

国家化学药品**2.1 2.2 2.4**类

醋酸伏诺拉生注射用浓溶液

全球首个P-CAB注射剂，**速效强效长效**抑酸
消化性溃疡出血患者新型抑酸药治疗，合理用药**更高效**的选择

企业：江苏柯菲平医药股份有限公司

MAH：南京柯创制药有限公司

目录

CONTENTS

01 药品基本信息

醋酸伏诺拉生注射用浓溶液是化学药品**2.1 2.2 2.4类**
消化性溃疡出血患者需**更快速更强效更持久抑酸**，提供了新型P-CAB的治疗选择

02 安全性

安全性优，静脉治疗阶段的不良反应发生率比艾司奥美拉唑钠**显著降低44%**
导致停药及导致退出患者数更少

03 有效性

抑酸较口服片剂更快更强，45min快速达峰，**首次给药后24hpH > 6持续时间90%**，高于抑酸治疗标准（标准为pH>6 持续时间>83%），抑酸较艾普拉唑钠更持久稳定，给药后72h未再出血率高达99.26%

04 创新性

全球首个P-CAB针剂，提升抑酸质量，满足消化性溃疡出血患者**速效强效长效**治疗需求
中国自主知识产权新药，创新改良酸根为醋酸盐，溶解性更好，仅需100ml溶媒，安全性提升

05 公平性

满足临床治疗抑酸需求，诊断标准明确，每天1次30min静滴给药，**无需负荷剂量或持续泵滴**，易于药事管理，为合理用药提供**更高效选择**

药品通用名	醋酸伏诺拉生注射用浓溶液	中国大陆首次上市时间	独家 2026年06月
注册规格	2ml : 10mg (按C ₁₇ H ₁₆ FN ₃ O ₂ S计)	注册分类	化学药品2.1类2.2类2.4类 ^[2]
说明书适应症	消化性溃疡出血	是否为OTC药品	否
用法用量	静脉滴注。用于经内镜治疗的消化性溃疡急性出血成人患者，本品20mg溶于100mL的0.9%氯化钠或者5%葡萄糖溶液中，滴注时间30min，每日给药1次，连续用药3天。静脉治疗期结束后应进行口服抑酸治疗 ^[1] 。	专利情况	1项发明专利 ^[3]
目前大陆地区同通用名药品的上市情况	无	全球首个上市国家/地区及上市时间	中国 2026年06月
作用机制	为钾离子竞争性酸阻滞剂（P-CAB），与PPI相比，在强酸性环境中较为稳定，可以高度富集在壁细胞泌酸小管H ⁺ -K ⁺ -ATP酶的管腔侧表面，迅速质子化，以离子的形式非共价结合并抑制H ⁺ -K ⁺ -ATP酶，实现长期有效的胃酸控制 ^[4] 。		

1. 醋酸伏诺拉生注射用浓溶液说明书.

2. 药品注册批件.

3. 发明专利证书ZL201610781048.X.

4. 王耀振,等. 钾离子竞争性酸阻滞剂的药学特征研究进展, 2024.

参照药：注射用艾普拉唑钠

- 1.最新一代PPI注射剂型产品
- 2.进入国家医保目录产品
- 3.两款药物均获批消化性溃疡出血的适应症

醋酸伏诺拉生的优势

1.提升抑酸质量的新选择：

醋酸伏诺拉生45min达峰^[1]，首次给药后24h pH > 6 持续时间90%^[1]，**高于抑酸治疗标准（标准为pH>6 持续时间>83%）**，给药后72h未再出血率**99.26%**^[2]，速效强效。

2.有效降低夜酸突破：

醋酸伏诺拉生给药后第1天夜间pH>6持续时间**89.3%**，艾普拉唑钠仅为**52.6%**^[1]，**夜间抑酸效果显著优于艾普拉唑钠。**

3.安全性优，抗栓药物联用更放心：醋酸伏诺拉生静脉治疗阶段**不良反应发生率比PPI下降44%**^[2]，不受CYP2C19基因多态性影响，**与抗板抗凝等药物联用更放心**^[3]。

4.简便给药降低医护负担^[2]：醋酸伏诺拉生每天1次给药20mg静滴30min，**无需负荷剂量或持续泵滴，降低持续输注不适，减少医疗护理及成本负担。**

1.H009注射液单次给药在健康成年受试者中的安全性、耐受性和药代动力学/药效学的Ib期临床研究.

