

国家医保药品目录申报材料



琥珀酸曲格列汀片

棠泰® | Trelagliptin Succinate Tablets

国内首个口服降糖单周制剂·依从性革命的引领者



每周一次

年服药仅 52 次



HbA1c↓0.72%

降糖疗效确切



低血糖风险极低

体重中性



各类肝损

PK 参数基本稳定



日本 10 年应用

安全性充分验证



目录

CONTENTS

核心价值速览

01



基本信息

国内首个口服降糖**单周制剂**，破解依从性、可及性与长效治疗三大临床刚需

02



安全性

肝脏安全性更优，整体安全性历经 **10 年**验证，不良事件以轻度为主

03



有效性

中国 III 期证实降糖疗效确切 (HbA1c↓0.72%)，**特殊人群获益突出**

04



创新性

独特分子结构，带来更优选择

05



公平性

弥补多项目录空白，**周制剂显著提升依从性**，降低医保长期负担

01 基本信息 曲格列汀为国内**首个**口服降糖单周制剂

产品基本信息¹

通用名称	琥珀酸曲格列汀片
商标名称	崇泰®
注册规格	50mg、100mg
适应症	在饮食控制和运动基础上，本品可单药治疗用于2型糖尿病成人患者改善血糖控制。
用法用量	通常成人每周口服1次，每次100mg
上市时间	全球：日本 2015.03 中国首次获批：2022.03
是否为OTC药物	否（处方药）
申报目录类别	基本医保目录
参照药品	考格列汀片（双周制剂）

选择考格列汀作为参照药的相似性理由

从“相似性”出发，考格列汀（双周制剂）是同类长效 DPP-4i 中最直接的参照对象



同类作用机制

同为 DPP-4 抑制剂类口服降糖药，作用靶点与降糖机制完全一致



同为长效制剂

考格列汀双周给药，是给药频率最接近单周制剂的长效参照药物



同类适应症与人群

均用于 2 型糖尿病成人患者改善血糖控制，临床定位高度重合



最直接的医保对标

考格列汀已通过国谈进入医保，是长效制剂最直接的疗效与价格参照

● 临床未满足需求^{2,3}

中国成人T2DM患者约**1.4亿**，患病率12.4%，每年新发患者约400万，治疗率仅32.9%，治疗达标率仅50.1%。用药依从性不佳患者比例高达**76.2%**，漏服导致血糖波动、并发症风险增加。

● 曲格列汀解决方案

每周一次给药，将年服药次数从365次降至**52次**，革命性提升依从性；国产化保障药品可及性；长效特性满足特殊人群治疗需求。

1. 琥珀酸曲格列汀片说明书；2. 中华糖尿病杂志, 2025, 17(1): 16-139.; 3. National burden and risk factors of diabetes mellitus in China from 1990 to 2021: Results from the Global Burden of Disease study 2021.

02 安全性 曲格列汀对 DPP-4 靶点抑制和动力学抑制效率更高, 低血糖风险更低



DPP-4 抑制剂需要达到至少 70-80% 的 plasma DPP-4 活性抑制率, 才能有效升高活性 GLP-1 浓度并产生临床意义的降糖效果

曲格列汀·单周制剂¹

- ✓ **分子特性:** 分子更小、亲脂性更低、非共价结合 → 体内不易蓄积, 不良反应可较快逆转
- ✓ **靶点抑制:** Emax 97.8%; 用药 1 周靶点结合率仍达 80% → 整周平稳控糖
- ✓ **代谢排泄:** 不经 CYP450 代谢; 肝肾双通道 (粪便 24% + 尿液 76%) → 相互作用风险低

VS

考格列汀·双周制剂²

- **分子特性:** 为延长半衰期带大侧链、刚性环、疏水基团 → 脂溶性高、体内停留久, 难快速逆转
- **靶点抑制:** Emax 92.5%; 用药 2 周后 DPP-4 抑制率下滑至 68%
- **组织分布:** 亲脂性高, 更易进入脂肪、肝、肺等组织, 长期蓄积风险略高

 **核心结论:** 更小分子 + 更低亲脂性 + 非共价结合, 使曲格列汀蓄积风险更低、整周控糖更平稳, 安全性与有效性兼得。

1. Pharmacokinetics, Pharmacodynamics, and Safety of Single Dose HSK7653 Tablets in Chinese Subjects with Normal or Impaired Renal Function[J].Clinical Pharmacokinetics[J].2024 63:227-239.
2. Trelagliptin (SYR-472, Zafatek), Novel OnceWeekly Treatment for Type 2 Diabetes, Inhibits Dipeptidyl Peptidase-4 (DPP-4) via a Non-Covalent Mechanism[J].PLOS ONE.2016,11(6): e0157509.

