



枸橼酸爱地那非片 (爱力士®)

悦康药业集团股份有限公司



01

基本信息

02

安全性

03

有效性

04

创新性

05

公平性



- “863”计划科技部重大专项
- “十二五”重大新药创制专项
- 首个中国原研抗ED化药1.1类新药
- 拥有22个国家和地区化合物专利

通用名称：枸橼酸爱地那非片

注册规格：30mg（按 $C_{23}H_{32}N_6O_4S$ 计）

适应症：治疗男性勃起功能障碍（ED）

中国大陆首次上市时间：2021年12月

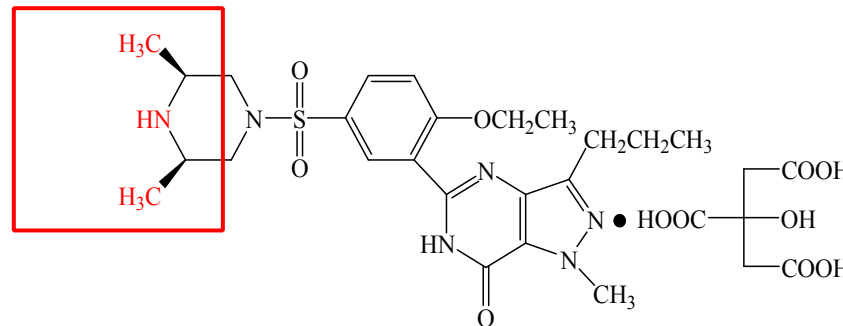
目前大陆地区同通用名药品的上市情况：独家创新药

全球首个上市国家/地区及上市时间：2021年12月，中国

用法用量：口服，推荐剂量为一次60mg（2片），在性活动前约1小时服用。24小时内最多服用一次。临床试验中本品治疗不超过12周。在没有性刺激时，推荐剂量的爱地那非不起作用。

是否为OTC药品：否

参照药品建议：无。国家医保药品目录内无同适应症治疗药物



分子式： $C_{23}H_{32}N_6O_4S \cdot C_6H_8O_7$

分子量：680.74

- 枸橼酸爱地那非片治疗男性勃起功能障碍是解决0到1的根本问题。
- “治疗男性勃起功能障碍” ≠ “增强性功能”

与已上市的同治疗领域药品相比的优势

枸橼酸爱地那非对 PDE各亚型酶学活性测试报告显示：**枸橼酸爱地那非对 PDE5 酶具有更好的特异性和选择性；与西地那非相比，爱地那非有效性更高，安全性更好。**

- **枸橼酸爱地那非对PDE5酶高选择性：**本品对 PDE5 酶的抑制作用是本品分别对其他亚型PDE3、PDE6、PDE9、PDE11 酶抑制作用的 552 倍、2350 倍、121 倍、847 倍。
- **枸橼酸爱地那非对PDE5酶抑制作用较西地那非强：**本品对 PDE5酶的抑制作用是阳性对照药物西地那非作用强度的 1.47 倍。
- **枸橼酸爱地那非对PDE其他亚型酶的抑制作用较西地那非弱：**本品对 PDE其他亚型酶的抑制作用是阳性对照药物西地那非对其他亚型PDE3、PDE6、PDE9、PDE11 酶抑制作用的0.75、0.30、0.06、0.49倍。

枸橼酸爱地那非与西地那非相比，具有不受高脂饮食影响的优势：

- 西地那非在与高脂肪饮食同服时，吸收速率降低，达峰时间 (T_{max}) 平均延迟 60 分钟， C_{max} 平均下降 29%，AUC 下降 11%^[1]。
- 枸橼酸爱地那非与高脂肪饮食同服时，上述参数无明显变化。

[1]西地那非2021/10/06中文版说明书.