2.一项多中心、随机、双盲、阳性药平行对照的III期临床研究评价H009注射液用于急性胃和/或十二指肠溃疡引起的上消化道出血经内镜治疗后降低再出血风险的有效性和安全性.

3.王耀振,等.钾离子竞争性酸阻滞剂的药学特征研究进展,2024.

疾病基本情况

1. 溃疡及出血的反复发作背后是病因与抑酸质量的双重挑战，需更高效的治疗方案：

- 氯吡格雷等抗血小板药物、糖皮质激素、肿瘤化疗药物等应用，使溃疡出血风险增加38%-59%^[1]，是疾病再复发率高的主要病因。
- 反复发作背后是病因与抑酸质量的双重挑战^[2]。

2. 长期抗板、抗凝、肿瘤化疗等患者，药物联用有禁忌：

- PPI主要经CYP2C19代谢，与抗板抗凝等药物联用有禁忌^[3]（如降低氯吡格雷疗效、增加心血管事件风险，被美国FDA 黑框警告联合用药需谨慎）。

未被满足的需求

1. 消化性溃疡出血需要静脉抑酸治疗

- 患者呕血、吞咽障碍、意识差，无法口服给药，必须静脉给药快速抑酸。
- 内镜治疗术前/术后至止血后需禁食禁水，不能口服，针剂是唯一给药途径。

2. 现有治疗抑酸质量不达标，夜间酸突破明显：

- 消化性溃疡出血抑酸标准为pH > 6持续时间83%^[4]，艾普拉唑钠给药后第1间夜pH > 6 持续时间仅为52.6%^[5]，治疗期间存在夜间酸突破，时间长可使消化性溃疡难愈和诱发溃疡出血。
- 夜间酸突破首选治疗对策通过加大 PPI 剂量，如首剂负荷剂量或持续静脉滴注，导致用药繁琐，且长时间占用静脉通道，增加合并用药风险。

3. 药物相互作用风险，选择药物需谨慎：

- 其他PPI主要经CYP2C19代谢。因奥美拉唑、艾司奥美拉唑抑制CYP2C19活性，降低氯吡格雷疗效、增加心血管事件风险，被美国FDA 黑框警告。

1.急性非静脉曲张性上消化道出血多学科防治专家共识(2019版).

2.Yaser M Alsinari, et al. Cureus. 2022.

3.王耀振,等.钾离子竞争性酸阻滞剂的药理学特征研究进展,2024.

4.袁耀宗. 酸相关性疾病的抑酸标准及抑酸药物选择,2023.

5.H009注射液单次给药在健康成年受试者中的安全性、耐受性和药代动力学/药效学的Ib期临床研究.