02 安全性

整体安全性历经 10 年验证

曲格列汀**安全性良好、耐受性高**，显著降低低血糖发生率



不良事件以轻度为主

最常见为鼻咽炎；全程无死亡病例，单药及联合治疗低血糖风险极低，且所有低血糖事件均为轻度。

0

死亡病例

0.4%

严重药物相关 AE

轻度

全部低血糖事件

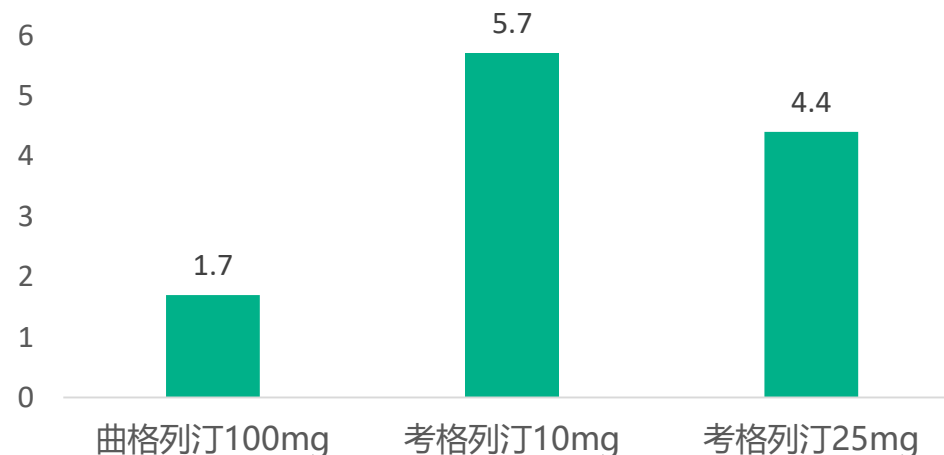
肝脏安全性更优¹⁻⁴

- ✓ 各类肝损时 PK 参数基本稳定 避免因肝功能监测不及时导致剂量不规范
 - ✓ 不经 CYP450 代谢 药物相互作用风险极低
 - ✓ 24% 经粪便排泄 肝肾双通道代谢，代谢负担小
- 参比制剂（日本武田 Zafatek®）2015 年上市、临床应用近 10 年，无黑框警告；2025 年印度上市后真实世界研究进一步验证安全性。

【不良反应】重要不良反应包括低血糖（发生率0.1%~5%）、类天疱疮、急性胰腺炎、梗阻（发生率均未知）。其他不良反应有皮疹、瘙痒、心房颤动、ALT上升、AST上升、γ-GTP上升、血清淀粉酶上升、脂肪酶升高、CK上升、尿隐血阳性、鼻咽炎。

