

01 药物基本信息 | 盐酸依匹斯汀颗粒

【参照药品建议】

首选：盐酸左西替利嗪口服溶液

备选：地氯雷他定口服溶液

【说明书适应症】

本品适用于3岁及以上儿童和成人的过敏性鼻炎、过敏性皮肤瘙痒（如荨麻疹、湿疹/皮炎）的预防及对症治疗。

【注册规格】 5mg、10mg

【是否为OTC药品】 否

【国内中标价格】

10mg: 13.3元/袋, 5mg: 7.8元/袋



【用法用量】

过敏性鼻炎： 每日一次，5-10mg/次（3-6岁）10-20mg/次（7岁及以上）

过敏性皮肤瘙痒（如荨麻疹、湿疹/皮炎）
每日一次，10mg/次（3-6岁）、20mg/次（7岁及以上）

【中国大陆首次上市时间】

2021年11月

【大陆同通用名上市情况】

国内2家

【全球首个上市国家/时间】

日本 2005年3月

01 药物基本信息

起效更快、减少复发、降低嗜睡率、提高依从性

疾病情况

患病率高、发病急、易复发

过敏性鼻炎患病率**17.6%**^[1]，
皮肤瘙痒患病率近**10%**^[2] 疾病特
征：**发病急、易复发**^[3]

患者需长期治疗

属免疫类疾病，**难以治愈，长期**
影响患者的工作、学习、生活^[4]

儿童患病率高、需要儿童剂型

过敏性鼻炎儿童患病率**10.8%-**
21%^[5]，特应性皮炎儿童患病
率**12.94%**^[6]，**需要儿童适宜剂**
型药物

临床未满足需求

已有药物起效慢、治疗后易复发

临床治疗需求为**快速缓解症状，**
减少复发^[3]，现医保目录内药
物难以满足需求

已有目录内药物易引起嗜睡 对儿童认知有影响

已有抗组胺药物，**普遍具有嗜**
睡副作用，影响儿童认知发育
的风险^[4]

医保目录抗组胺药物 尚无颗粒剂型

医保目录无颗粒剂型，**斯汀类抗**
组胺药物无儿童适宜剂型，儿童
依从性差

产品满足需求

起效更快，减少复发

依匹斯汀起效更快(六款抗组
胺药物横向对比)^[7]
复发率明显低于左西替利嗪^[8]

降低嗜睡率

依匹斯汀嗜睡率0.09%
不影响儿童认知发育^[4]

颗粒剂，提高儿童依从性

本品是斯汀类唯一适用于3-6岁
的颗粒剂型，口感微甜，便于儿
童、老人、吞咽困难者服用

[1] 程富. 变应性鼻炎防治应关注的问题[J]. 临床耳鼻咽喉头颈外科杂志. 2017, 31(01): 1-2. [2] 中国医师协会皮肤科分会变态反应性疾病专业委员会. 慢性瘙痒管理指南(2018版). [J]. 中华皮肤科杂志. 2018, 51(7): 481-485. [3] 谢田田, 朱小飞. 慢性自发性荨麻疹发病机制的研究进展. [J]. 免疫学杂志. 2023年4月第39卷第4期. [4] 支玉香, 张宏誉. 抗组胺药对认知功能和执行能力的影响. 中国新药杂志. 2003, 12(10): 615. [5] 中华耳鼻咽喉头颈外科杂志编辑委员会鼻科组. 儿童变应性鼻炎诊断和治疗指南(2022年, 修订版). [J]. 中华耳鼻咽喉头颈外科杂志. 2022, 57(04): 392-404. [6] 中华医学会皮肤性病学分会免疫学组. 中国特应性皮炎诊疗指南(2020版). [J]. 中华皮肤科杂志. 2020年, 2020, 53(02): 81-88. [7] J.A. Grant, L. Danielson, J.-P. Riboux. A double-blind, single-dose, crossover comparison of cetirizine, ebastine, epinastine, fexofenadine, terfenadine, and loratadine versus placebo: suppression of histamine-induced wheal and flare response for 24 h in [J]. Allergy. 54: 700-707(2001). [8] 吕毅, 曹海, 李健, 钟瑞平, 卢建华. 依匹斯汀与左西替利嗪治疗慢性荨麻疹多中心随机双盲对照研究. 中华皮肤科杂志. 2009, 42(04): 285.

02有效性 | 过敏性鼻炎、过敏性皮肤疾病的一线治疗药物

国际权威指南



《日本过敏性鼻炎诊疗指南2020》 [9]

过敏性疾病的化学介质拮抗剂治疗中，推荐使用第二代抗组胺药物进行治疗，如**依匹斯汀**。

《日本痒疹的诊断与治疗指南2020》 [10]



非镇静类的抗组胺药物为一线治疗方案，如**依匹斯汀**。

国内权威指南



《中国荨麻疹诊疗指南（2022版）》 [11]

推荐使用标准剂量的第二代抗组胺药物作为慢性荨麻疹的一线治疗，如**依匹斯汀**。

《慢性瘙痒管理指南（2018版）》 [12]



第二代抗组胺药如：**依匹斯汀**等具有广泛的抗炎作用，临床应用显示对多种慢性炎症性瘙痒有肯定效果。

[9] Okubo K, Kurono Y, Ichimura K, Enomoto M, Okamoto Y, Kawauchi Y, et al., editors. [Japanese guidelines for allergic rhinitis 2020]. 8th ed. Tokyo: Life Science; 2020 (in Japanese).