安全性更优，静脉治疗阶段的不良反应发生率显著降低44%，导致停药及导致退出患者数更少

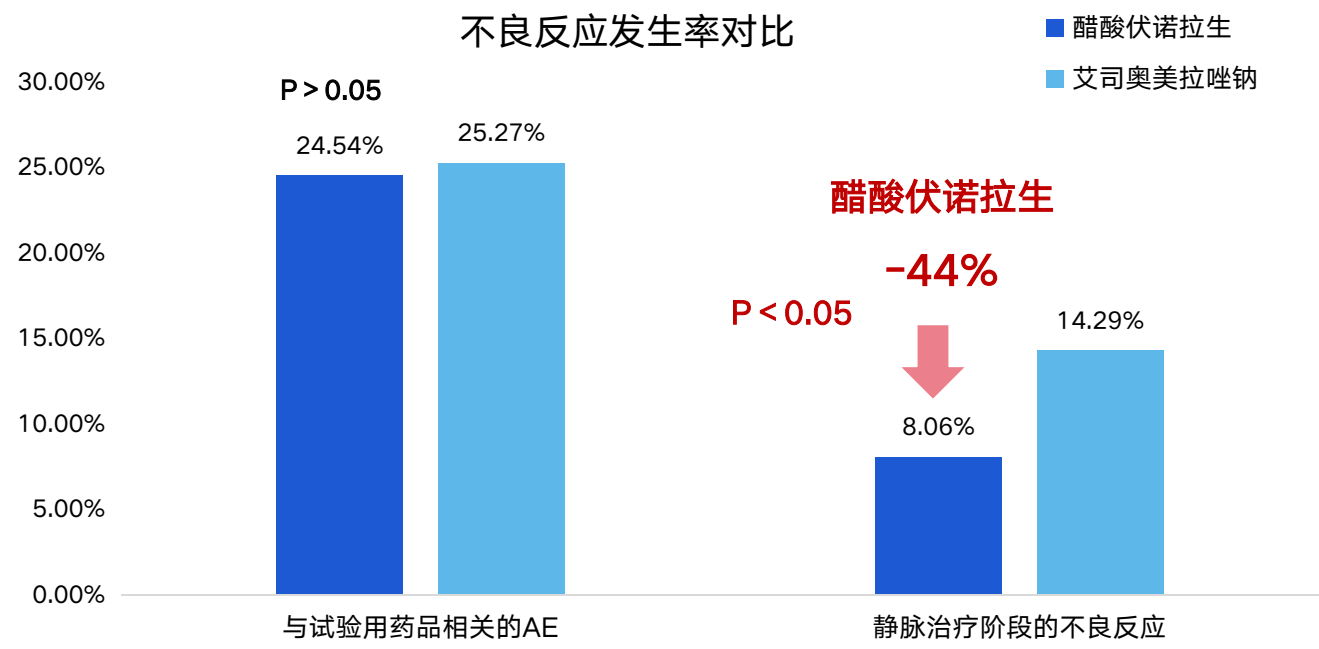


图 醋酸伏诺拉生III期临床研究不良反应发生率对比

治疗期间与醋酸伏诺拉生注射用浓溶液相关的AE，发生率>1%的有：尿中尿胆原增加(4.40%)、天门冬氨酸氨基转移酶升高(2.93%)、丙氨酸氨基转移酶升高(2.56%)、高尿酸血症(2.56%)、血胆红素升高(2.20%)、白细胞计数降低(1.83%)、肝功能异常(1.47%)、中性粒细胞计数降低(1.10%)、尿蛋白检出(1.10%)、肝酶升高(1.10%)、血肌酐升高(1.10%)、发热(1.10%)。研究中无发生率≥5%的与试验药物 H009注射液相关的AE。

表 醋酸伏诺拉生 III期临床研究不良事件对比

具体指标	醋酸伏诺拉生	艾司奥美拉唑钠
严重不良事件 (SAE)	0例	3例 (1.10%)
导致退出的AE	0例	2例 (0.73%)
导致暂时停药的AE	1例 (0.37%)	2例 (0.73%)
导致停止用药的AE	0例	3例 (1.10%)
特别关注的不良事件 (AESI)	4例 (1.47%)	5例 (1.83%)

一项多中心、随机、双盲、阳性药平行对照的III期临床研究评价 H009注射液用于急性胃和/或十二指肠溃疡引起的上消化道出血内镜治疗后降低再出血风险的有效性和安全性。