曲格列汀相较于考格列汀低血糖发生率显著降低⁵

曲格列汀和考格列汀治疗24周后低血糖的发生率

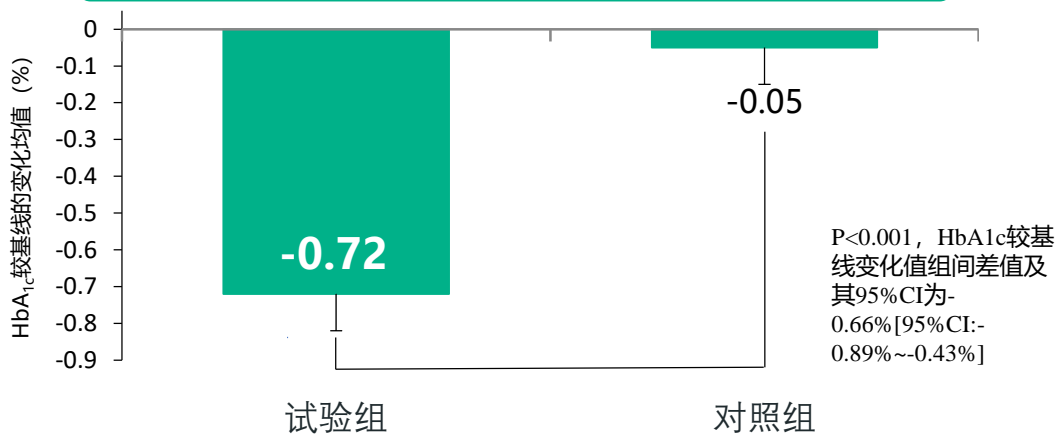


考格列汀10mg治疗24周后低血糖发生率为5.7%，25mg剂量这一数值为4.4%；而曲格列汀100mg治疗24周后低血糖发生率仅为1.7%，显著低于考格列汀。

03 有效性 中国 III 期临床证实降糖疗效确切，显著降低患者 HbA1c 水平

研究设计 全国16家中心 | 随机、双盲、安慰剂平行对照、多中心 | 共纳入237例 (试验组118/对照组119) ¹

曲格列汀24周HbA1c较基线降低0.72%，显著优于安慰剂



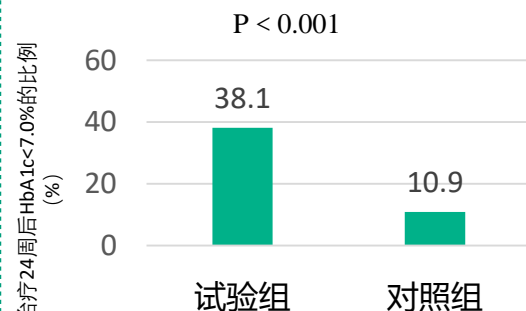
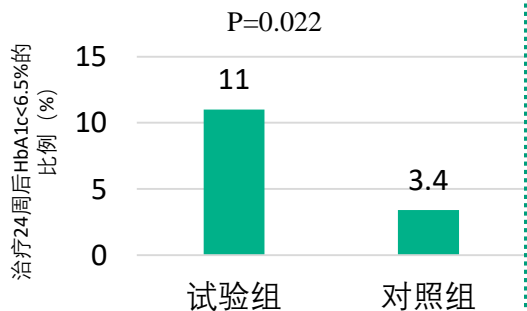
99.2%
用药依从性平均

75-80%
DPP-4 抑制率稳定维持 52 周

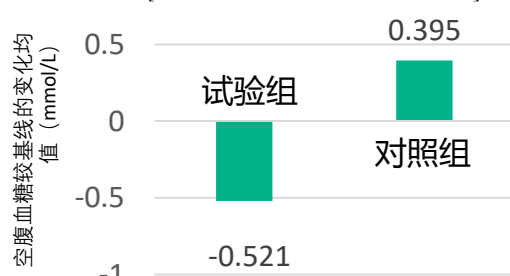
体重中性
对体重无明显影响

极低
低血糖风险，安全性良好

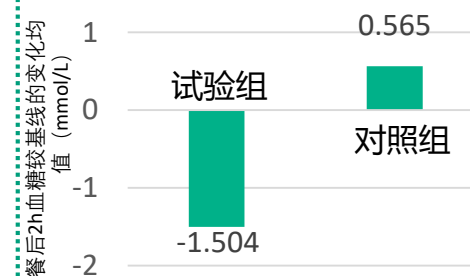
• 曲格列汀与考格列汀相比，HbA1c 较基线变化相似，均具有良好的降糖效果。



$P = 0.001$, FPG 较基线变化值组间差值及其95%CI为-0.77 mmol/L [95%CI: -1.24 mmol/L ~ -0.30 mmol/L]



$P < 0.001$, 2hPBG 较基线变化值组间差值及其95%CI为-2.02 mmol/L [95%CI: -2.87 mmol/L ~ -1.17 mmol/L]



03 有效性 降糖疗效与每日DPP-4i相当，依从性与治疗满意度显著提升

研究设计 75 例前瞻性、单中心、自身前后对照；由每日 DPP-4i 换为曲格列汀 100mg 每周 1 次，随访 3 个月¹

换药 3 个月后 HbA1c

7.0% → 7.0%

基线 → 终点

无统计学差异 (P = 0.22)

