

医学信息速递

Medical Information Express

第十六期：各类ARBs药物降压效果比较

医学及信息部 郝德顺

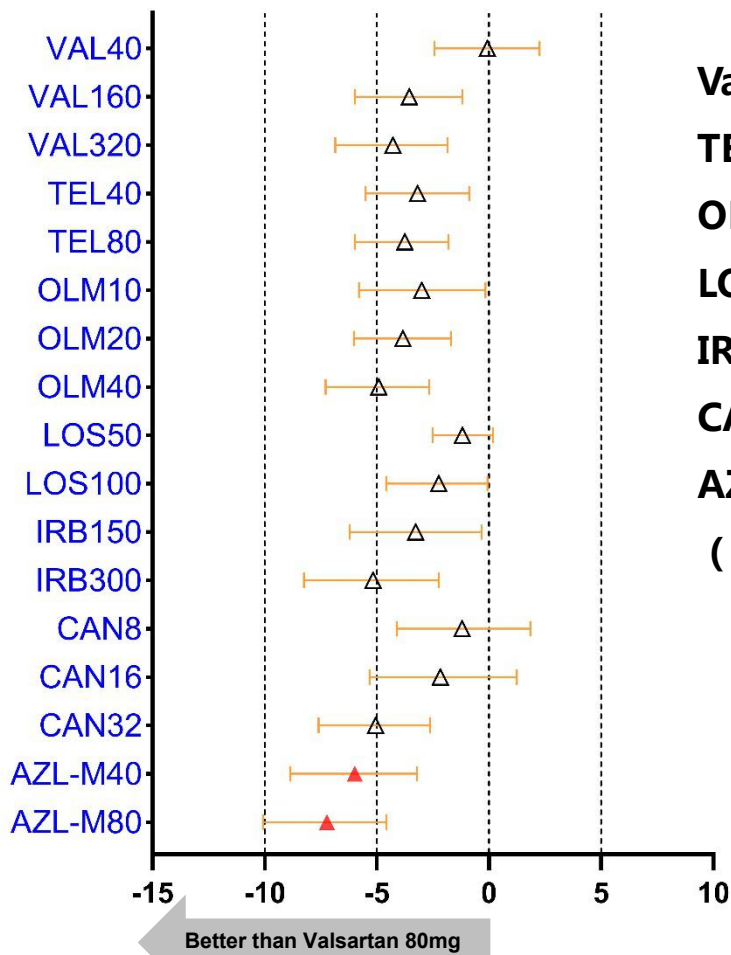
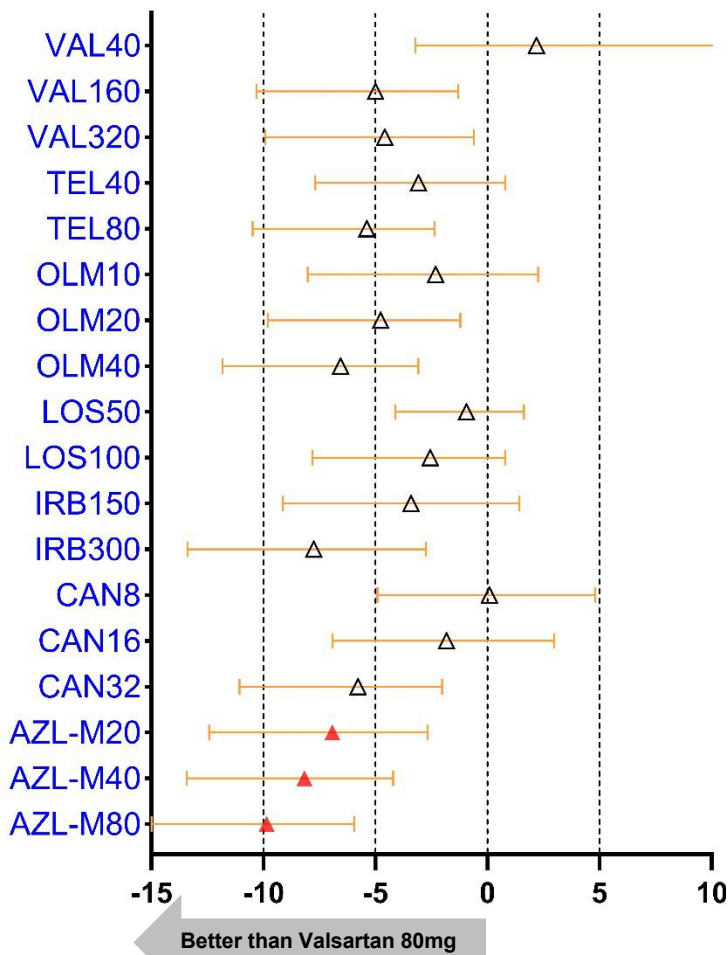
2019/12/9

