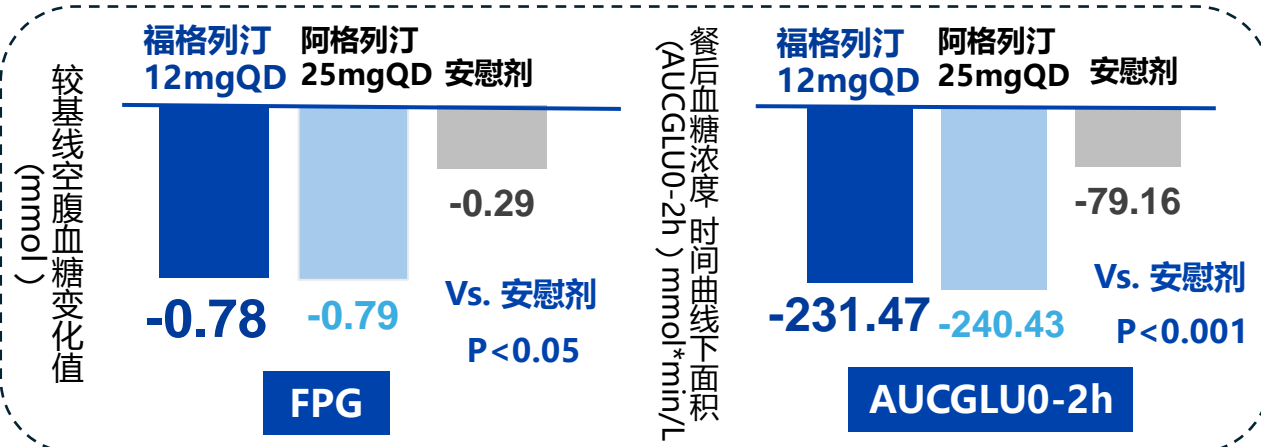
■ 2项III期临床试验^{1,2} 均显示福格列汀片治疗24周可实现全面降糖，疗效确切

显著降低HbA1c水平

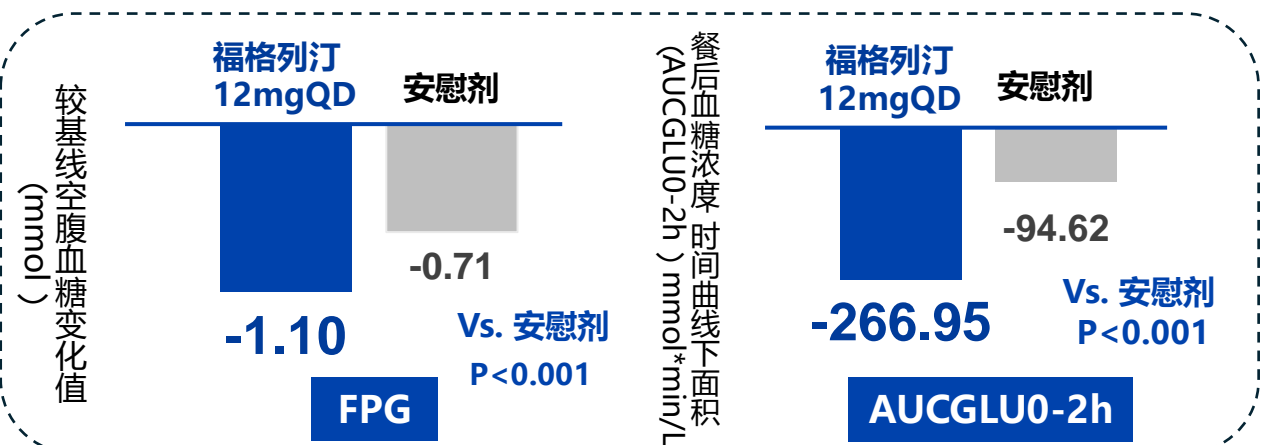
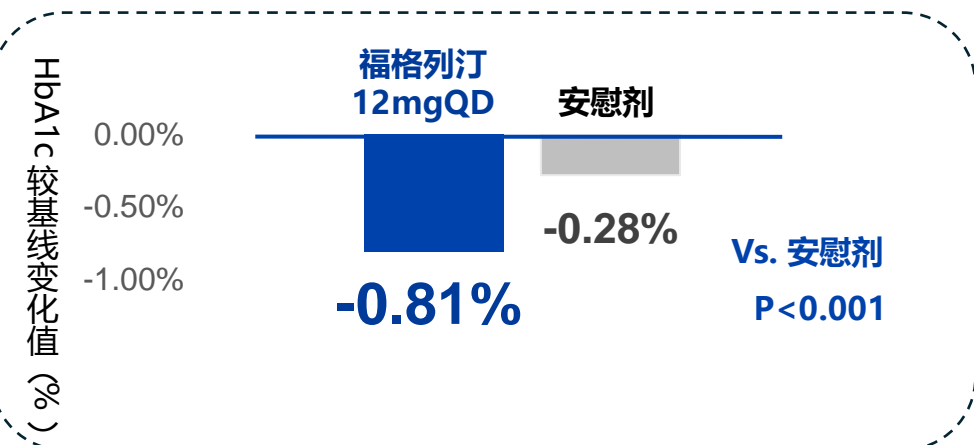
单药