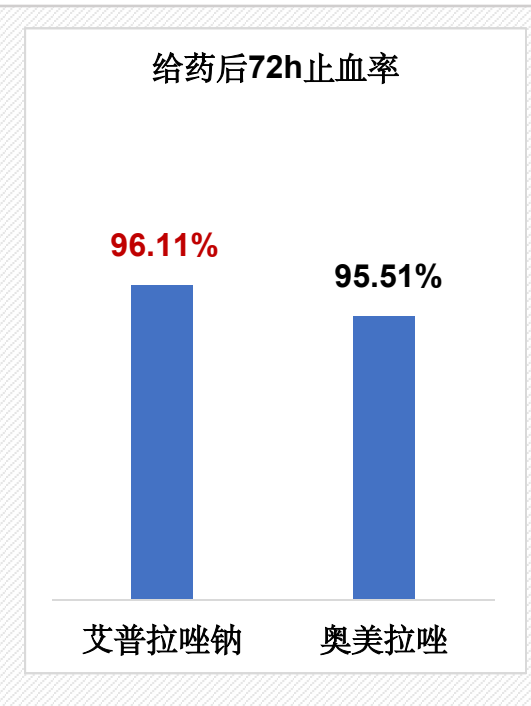
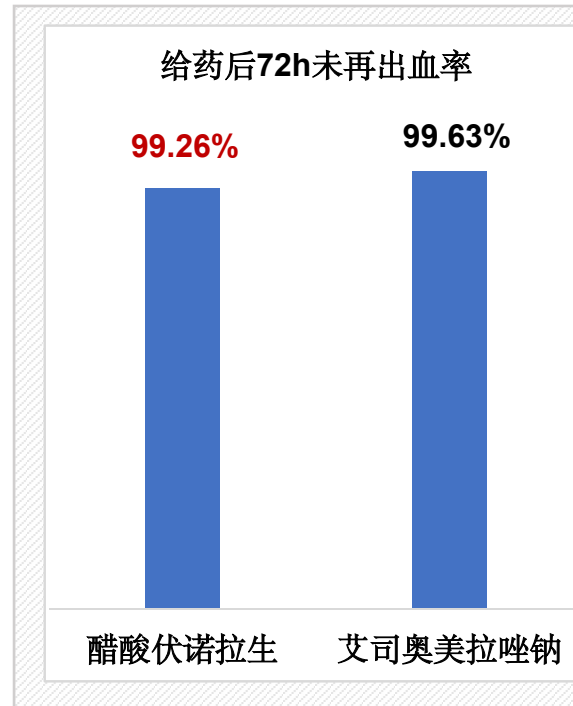
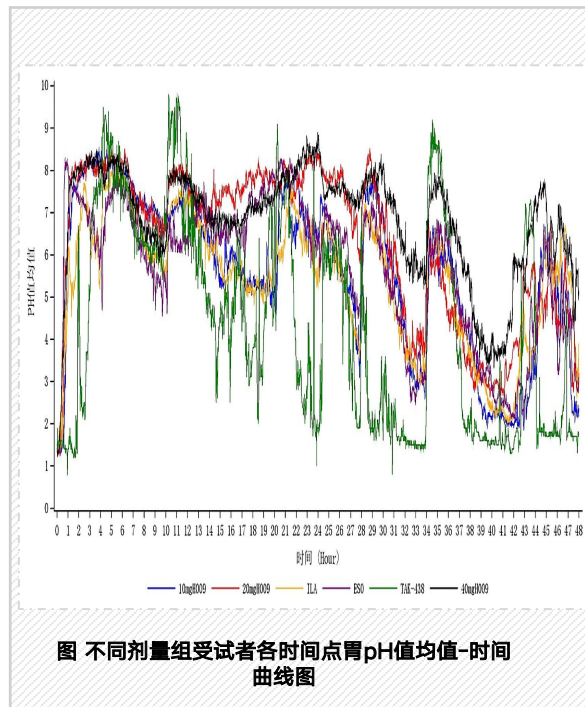
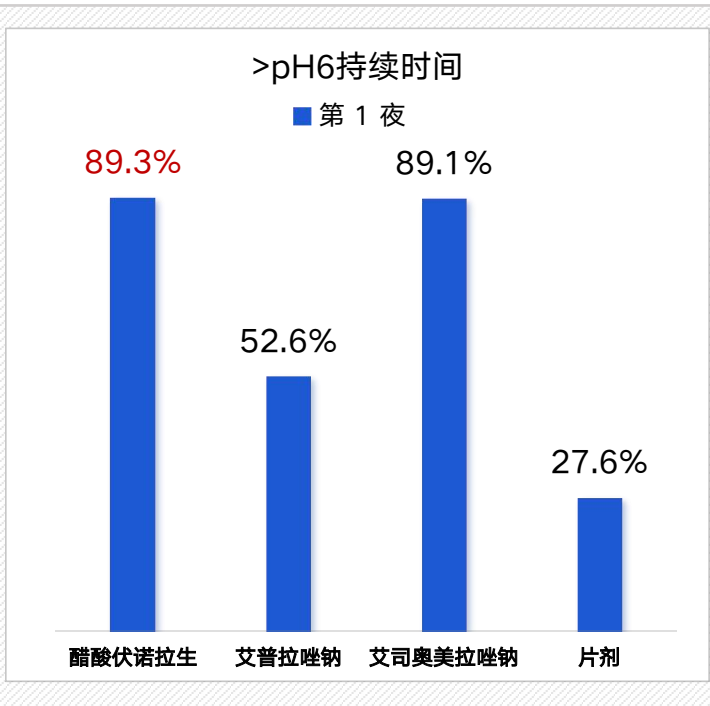
比艾普拉唑钠夜间抑酸效果更优，抑酸更稳定 72h未再出血率高达99.26%，治疗表现佳



