

苹果酸司妥吉仑片 (信妥安®)

- ✓ 中国高血压领域12年来**唯一**获批上市的**1类新药**
- ✓ 中国**唯一**原研直接肾素抑制剂，**填补医保目录机制空白**



申报企业：上海上药信谊药厂有限公司

目录 CONTENTS

01 基本信息

- 12年来高血压领域**唯一**获批**1类新药**

02 创新性

- **全新化合物**直接肾素抑制剂，源头阻断肾素-血管紧张素-醛固酮系统（RAAS），肾素亲和力强

03 安全性

- **未见**咳嗽、血管神经性水肿等RAAS抑制剂**常见不良反应**，**避免**体内蓄积

04 有效性

- **持续稳定降压**，**额外靶器官保护**

05 公平性

- **新作用机制**降压药，**填补目录机制空白**，丰富用药选择

中国12年来高血压领域唯一获批1类新药，填补医保目录机制空白

基本信息1/2

申报目录类别	基本医保目录		
通用名	苹果酸司妥吉仑片		
商品名	信妥安®		
注册规格	50mg	注册分类	化学药品1类
适应症	原发性高血压		
用法用量	<ul style="list-style-type: none">推荐剂量：本品100 mg，口服，每日一次。可以在空腹或餐后服用		
核心化合物专利	<ul style="list-style-type: none">核心化合物专利名称：含氮的饱和杂环化合物核心化合物专利有效期：2032年		
中国获批时间	2025-12-03	是否为OTC药品	否
全球首次上市时间 (国家/地区)	2025-12-03 (中国大陆)	目前大陆地区 同通用名药品 的上市情况	无 (独家)

参照药选择建议：缬沙坦胶囊 (代文®)

选择理由：

- ① II/III期临床试验对照药
- ② 临床广泛应用
- ③ 同为肾素-血管紧张素-醛固酮系统 (RAAS) 抑制剂

与参照药相比的优势：

- ① 本品直接抑制肾素活性，特异性阻断RAAS起始环节，从**源头**实现**降压**作用，克服血管紧张素II与醛固酮逃逸
- ② 总体**不良反应发生率**低于缬沙坦胶囊 (代文®)

高血压疾病负担重



患病人数多^[1] **2.45亿**



治疗率低^[2] **38.7%**



控制率低^[2] **12.9%**

高血压是心、脑、肾等靶器官损伤的重要危险因素，高血压中高肾素患者占19.6%^[3]

临床存在未满足需求

肾素-血管紧张素系统相关药物三大短板：

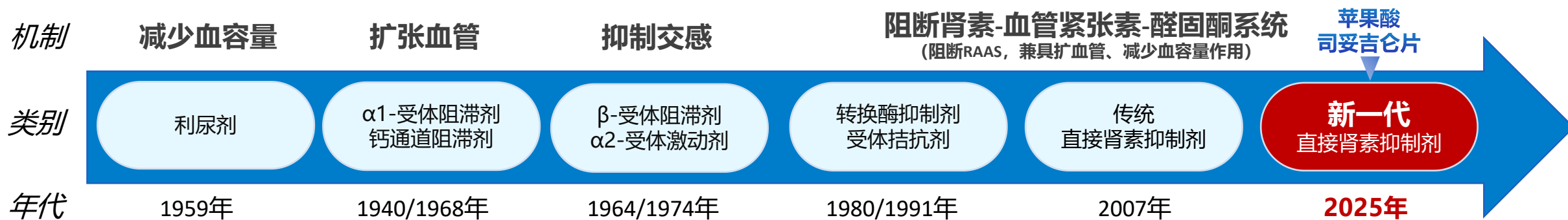
- 转换酶抑制剂 → 咳嗽、血管性水肿
- 受体拮抗剂 → 血管紧张素 II / 醛固酮逃逸（“肾素突破”）
- 传统肾素抑制剂 → 生物利用度低、体内蓄积

亟需多元化治疗选择

高血压病因复杂、多机制并存

新机制新靶点药物丰富治疗选择

高血压发病机制的认知进步，推动降压药物的研发进程



[1] 中华医学会心血管病学分会. 中华心血管病杂志, 2024, 52(09):985-1032. [2] 国家心血管病中心. 中国心血管健康与疾病报告2024[M]. 北京: 中国协和医科大学出版社, 2025. [3] NAKAYAMA M, et al. Hypertension Research, 2026.