换药后患者获益显著改善

↑ 用药依从性评分 0.8 → **0.9** P = 0.03

↑ 治疗满意度评分 25.2 → **26.4** P = 0.04

↑ 漏服药评分 0.4 → **0.7** P < 0.01

注：漏服药评分与依从性呈正相关。

1. Diabetes Research and Clinical Practice, 2019, 41-48.

03 有效性 特殊人群使用优势突出，并获国内外权威指南推荐

特殊人群用药优势

老年患者

- ✓ 低血糖风险极低
- ✓ 体重中性
- ✓ 胃肠道反应少

临床意义
老年 T2DM 患者一级推荐降糖药物

轻度肾损

- ✓ 76% 经肾脏排泄
- ✓ 轻度肾损无需调整剂量

临床意义
简化肾损患者用药方案

肝功能不全

- ✓ 24% 经粪便排泄、不经 CYP450代谢
- ✓ 各类肝损 PK 参数基本稳定

临床意义
中重度肝损可用（考格列汀未批准）

权威指南推荐

《中国老年糖尿病诊疗指南》(2024)¹

目前在国内上市的DPP-4i有西格列汀、维格列汀等，其中多数为日制剂，**曲格列汀**为周制剂。该类药物单独应用时一般不出现低血糖，较适用于老年患者。

《中国老年 2 型糖尿病防治指南》(2026)²

近年用于临床的DPP-4抑制剂有**曲格列汀**、考格列汀等，降血糖效应相近，总体依从性好。单独应用不增加低血糖风险，安全性良好。

《日本糖尿病学会共识声明第2版2024》³

每周给药一次的DPP-4抑制剂用药依从性高。

1. 中国老年糖尿病诊疗指南（2024版）[J]. 中华糖尿病杂志, 2024, 16(2): 147-189.

2. 中国老年2型糖尿病防治临床指南编写组等. 中国老年2型糖尿病防治临床指南（2026年版）[J]. 中华内科学杂志, 2026, 65(3): 206-255.

3. A consensus statement from the Japan Diabetes Society: A proposed algorithm for pharmacotherapy in people with type 2 diabetes - 2nd edition (English version). J Diabetes Investig. 2024 Sep;15(9):1326-1342.

03 有效性 与各类 DPP-4i 的全方位对比, 长效疗效与特殊人群使用优势凸显^{1,2}



对比维度	曲格列汀·单周	考格列汀·双周	日制剂 DPP-4i (阿格列汀等)
给药频率	每周 1 次	每 2 周 1 次	每日 1-2 次
年服药次数	52 次	26 次	365 次
半衰期 (h)	38.44	131.5	1.7-62.9
结合模式	非共价	非共价	多为非共价
肝损需调量	否 (各类肝损患者, PK参数基本稳定)	中重度未批准	视品种而定
肾损需调量	轻度无需调整	无需调整	多数需调整

曲格列汀核心优势总结



给药频率最优 每周 1 次 vs 日制剂每日 1-2 次, 年服药 52 vs 365 次, 年服药次数减少 313 次



特殊人群可用 各类肝损 PK 参数基本稳定 (考格列汀未批准中重度肝损), 填补目录空白

1. 新型降血糖药曲格列汀的研究进展[J]. 中国医院药学杂志, 2023,43(15): 1746-1762.
 2. 中华医学会糖尿病学分会. 中国糖尿病防治指南 (2024版) [J]. 中华糖尿病杂志, 2025,17(1): 16-139.

04 创新性 独特分子结构，带来更优选择¹⁻³

注册分类：化学药品3类（仿制药）



独特分子结构

小分子、低亲脂性、非共价结合，各类肝损
PK 参数基本稳定



安全

蓄积风险低、各类肝损可用、低血糖风险极低、无黑框警告



更高靶点抑制效率

E_{max} 97.8%，用药 1 周靶点结合率仍达
80%



有效

整周平稳控糖，HbA1c 达标更稳定，血糖波动与低血糖更低



提高依从性

半衰期 38.44h，首个实现每周一次给药的口
服降糖药



有效

年服药 365→52 次，年服药次数减少 313 次，减少漏服、血糖更
平稳



完成中国 III 期

填补中国人群循证空白



有效·安全

在中国患者中验证显著降糖疗效与优越安全性

1. 曲格列汀中国 III 期临床研究.; 2. 琥珀酸曲格列汀片说明书.; 3. 中国医院药学杂志, 2023, 43(15): 1746-1751.

05 公平性 弥补目录空白，周制剂提升依从性与特殊人群可及性

周制剂的核心价值



提升依从性

每周一次，年服药 365→52 次，显著降低漏服与血糖波动



惠及特殊人群

各类肝损PK参数稳定、老年低血糖风险极低，满足特殊参保人群刚需



弥补目录内无单周口服降糖药空白¹

国内首个糖尿病DPP-4i单周口服制剂，疗效与目录内DPP-4i双周口服制剂相当



弥补中重度肝损患者无长效口服制剂空白²

曲格列汀是适用于肝功能不全患者的口服降糖长效制剂



降低临床管理难度³

用法用量明确，每周一次，适应症明确，无滥用或超说明书用药风险

对公共健康保障的意义

改善依从性 → 减少并发症 → 降低长期医疗卫生支出；助力实现 “健康中国 2030” 糖尿病管理目标，满足特殊参保人员基本用药需求。

1.国家医保目录(2024年).

2.中华糖尿病杂志, 2025, 17(1): 16-139.

3.琥珀酸曲格列汀片说明书.