不同ARBs诊室血压差值比较

— 以缬沙坦80mg为基础进行比较

SBP (mean with 95% CI)

DBP (mean with 95% CI)

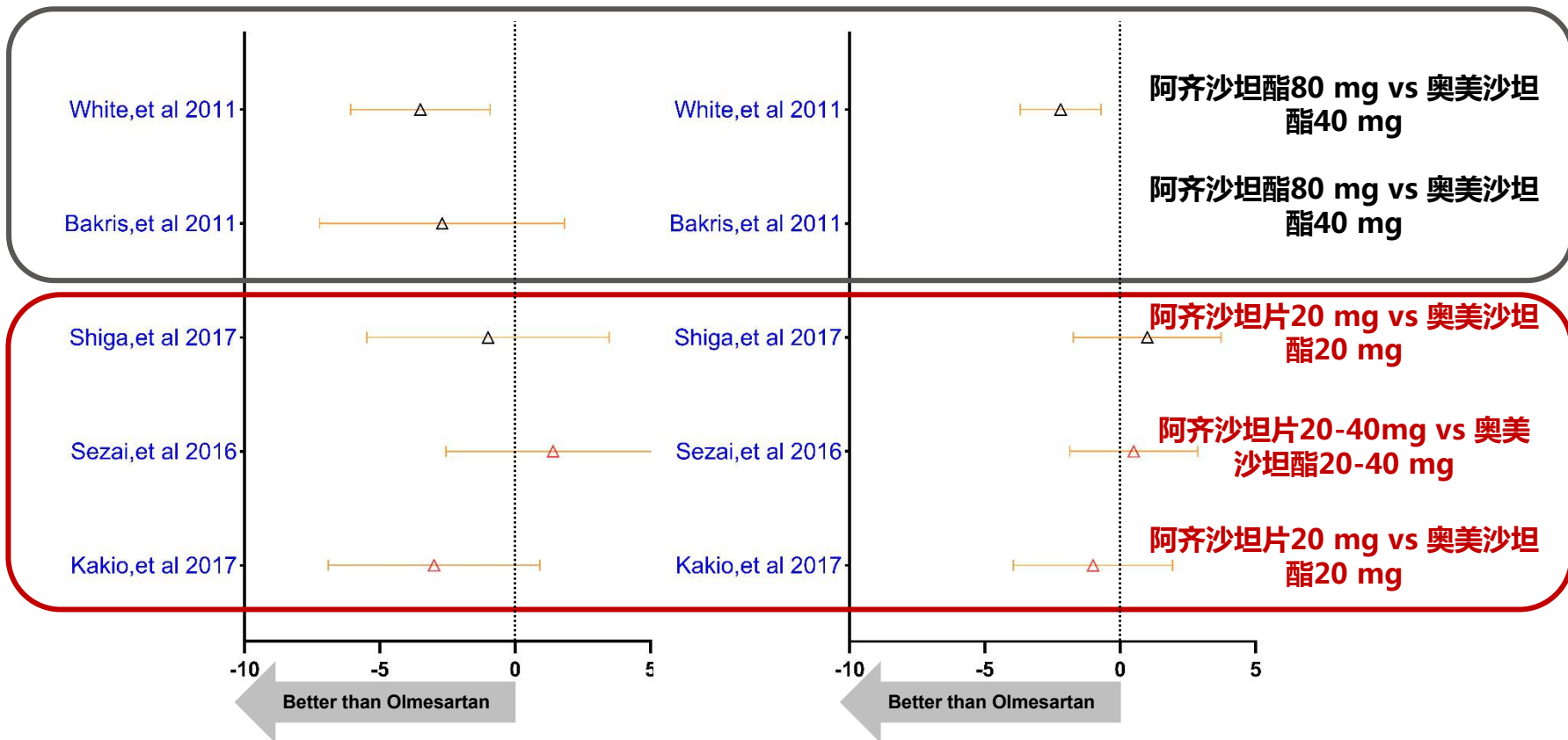


Val : 缬沙坦
TEL : 替米沙坦
OLM : 奥美沙坦
LOS : 氯沙坦
IRB : 厄贝沙坦
CAN : 坎地沙坦
AZL-M : 阿齐沙坦酯
(美阿沙坦钾)

阿齐沙坦 vs 奥美沙坦

SBP (mean with 95% CI)

DBP (mean with 95% CI)