显著降低空腹血糖和餐后血糖浓度水平



联合二甲双胍



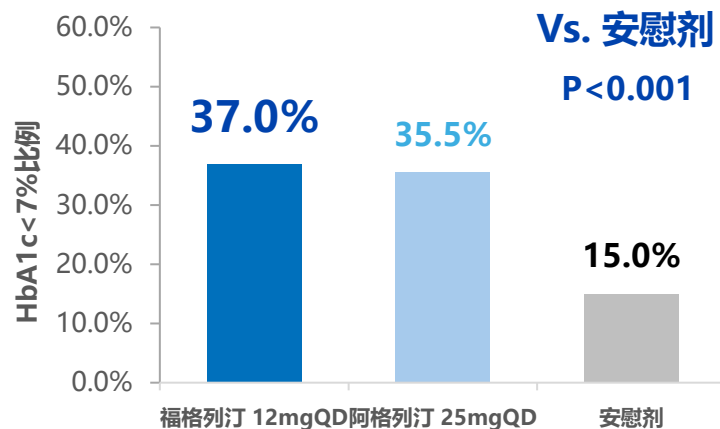
AUCGLU0-2h: 餐后血糖浓度-时间曲线下面积; FPG: 空腹血糖; HbA1c: 糖化血红蛋白

1. BMC Medicine (2023) 21:388. 2. 苯甲酸福格列汀片临床研究报告, SAL067-C-009.

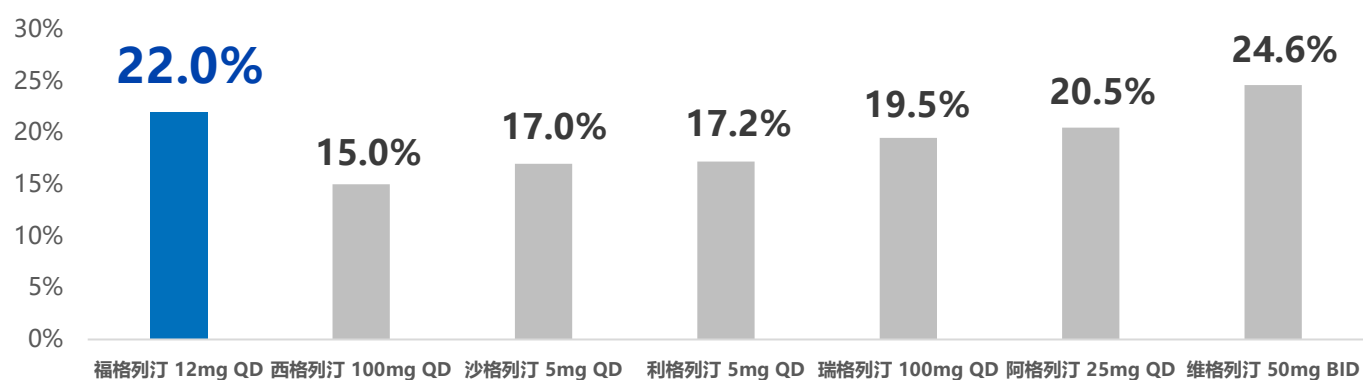
■ 福格列汀片疗效确切，治疗24周后在同类产品中达标率较高

单药

单药治疗24周后达标率情况¹

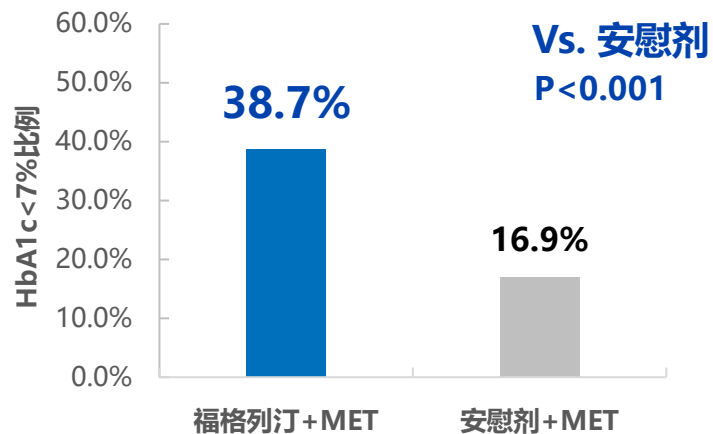


与目录内同类产品比较达标率情况

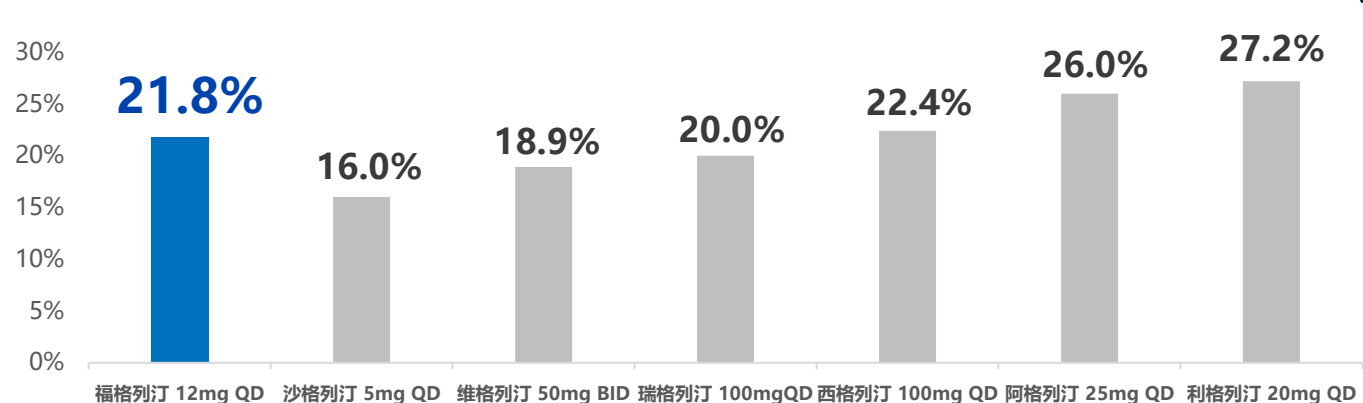


联合二甲双胍

联合二甲双胍治疗24周后达标率情况²



与目录内同类产品比较达标率情况



MET: 二甲双胍



提供安全降糖更优选

- 苯甲酸福格列汀片为中国自主研发的**1类创新药品**，为**选择性更高、活性更强的低剂量DPP-4抑制剂**；
- 降糖疗效确切，**低血糖风险低、不良反应发生率低，对体重影响为中性**，适合老年患者使用；
- 福格列汀片单药治疗患者HbA1c达标率较高，联用二甲双胍治疗，**进一步提高血糖患者达标率。**



符合“保基本”原则

- 国内外指南均推荐**DPP-4抑制剂**为老年糖尿病患者的一级治疗药物；
- 我国**糖尿病患病率高达11.2%**，且呈逐年上升的趋势，纳入本品**可为广大糖尿病患者提供更多选择**；
- “两病”用药，疗效确切，安全耐受，**降低老年人合并用药风险**，可满足**长期安全治疗的降糖管理需求。**



便于临床管理

- 苯甲酸福格列汀片说明书适应症、用法用量明确，**临床滥用风险低**；
- 口服给药，一日一次，**患者依从性高**，为患者提供简便治疗选择，便于临床管理；
- **针对轻度的肾功能不全患者，不需要调整剂量**，中度肾功能不全患者减半使用，**福格列汀片2种上市规格，便于剂量调整。**