荣获国家重大新药创制支持

12年来高血压领域唯一获批1类新药

中国唯一原研直接肾素抑制剂

全球第二个直接肾素抑制剂

拥有7项化合物、用途、制备方法专利

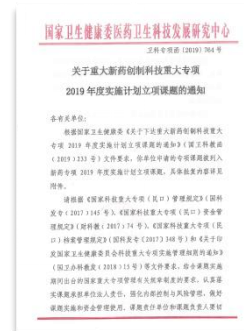
苹果酸司妥吉仑片拥有**7项**发明专利



本品核心化合物专利
有效期至 2032年

- 含氮的饱和杂环化合物
- 吗啉衍生物的盐及其晶型、制备方法及其药物组合、用途
- 新型肾素抑制剂
- 吗啉衍生物

从国家到地方获多层次科研专项支持



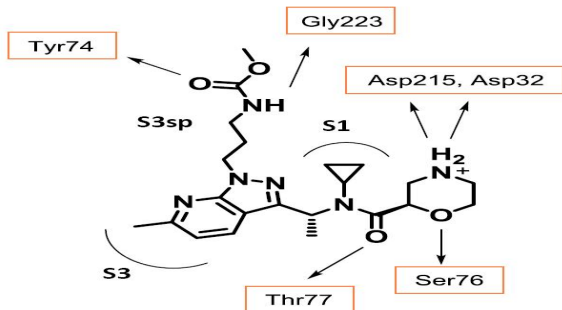
- **重大新药创制国家科技重大专项**
- 科技部国际科技合作专项
- 上海市科技支撑
- 上海市优秀技术带头人计划
- 上海市国际科技合作基金项目
- 上海市浦东新区支持生物医药产业高质量发展专项

三重分子机制，源头阻断通路，稳定降压

创新性2/2

三重分子机制

特异、强效、持久抑制肾素，稳定降压



司妥吉仑结构示意图

“定位准”

S1、S3等口袋通过刚性构象固定药物形态，药物与肾素结合更牢固；

匹配度高
特异性强

“抓得牢”