✓ 夜间抑酸持续时间**89.3%**，
优于艾普拉唑钠**52.6%**[1]

✓ 抑酸波动小，抑酸稳定性**优于艾普拉唑钠**[1]

✓ **醋酸伏诺拉生72h未再出血率高达99.26%**[2]
✓ 艾普拉唑钠为**96.11%**[3]



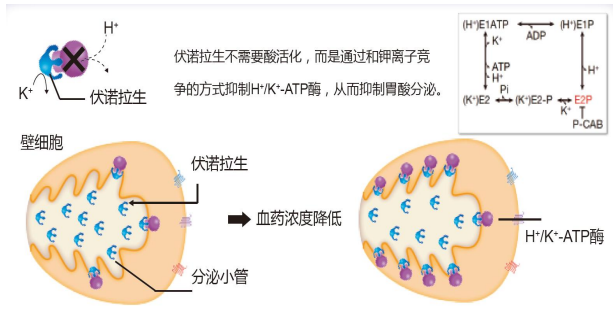
H009组：醋酸伏诺拉生注射用浓溶液20mg，ILA组：注射用艾普拉唑钠20mg，ESO组：注射用艾司奥美拉唑钠40mg*2，TAK-438组：富马酸伏诺拉生片10mg

*.非头对头比较，本品与艾普拉唑比较数据均来自中国注册III期临床注册研究

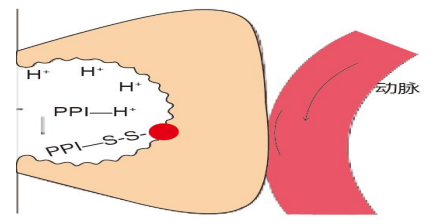
1.H009注射液单次给药在健康成年受试者中的安全性、耐受性和药代动力学/药效学的Ib期临床研究。
 2.一项多中心、随机、双盲、阳性药平行对照的III期临床研究评价H009注射液用于急性胃和/或十二指肠溃疡引起的上消化道出血内镜治疗后降低再出血风险的有效性和安全性。
 3.注射用艾普拉唑钠治疗消化性溃疡出血的多中心、随机、双盲、阳性药物平行对照III期临床研究。

✓ 抑酸更快更强：
P-CAB 注射液结合靶点不需酸活化，同时抑制静息和激活状态
PPI注射液：需酸激活，仅抑制激活状态

P-CAB: 无需酸性环境即可被激活，通过K⁺竞争性、可逆性的方式与H⁺、K⁺-ATP酶非共价结合，对酸稳定，同时抑制静息和激活状态的H⁺、K⁺-ATP酶^[1]。顶叶细胞腔隙内浓度较高(比血浆高 10 万倍)