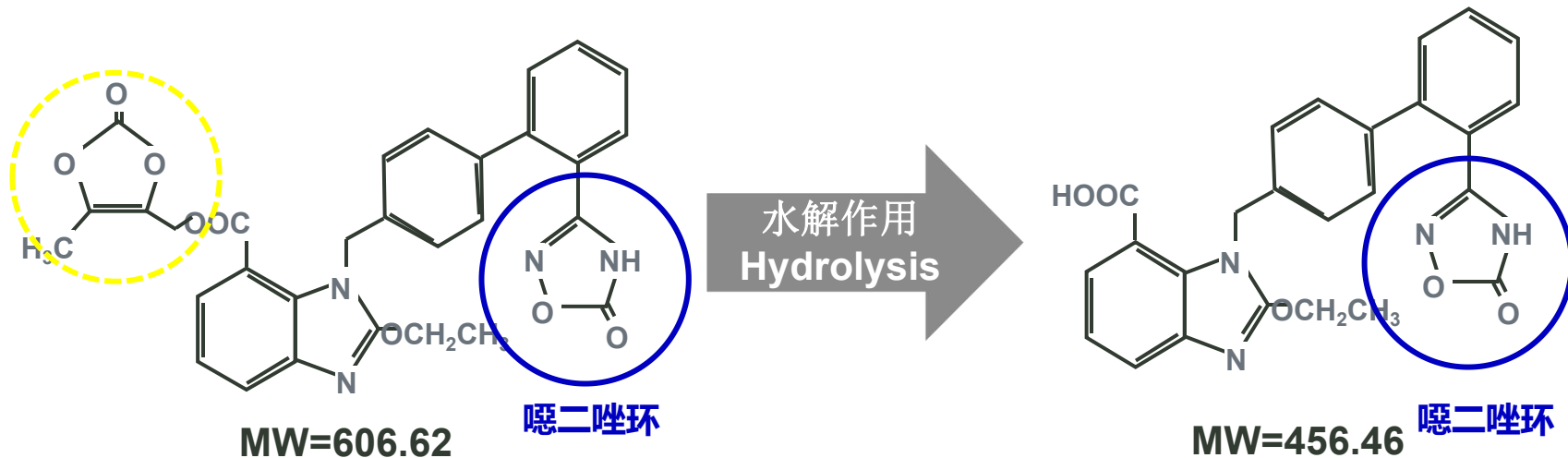


Di Zhao, et al. Antihypertensive effect of azilsartan versus olmesartan in patients with essential hypertension: a meta-analysis. Irish Journal of Medical Science (1971 -). 2018

不同ARBs药理学参数比较

ARBs	半衰期 (h)	Tmax (h)	生物利用度	排泄途径	食物是否影响	药物相互作用	肝CYP代谢酶	结合AT1基团
氯沙坦	2	1-1.5	33%	35%尿, 60%粪便	有	利福平, 氟康唑	2C9, 3A4	四唑环、咪唑基团
坎地沙坦酯	9	2-5	42%	33%尿, 67%粪便	无	无	2C9 (微弱)	四唑环、咪唑基团
厄贝沙坦	11-15	1.3-3	60-80%	20%尿, 80%粪便	无	—	2C9, 3A4 (微弱)	四唑环、咪唑基团
替米沙坦	24	0.5-1	43%	<1%尿, >97%粪便	无	地高辛	无	四唑环、咪唑基团
缬沙坦	6	2-4	23% (胶囊)		有	无	2C9 (弱)	四唑环
奥美沙坦酯	12-14	1.7-2.5	26%	35-50%尿液, 50-65%粪便	无	无	无	四唑环、咪唑基团
阿齐沙坦酯	12	1.5-3	60%	42%尿液, 55%粪便	无	无	2C9, CYP2B6(微弱), CYP2C8 (微弱)	噁二唑环
阿齐沙坦片	13	1.8-2.4h	75%	15%尿液	无	无	2C9, CYP2B6(微弱), CYP2C8 (微弱)	噁二唑环