吗啡啉环氮原子与肾素Asp32与Asp215作用，肾素抑制更强；

强效降压
避免肾素逃逸

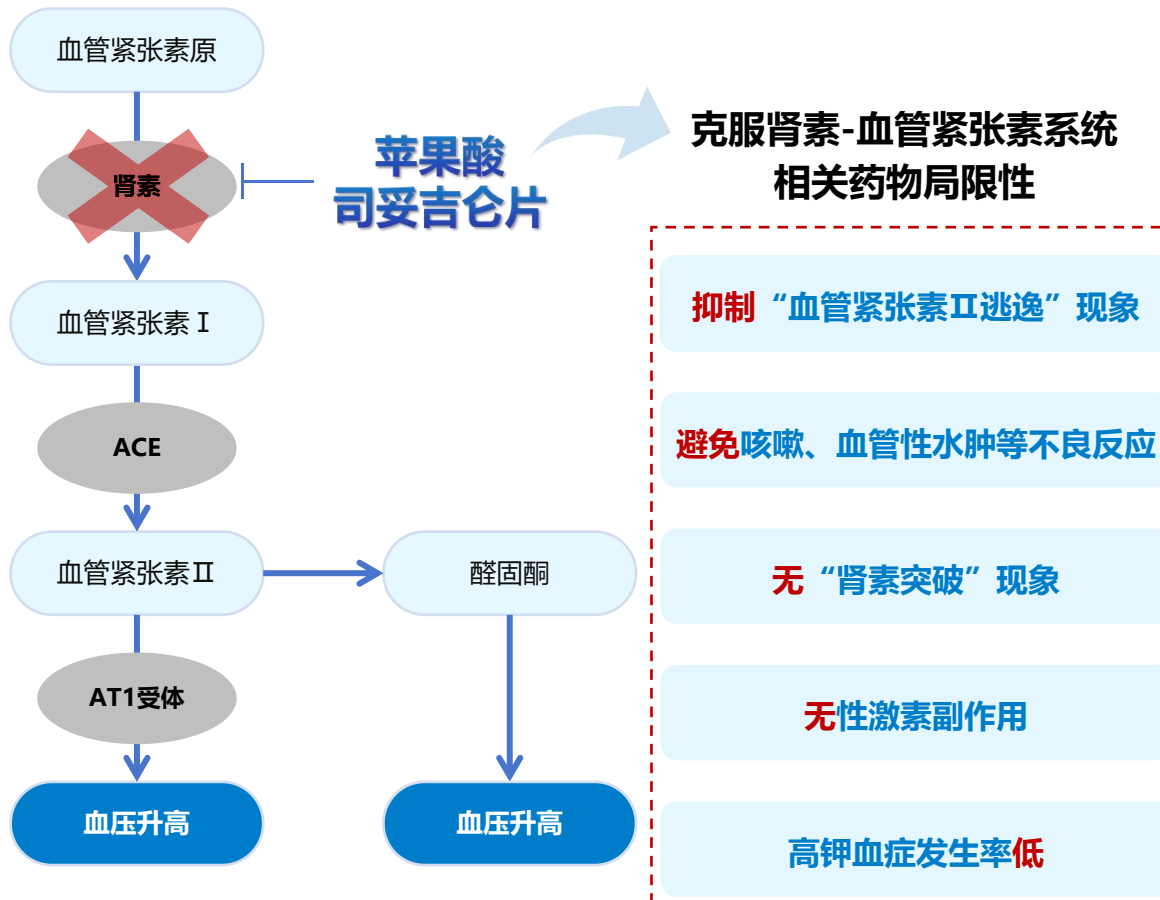
“缠得紧”

吗啡啉环氧原子与丝氨酸残基形成氢键，肾素结合更紧密。

亲和力高
结合持久

源头阻断RAAS

额外靶器官保护，避免不良反应



安全性优，无多种常见不良反应（咳嗽、血管神经性水肿、腹泻、皮疹等）

安全性

不良反应	直接肾素抑制剂		血管紧张素II受体拮抗剂 ^[2]	血管紧张素转换酶抑制剂 ^[2]
	苹果酸司妥吉仑片 ^[1]	传统直接肾素抑制剂 ^[2]		
血钾升高	0.2%	3.6%	3.3%	1.9%
血管神经性水肿	无	0.4%	0.0%	0.5%
咳嗽	无	3.9%	1.9%	12.0%
皮疹	无	0.9%	0.6%	0.5%
低血压	0.2%	7.6%	4.5%	9.1%
腹泻	无	4.6%	5.8%	3.8%
肾功能损伤	无	0.4%	0.6%	0.3%

可避免药物体内蓄积^[3]

- 苹果酸司妥吉仑片连续给药7天后药代参数比较**无明显差异**。
- 传统直接肾素抑制剂7天内血药浓度时间曲线下面积**几乎翻倍**。

说明书收载的安全性信息^[3]

- 本品耐受性好，不良反应多为**一过性**、程度轻至中度，**患者通常可自行缓解**。
- 本品药物相关不良反应发生率仅0.6%。
- **未见**咳嗽、血管神经性水肿、腹泻、皮疹等RAAS系统常见不良反应发生。高血钾症**发生率低**。

生物利用度高，血浆肾素活性 (PRA) 抑制能力强，降压效果强效、持久

有效性1/3

非肽类小分子，生物利用度更高^[1,2]