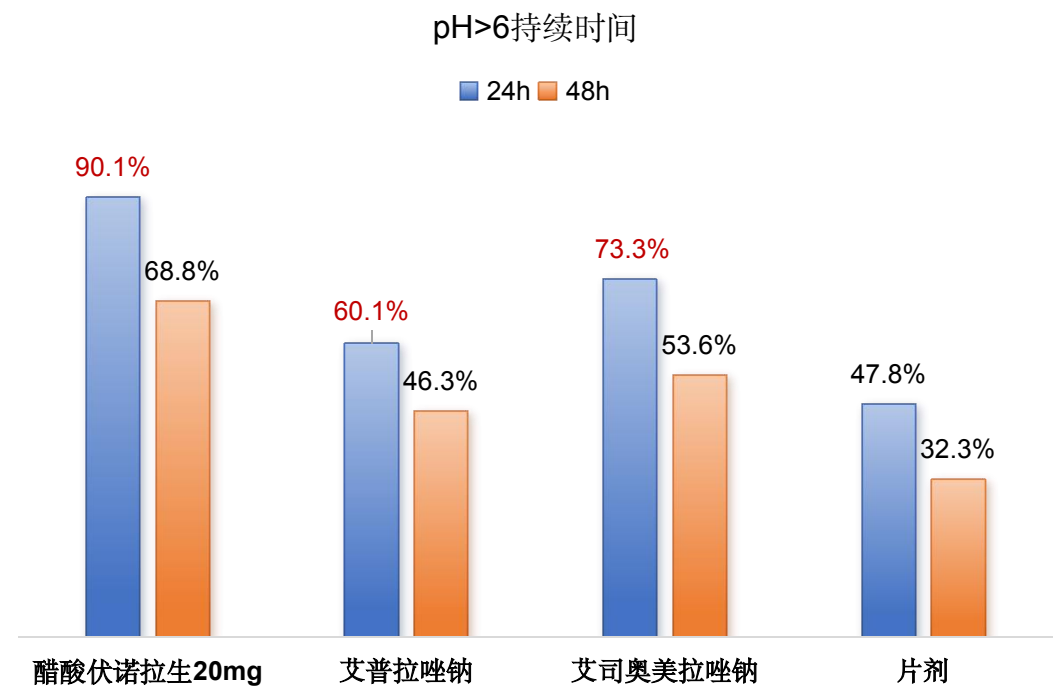


PPI: 需在酸性环境下被活化，不可逆地与H⁺、K⁺-ATP酶共价结合，对酸不稳定，仅抑制激活状态的H⁺、K⁺-ATP酶^[1]。顶叶细胞腔隙内浓度较低(比血浆高 1000 倍)。



P-CAB: 钾离子竞争性酸阻滞剂，PPI: 质子泵抑制剂

✓ 抑酸更持久：
本品给药后24h、48h，pH > 6 持续时间为90.1%、68.8% 优于艾普拉唑钠60.1%与艾司奥美拉唑钠73.3%^[2]



1.王耀振,等.钾离子竞争性酸阻滞剂的药学特征研究进展,2024.
2.H009注射液单次给药在健康成年受试者中的安全性、耐受性和药代动力学/药效学的Ib期临床研究.

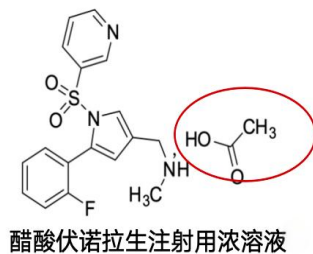
创新改良酸根为醋酸盐，增加了**水溶性**，提升药物**稳定性及安全性**，**不良反应降低44%**，适应症覆盖消化性溃疡出血患者

选定A晶型进行CMC开发 晶型专利期到2036年08月^[1]



HA	分子式	溶解度 (g/10ml)
富马酸	461.46	<0.01
磷酸	394.39	<0.33 (溶解)
甲磺酸	537.39	>1.7 (易溶)
醋酸	405.44	>3.3 (易溶)

优化盐型：富马酸根-醋酸根



- 突破技术壁垒，开发醋酸盐选定A晶型，提升**水溶性**，**稳定性及安全性**，成功研发首款P-CAB注射剂^[1]；
原研为武田的富马酸伏诺拉生，**富马酸化合物的水溶性差**，早期注射剂 专利申请多依赖环糊精包合增溶，**并辅以复杂辅料等助剂**，带来**溶血、肾毒性、生产工艺繁琐**等隐患，难以实现终端灭菌。
- ✓ 本品克服现有不足，提供了**水溶性与稳定性较好的5 - (2 - 氟苯基) - N - 甲基 - 1 - (3 - 吡啶基磺酰基) - 1H - 吡咯 - 3 - 甲氨醋酸盐**，选定A晶型，具有更好的抗热抗湿度的稳定性，对光照及UV光的耐受性，成功研发出**首款P-CAB注射剂**，覆盖消化性溃疡出血适应症。

- 本品升级醋酸根，天然无蓄积，提升了临床应用的**安全性**：
代谢天然温和无蓄积^[2]：醋酸根属于人体内源性代谢物质，最终彻底氧化分解为二氧化碳与水，代谢途径天然温和，无体内蓄积风险与潜在毒性。**醋酸伏诺拉生III期临床研究静脉期间不良反应发生率降低44%**^[2]。
- 本品具有**节俭液体**，**简便给药**，**溶媒灵活优势**，惠及更多患者：
本品仅需100ml 溶媒，可与0.9%氯化钠、5%葡萄糖注射液稳定配伍^[4]，配置灵活且有助于液体管理^[2]，适配院内**不同溶媒配制**的临床需求场景。

1.发明专利证书ZL201610781048.X.