所治疗疾病基本情况

勃起功能障碍（ED）是指男性不能持续获得和维持足够的阴茎勃起以完成满意的性生活，是长期被忽视的男科重大慢性疾病。中国成年男性5.48亿，ED患病率为5.9%，意向就诊率17%。不育夫妇男性ED患病率高达50.9%，是导致不育症的重要危险因素，ED的诊治可促使患者自然怀孕，顺应国家“二孩”和“三孩”政策，促进人口长期均衡发展。

勃起功能障碍与很多慢性疾病（包括心血管、内分泌、神经系统、精神心理疾病等）存在“共病”现象，已经成为全球共同关注的公共健康问题。ED患者获得及时规范的临床治疗对其他常见慢性共病的治疗和转归起到重要作用，可以有效控制原发病，降低医保支出，减轻社会负担。

党的二十大报告提出，“提高人民生活品质”和“优化人口发展战略”。爱地那非治疗ED有助于改善患者家庭生活品质，提高优生优育能力，促进人口长期均衡发展。爱地那非纳入国家医保药品目录，将填补《国家基本医疗保险药品目录》空白，提高ED治疗药物公平可及性，契合国家战略目标。

临床未被满足的治疗需求

ED与多种慢性疾病存在“共病”现象，52.5%糖尿病患者合并ED，15%~46%高血压患者合并ED，40%抑郁症人群合并ED，62%慢性前列腺炎患者合并ED，且ED是心脑血管疾病潜在的预警信号，积极的ED诊治有助于及早发现或预防心脑血管疾病、糖尿病、高血压等慢性疾病。

口服PDE5抑制剂为ED治疗首选方式，其使用方便、安全、有效，患者依从性高。但目前，同类产品背痛、肌痛、头痛、上腹部不适等不良反应发生率相对较高，并受高脂饮食影响。爱地那非是唯一已上市以中国男性生理特征为研发基础的PDE5抑制剂，选择性更高，安全性更好，更适合中国人体质。

目前国家医保药品目录内无治疗ED药物。

爱地那非与同类药品安全性比较

与同类产品安全性数据的比较（非头对头）					
不良反应	爱地那非 ^[1]	西地那非 ^[2]	他达拉非 ^[3]	伐地那非 ^[4]	安慰剂
背痛	0%	2%	6%	2%	0%
肌痛	0%	/	3%	/	0%
头痛	3.79%	16%	15%	14.4%	0.85%
上腹部不适	2.33%	7%	10%	2.8%	0%
鼻塞	1.17%	4%	3%	3.1%	0%
潮红	6.71%	10%	3%	7.6%	0.85%
眼胀	1.46%	3%	< 0.1%	< 2%	0%
头晕	4.96%	2%	< 2%	2.3%	0.85%
心悸	1.17%	< 2%	< 2%	< 0.01%	0.85%

爱地那非与同类药品相比安全性更好：

本品头痛、上腹部不适、鼻塞、背痛、肌痛不良反应发生率均低于同类药品；潮红的发生率低于西地那非和伐地那非。

- 国内外不良反应发生情况：爱地那非于2021年12月在中国批准上市。无相关安全性警告、黑框警告、撤市信息发布。本品自上市至今我司未收到监管部门反馈的不良反应报告；共上报来自于上市后研究的不良反应报告37例，均为轻度、一过性，无严重不良反应反馈报告。表明爱地那非具有有利的获益-风险特征。
- 药品说明书收载的安全性信息：本品Ⅲ期临床试验，爱地那非VS安慰剂的不良反应发生率为20.12% VS 3.42%。一般均为轻度，且为一过性，可自行缓解。
- 禁忌：禁止与硝酸酯类和鸟苷酸环化酶激动剂合用，禁用于对本品成分及辅料成份过敏的患者。