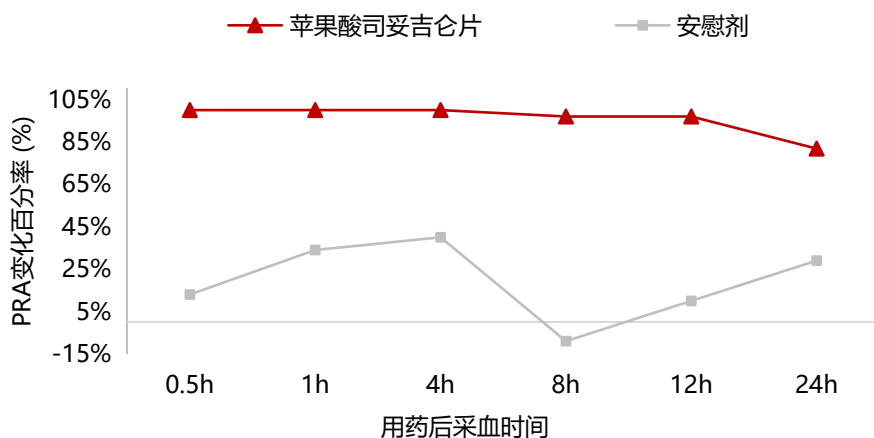
游离碱分子量 (道尔顿)	444.53 (<500)	vs	551.8 (>500)	生物利用度 (%)	>20% (提高10倍)	vs	2-3%
	苹果酸司妥吉仑片		传统直接肾素抑制剂		苹果酸司妥吉仑片		传统直接肾素抑制剂

血浆肾素活性 (PRA) 抑制能力强

PRA 升高可独立增加心衰不良事件及糖尿病合并高血压人群的肾损伤风险。^[3-4]