2.Shree Bose,et al.Acetate Metabolism in Physiology, Cancer, and Beyond,2020.

3.一项多中心、随机、双盲、阳性药平行对照的III期临床研究评价 H009注射液用于急性胃和/或十二指肠溃疡引起的上消化道出血内镜治疗后降低再出血风险的有效性和安全性.

4.醋酸伏诺拉生注射用浓溶液说明书.

每日仅需1次20mg，30min静滴，疗效等同大剂量静脉方案，带来更高效简便的治疗选择



3天治疗期间静脉输注时间：



01	02	03	04
药物联用风险低： 避免大剂量持续输注，不长期占用静脉通道，静脉联用风险低	操作更方便： 无需使用输液泵； 无需起始负荷剂量	溶媒更灵活，满足需求： 0.9%氯化钠或5%葡萄糖溶液	便于管理，提升效率： 减少医护人员的操作次数，降低操作难度，易于管理

治疗方案对比-3天静脉治疗周期

本品 醋酸伏诺拉生：10mg*2*3=60mg (无需泵) [1]

- 给药剂量：20mg，每24h使用1次，30min完成输注，连续使用3天
- 本品20mg溶于100ml的0.9%氯化钠或者5%葡萄糖溶液中

PPI 大剂量静脉PPI方案一：
80mg30min+后以8mg/h滴71.5h=652mg (808方案-需泵) [2]

- 给药剂量：80mg静脉注射，持续时间30min，然后以8mg/h需持续滴注71.5h，溶于100ml的0.9%氯化钠溶液中

PPI 大剂量静脉PPI方案二：
20mg60min+后以20mg/200ml*10ml/h滴72h=92mg^[3]
(需带过滤装置输液器，配液后需3小时内使用完毕)

- 给药剂量：起始剂量20mg需溶于200ml0.9%氯化钠溶液中，1次/d，滴注60min，之后以10ml/h持续滴注72h
- 配置好后需要3小时内使用完毕。
- 配液中不能与其他药物在同一输液装置中应用

1.一项多中心、随机、双盲、阳性药平行对照的III期临床研究评价H009注射液用于急性胃和/或十二指肠溃疡引起的上消化道出血经内镜治疗后降低再出血风险的有效性和安全性
 2.急性非静脉曲张性上消化道出血多学科防治专家共识(2019版).
 3.黎舫.艾普拉唑钠与艾司奥美拉唑钠治疗消化性溃疡出血患者的效果比较,2024.

01 提升救治效能

- 溃疡及出血的反复发作背后是病因与**抑酸质量**的双重挑战，需新的选择方案。本品能达标抑酸，有效降低夜酸突破，**未再出血率高达99.26%^[1]**，提升国内上消化道出血救治效能。

02 弥补临床空白

- 富马酸伏诺拉生片在临床被广泛认可，**本品为全球首款P-CAB针剂**，有效提升抑酸质量^[2]，为临床填补了**无法口服、需要禁食禁水**患者的治疗需求，适应症覆盖消化性溃疡出血患者，为临床提供了新选择。
- **醋酸根改良水溶性、稳定性及安全性提升^[3]**，溶媒配置更少更灵活，满足不同患者治疗选择需求。

03 符合“保基本”原则

- 速效长效强效抑酸效果^[4]、**提升抑酸质量，3天高效降低再出血风险，未再出血率高达99.26%^[1]**，**缩短住院时间**，符合国家医保控费与优化医疗资源使用的基本原则。

04 便于临床管理

- 本品说明书规定了明确的适应症，剂量和疗程^[5]，安全性更优。给药方式简便，无需负荷剂量或持续泵入，方便用药管理，**降低药事管理难度，提供了更高效的治疗选择。**

1. 一项多中心、随机、双盲、阳性药平行对照的III期临床研究评价H009注射液用于急性胃和/或十二指肠溃疡引起的上消化道出血经内镜治疗后降低再出血风险的有效性和安全性。
2. 王耀振,等.钾离子竞争性酸阻滞剂的药学特征研究进展,2024.

3. Shree Bose, et al. Acetate Metabolism in Physiology, Cancer, and Beyond, 2020.
4. H009注射液单次给药在健康成年受试者中的安全性、耐受性和药代动力学/药效学的Ib期临床研究。
5. 醋酸伏诺拉生注射用浓溶液说明书。