国家药品审评中心出具的《技术评审报告》中关于本药品有效性的描述

试验类型1：随机、双盲、安慰剂对照Ⅲ期临床试验

- 共纳入470例勃起功能障碍（ED）受试者随机接受爱地那非或安慰剂治疗12周。
- 爱地那非组勃起功能评分高于安慰剂组（10.16 VS 4.23），插入成功率优于安慰剂组（46.16% VS 17.88%）显著改善了性交成功率（67.98% VS 24.69%），本品对轻度、中度及重度ED改善率分别为95.71%、88.54%和80.56%，**具有明显的临床获益。**

试验类型2：随机、双盲、安慰剂平行对照、双周期交叉临床试验

- 共纳入60例勃起功能障碍（ED）受试者随机分为不同给药序列组（爱地那非-安慰剂组或安慰剂-爱地那非组），交叉给药。
- 爱地那非组阴茎头部、阴茎根部勃起时硬度大于60%的持续时间均优于安慰剂组（头部：13.09 min VS 3.33 min；根部：14.23 min VS 2.88 min），**具有明显的临床获益。**

临床指南/诊疗规范推荐情况

- 《勃起功能障碍中西医结合多学科诊疗指南》（2022版）：推荐枸橼酸爱地那非片是治疗ED常用而有效的口服药物。
- 《勃起功能障碍诊断与治疗指南》（2022版）：口服PDE5抑制剂是ED治疗首选方式。
- 《中西医结合诊疗勃起功能障碍专家共识》（2022版）：PDE5抑制剂是治疗勃起功能障碍的一线用药。

目前国家医保药品目录内无治疗ED药物

主要创新点

- **全新的化学结构** 本品在结构中创新性引入仲胺及双甲基，与同类药品相比，本品结构共面性更好，脂溶性更强，脂水分配比更合理，增强药物在体内的吸收和分布。
- **高选择性** 本品对PDE5酶具有更高选择性，对其他PDEs亚型酶抑制作用较弱，本品对 PDE5 酶的抑制作用是本品分别对其他亚型PDE3、PDE6、PDE9、PDE11 酶抑制作用的 552 倍、2350 倍、121 倍、847 倍，减少药物发生不良反应。与阳性对照药物西地那非比较，本品对 PDE5酶的抑制作用强度为西地那非的 1.47 倍，本品对 PDE其他亚型酶的抑制作用是西地那非对其他亚型PDE3、PDE6、PDE9、PDE11 酶抑制作用的0.75、0.30、0.06、0.49倍。本品具有更好的有效性和安全性。
- **唯一已上市以中国男性生理特征为研发基础的PDE5 抑制剂** 最快15分钟起效，约1小时达峰血药浓度，吸收迅速溶解快，药效稳定，不受高脂饮食影响，更适合中国人体质。
- **打破中国无国产原研抗 ED 药物的历史** 本品拥有含中、美、欧盟等 22 个国家和地区的化合物专利，获得国家“863”计划科技部重大专项及“十二五”重大新药创制专项支持，是中国首个原研1.1类抗 ED 创新药物。

主要创新点带来的疗效及安全性方面的优势

- **有效性更高** 本品对PDE5酶具有更高选择性，有效性更高。本品对轻度、中度及重度ED改善率分别为95.71%、88.54%和80.56%，具有明显的临床获益。
- **安全性更好** 本品对其他PDEs亚型酶抑制作用更弱，降低药物不良反应发生率，本品头痛、上腹部不适、鼻塞、背痛、肌痛不良反应发生率均低于同类药品。
- **不受高脂饮食影响** 在使用过程中不受高脂饮食的影响，药效更稳定，疗效更确切。

国家政策支持

- 党的二十大报告提出“优化人口发展战略”，包括优化生育政策，配套实施积极生育支持措施。
- 《中共中央 国务院关于优化生育政策促进人口长期均衡发展的决定》（2021年6月26日）。
- 《关于进一步完善和落实积极生育支持措施的指导意见》（国卫人口发〔2022〕26号）二（三）“加强生殖健康服务”要求：指导推动医疗机构通过健康教育、药物治疗、辅助生殖技术等手段提高群众不孕不育防治水平。