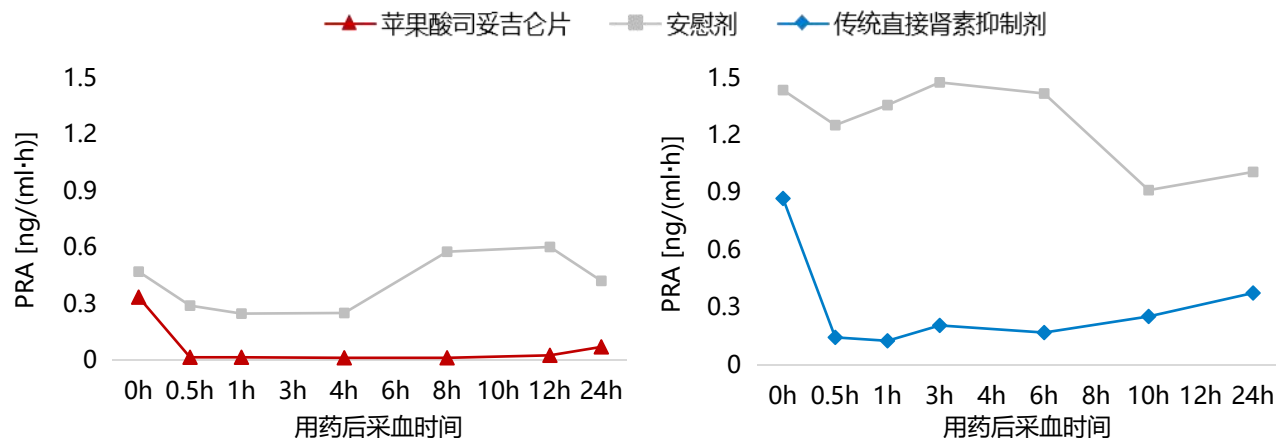
强效

苹果酸司妥吉仑片抑制PRA达到**90%**以上



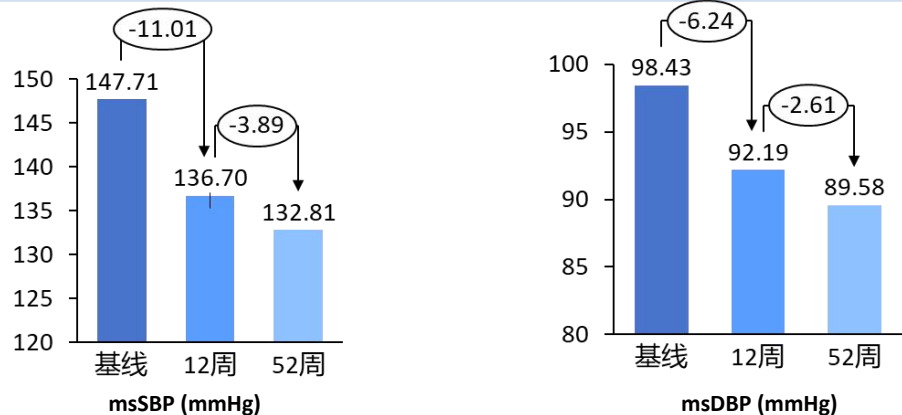
持久

苹果酸司妥吉仑片持续**24h**抑制PRA



III期临床试验

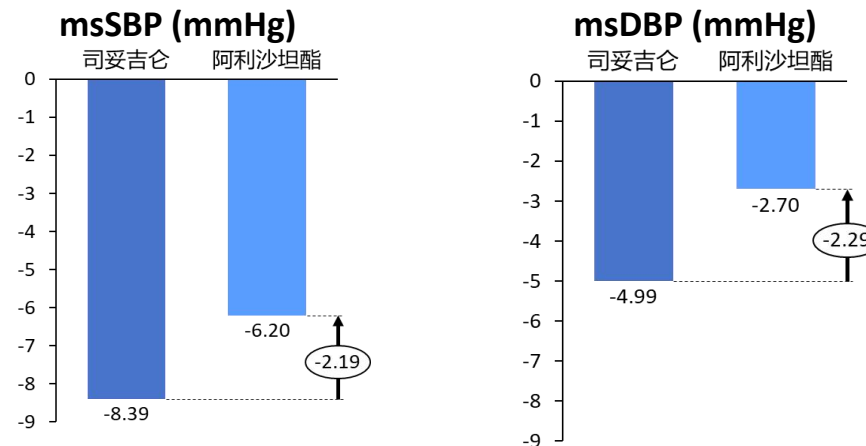
苹果酸司妥吉仑片12周、52周收缩压与舒张压较基线明显降低^[1]



观察时长	效果指标	RR值 (司妥吉仑 VS 缬沙坦)	研究结论
12周	降压有效率	1.03 (RR值>1)	有效率 优于 缬沙坦； 达标率与缬沙坦相当
	降压达标率	1.00 (RR值=1)	
观察时长	效果指标	RR值 (司妥吉仑 VS 缬沙坦转司妥吉仑)	研究结论
52周	降压有效率	1.02 (RR值>1)	有效率和达标率均 优于 缬沙坦转司妥吉仑
	降压达标率	1.23 (RR值>1)	

MAIC结果

苹果酸司妥吉仑片相比阿利沙坦酯片降低收缩压与舒张压更优^[2]



本品是继阿利沙坦酯片后
中国高血压领域12年来唯一获批上市的1类新药

文献表明：血压每多下降2 mmHg^[3]

脑卒中
死亡风险下降

10%

缺血性心脏病
死亡风险下降




7%

[1] 评价SPH3127片治疗原发性轻、中度高血压有效性和安全性的多中心、随机、双盲、双模拟、阳性药平行对照III期临床试验. [2] MAIC结果. [3] 郑小蓉, 林金秀. 中华高血压杂志, 2009, 17(12): 1136-1139.
注：平均坐位舒张压 (msDBP); 平均坐位收缩压 (msSBP)

国内外权威指南推荐，可为特殊人群带来多重获益

有效性3/3

国内外
权威指南推荐

指南名称	指南推荐内容
中国高血压防治指南 (2024年修订版) ^[1]  中国高血压联盟	直接肾素抑制剂直接抑制肾素，减少血管紧张素II产生，显著降低患者血压水平，其他主要包括降低血浆肾素活性、阻断肾素/肾素原受体，减少血管紧张素II产生。
ACC/AHA 指南 (2025) ^[2]  AMERICAN COLLEGE OF CARDIOLOGY.	直接肾素抑制剂可对噻嗪类利尿剂、血管紧张素酶抑制剂、血管紧张素II受体拮抗剂和二氢吡啶类钙通道阻滞剂药物进行有效替代。
ESH 指南 (2023) ^[3]  European Society of Hypertension	直接肾素抑制剂，当单独使用或与利尿剂或钙通道阻滞剂联合使用时，是一种强效且长效的降压药物。