阿齐沙坦的分子结构使其对AT1受体抑制作用最强



Azilsartan medoxomil/阿齐沙坦酯/美阿沙坦钾
(Azil-M, 前体药物)
40/80 mg, QD

Azilsartan/阿齐沙坦
(Azil, 活性药物)
20/40 mg, QD

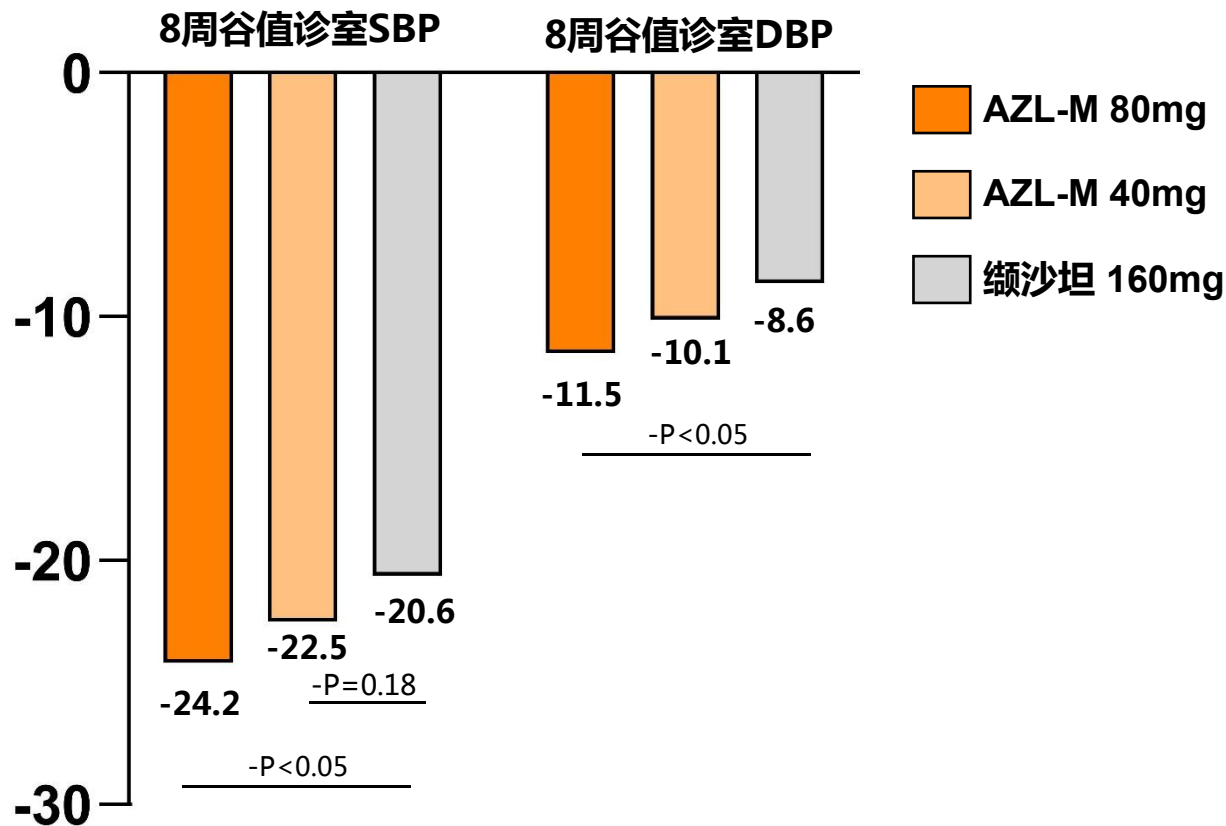
- 阿齐沙坦是最新一代ARB类降压药物，以噁二唑环代替大多数ARB类药物的四唑环，独特的分子结构使其与AT1受体结合更紧密，解离更缓慢，具有更持久的AT1受体抑制作用，从而发挥更强效持久的降压疗效。

阿齐沙坦的分子结构使其对AT1受体抑制作用最强

Compound	IC ₅₀		Ratio: Washout (+)/ Washout (-)
	Washout (-)	Washout (+)	
	<i>nM</i>		
AZL	2.6 (1.7–4.1)	7.4 (3.9–14.2)	3
Olmесartan	6.7 (3.8–10.8)	242.5 (91.0–1056.8)	36
Telmisartan	5.1 (3.0–8.1)	191.6 (124.1–303.2)	37
Valsartan	44.9 (30.5–64.7)	>10,000	>223
Irbesartan	15.8 (8.5–29.7)	>10,000	>635

- 体外实验显示阿齐沙坦对AT1受体的亲和力与抑制作用最强，其抑制作用在游离化合物洗脱后仍然持续。
- 奥美沙坦、替米沙坦、缬沙坦、厄贝沙坦最AT1受体的亲和力与抑制作用相对更弱，游离化合物洗脱后抑制作用显著减弱。

阿齐沙坦酯（美阿沙坦钾）中国III期临床



- 2019年OCC会议期间报道了阿齐沙坦酯中国III期临床试验结果，结果显示阿齐沙坦酯40mg降压效果与缬沙坦160mg相当，阿齐沙坦酯80mg降压效果优于缬沙坦160mg。

小结

- 不同ARBs类药物的降压效果存在一定差异。
- 按标准推荐剂量比较，阿齐沙坦酯降压效果最大，其次是奥美沙坦酯。
- 阿齐沙坦片按标准推荐剂量20/40mg，降压效果与奥美沙坦酯推荐剂量20/40mg相当，优于缬沙坦、坎地沙坦、氯沙坦等。暂无阿齐沙坦片与阿齐沙坦酯直接头对头比较的数据。



thank you!