北京市政策先行

- 《北京市医疗保障局 北京市人力资源和社会保障局关于将16项治疗性辅助生殖技术项目纳入医保、工伤保险支付范围的通知》京医保发〔2023〕13号：16项治疗性辅助生殖技术项目按医保甲类纳入门诊报销，自2023年7月1日起执行。

公共健康现状

- 中国成年男性勃起功能障碍（ED）患病率为5.9%，意向就诊率17%，同时ED与很多慢性疾病存在“共病”现象。
- 中国男科学是一门新兴学科，男性生殖健康，特别ED是长期被忽视的男科重大慢性疾病。

符合“保基本”原则

- 枸橼酸爱地那非片是唯一已上市以中国男性生理特征为药物研发基础的PDE5 抑制剂，临床研究结果表明，与同类药品相比，本品有效性更高（本品对轻度、中度及重度ED改善率分别为95.71%、88.54%和80.56%），同时选择性更高，安全性更好，并不受高脂饮食影响。
- **不育患者治疗**：不育夫妇男性ED患病率高达50.9%。ED的及时治疗有利于改善患者家庭生活品质，提高优生优育能力，促进人口长期均衡发展。
- **慢性病共病共治**：ED与很多慢性疾病（包括心血管系统、内分泌系统、神经系统、泌尿系统及精神心理疾病等）存在“共病”现象。ED患者获得及时规范的临床治疗对其他慢性病共病的治疗和转归起到重要作用，同时，口服PDE5抑制剂可改善和修复血管内皮功能，增强患者用药依从性，有效控制原发病，降低慢性病长期花费。

临床指南诊断标准及治疗路径清晰，不存在滥用风险

- 《勃起功能障碍诊断与治疗指南》（2022版）和《勃起功能障碍中西医结合多学科诊疗指南》（2022版）均明确了ED的临床诊断标准及治疗路径，并共同推荐口服PDE5抑制剂为ED治疗的首选方式，不存在滥用或超说明书用药风险。

填补目录空白，同时美、德、日、英等国已将PDE5抑制剂纳入医保药品目录

- 目前国家医保药品目录内无治疗ED药物，枸橼酸爱地那非片纳入医保药品目录将减少患者家庭负担，提高药物可及性，保障国家战略安全。
- 2023年5月，中华医学会男科学分会组织多学科研讨形成《关于治疗男性勃起功能障碍创新药物纳入国家医保药品目录专家共识》^[1]的申请报告并递交国家医疗保障局。
- 美国、德国、日本、英国等国家已将PDE5抑制剂治疗ED纳入医保药品目录。

药物经济学研究显示，ED与其它慢性病共治将明确降低慢性病长期花费和国家医保基金总支出

- 一项针对1000名ED合并高血压和1000名ED合并糖尿病的患者药物经济学研究显示^[2]：合并应用PDE5抑制剂治疗，分别可以降低高血压患者35%、降低糖尿病患者22%的整体费用，慢病共治将大幅降低慢性病长期花费和国家医保基金总支出。

枸橼酸爱地那非片作为国家“863”计划及“十二五”重大新药创制专项支持的1.1类新药纳入国家医保药品目录，将填补目录空白，提高ED治疗药物公平可及性，保障男性生殖健康，促进中国人口长期均衡发展，有效控制慢病共病，降低国家医保基金总支出。同时也有助于民族创新，促进中国医药行业可持续健康发展。

资料来源：[1]中华医学会男科学分会，《关于治疗男性勃起功能障碍创新药物纳入国家医保药品目录专家共识》。

[2]Arreola-Ornelas H.G.-M.L., Rosado Buzzo A., Mould-Quevedo J., Dávila-Loaiza G. Savings through sildenafil use as a coadjuvant in pharmacological treatment adherence in hypertension and type 2 diabetes in Mexico. Rev Mex Urol. 2008.