发表时间

研究内容

直接肾素抑制剂
在单药与联合治
疗中为特殊人群
带来多重获益

- | | |
|------|--|
| 2025 | <ul style="list-style-type: none">单药治疗：高血压合并2型糖尿病的患者，附加使用直接肾素抑制剂时，能更大程度降低微量白蛋白尿和收缩压^[4]单药治疗：直接肾素抑制剂在降低微量白蛋白尿方面比血管紧张素II受体拮抗剂更优^[4]单药治疗：肥胖高血压男性患者中，直接肾素抑制剂不仅能降低平均动脉压，还能独特地降低蛋白尿和滤过分数^[4] |
| 2023 | <ul style="list-style-type: none">联合治疗：直接肾素抑制剂单用或与钙通道阻滞剂联用时，可强效且长效的降压^[2]； |
| 2020 | <ul style="list-style-type: none">单药治疗：直接肾素抑制剂不良事件的数量或严重程度与安慰剂无显著差异^[5] |
| 2017 | <ul style="list-style-type: none">单药治疗：部分研究表明，直接肾素抑制剂具有上级降压作用，血压控制率高于雷米普利^[6]联合治疗：噻嗪类利尿剂联用直接肾素抑制剂后，耐受性相似，降压效果更显著，血压控制率更佳^[6] |

未来展望

苹果酸司妥吉仑片计划开展IV期临床试验与真实世界研究，未来将会补充更多临床证据。

[1]中国高血压防治指南(2024年修订版).中国高血压杂志, 2024,32(07):603-700. [2] JONES D W, FERDINAND K C, TALER S J, et al. [J]. Hypertension (Dallas, Tex : 1979), 2025, 82(10): e212-e316. [3] MANCIA G, KREUTZ R, BRUNSTRÖM M, et al. [J]. Journal of hypertension, 2023, 41(12): 1874-2071. [4] GAPIZOV A, MOHAMMAD A, SINGLA S, et al. [J]. Cureus, 2025, 17(11): e96886. [5] ZHAO Q, SHEN J, LU J, et al. [J]. BMC cardiovascular disorders, 2020, 20(1): 179. [6] PANTZARIS N D, KARANIKOLAS E, TSIOTSIOS K, et al. [J]. Journal of clinical medicine, 2017, 6(6).

注：血管紧张素转换酶抑制剂 (ACEI)；血管紧张素II受体拮抗剂 (ARB)；血管紧张素受体脑啡肽酶抑制剂 (ARNI)。

弥补目录短板

- 目前医保目录内尚无用于治疗高血压直接肾素抑制剂，苹果酸司妥吉仑片纳入后，**填补医保目录机制空白**；
- 苹果酸司妥吉仑片作为新一代直接肾素抑制剂，提供了**新靶点新机制治疗选择**，为患者提供了更多元的用药选择。

符合“保基本”原则

- 苹果酸司妥吉仑片降压效果稳定，安全性良好，可对医保目录内肾素-血管紧张素-醛固酮系统药物进行替代；
- **肾素-血管紧张素-醛固酮系统药物内部存量替代，对基金影响有限**，保障医保基金安全。

对公共健康的影响

- 高血压是中国最常见的慢性病之一。有效控制血压，可降低卒中、心梗等严重结局风险，**助力实现“健康中国2030”心脑血管疾病防治目标**；
- 苹果酸司妥吉仑片生物利用度高，可实现24小时稳定抑制肾素活性，持续稳定降压，带来靶器官保护。

便于临床管理

- 苹果酸司妥吉仑片100 mg可抑制肾素活性24小时，**每日一次给药**，可以在**空腹或餐后服用**，**用药便利**；
- 临床研究表明，苹果酸司妥吉仑片**长期依从性良好**，52周药物持有率达到99%以上。