[10] Takahiro Satoh1 | Hiroo Yokozeki2 | Hiroyuki Murota3 | Yoshiki Tokura4, et al., editors. [2020 guidelines for the diagnosis and treatment of prurigo]. 8th ed. Tokyo: Life Science; 2021 (in Japanese).

[11] 中华医学会皮肤性病学分会荨麻疹研究中心. 中国荨麻疹诊疗指南（2022版） [J]. 中华皮肤科杂志, 2023,47 (7) :514- 516.

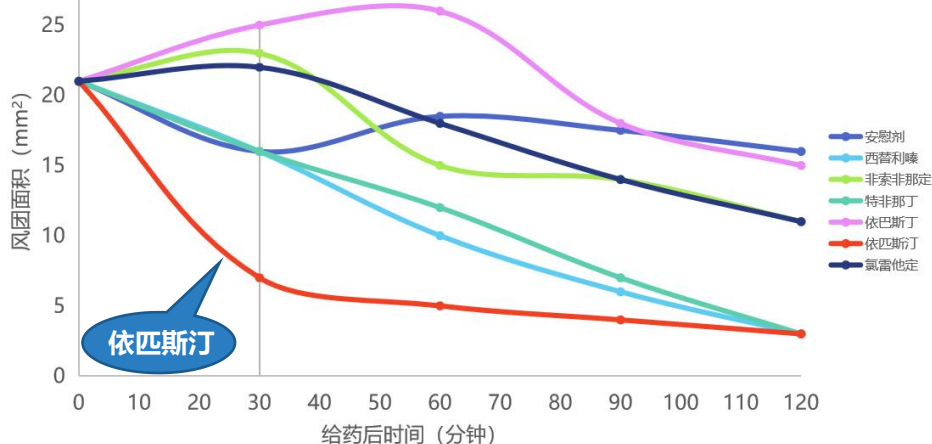
[12] 中国医师协会皮肤科分会变态反应性疾病专业委员会. 慢性瘙痒管理指南（2018版） [J]. 中华皮肤科杂志, 2018,51 (7) :481- 487.

02 有效性 | 治疗荨麻疹起效更快速，复发率低于左西替利嗪

依匹斯汀治疗荨麻疹起效更快速

治疗荨麻疹起效时间（六款抗组胺药物横向对比）：

依匹斯汀20mg < 西替利嗪10mg < 特非那丁60mg < 非索非那定60mg < 氯雷他定10mg < 依巴斯汀10mg [7]

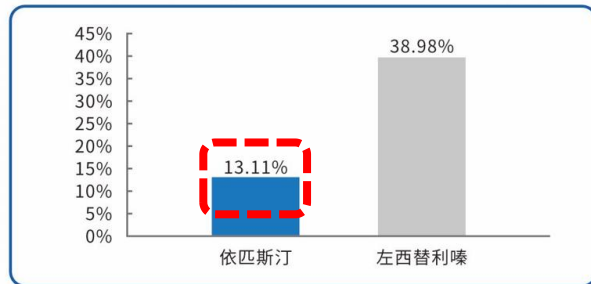


对抗组胺药物治疗荨麻疹患者的一项随机、双盲、单剂量、交叉研究

依匹斯汀治疗荨麻疹复发率低于左西替利嗪

治疗28天后随访3个月，慢性荨麻疹复发率，**依匹斯汀组13.11%，优于左西替利嗪组38.98%** [8]。

3个月内复发率显著低于左西替利嗪



多中心、随机、双盲、双模拟、对照研究

121例慢性荨麻疹患者，随机分成两组；实验组(n=61)：使用依匹斯汀10mg,qd；对照组(n=60)：使用左西替利嗪5mg,qd；评估三个月内复发率

[7] J. A. Grant, L. Danielson, J.-P. Rihoux. A double-blind, single-dose, crossover comparison of cetirizine, ebastine, epinastine, fexofenadine, terfenadine, and loratadine versus placebo: suppression of histamine-induced wheal and flare response for 24 h in. [J] Allergy 1999, 54/ 700-707.

[8] 闫毅 曾海 李健 钟瑞平 卢建华. 依匹斯汀与左西替利嗪治疗慢性荨麻疹多中心随机双盲对照研究. 中华皮肤科杂志, 2009, 42(04): 285.

02 有效性 | 与原研生物等效 (BE研究) [13]

盐酸依匹斯汀颗粒空腹 与原研生物等效

- **研究结论：**受试者空腹口服受试制剂与参比制剂具有生物等效性。

表 1: 受试者药代动力学参数生物等效性结果汇总 (空腹)

药动学参数 (单位)	均值及比值			受试者 个体内 变异 CV%	90%置信区间
	受试制剂 (N _{C_{max}} =24, N _{AUC} =23)	参比 制剂 (24)	受试/ 参比 (%)		
C _{max} (ng/mL)	10.71	11.13	96.23	21.27%	86.70%~106.80%
AUC ₀₋₄ (h*ng/mL)	120.87	128.05	94.39	14.48%	87.75%~101.53%
AUC _{0-∞} (h*ng/mL)	129.57	136.37	95.01	14.09%	88.51%~102.00%

受试制剂：盐酸依匹斯汀颗粒剂, 10mg; **参比制剂：**盐酸依匹斯汀干糖浆1% (英文商品名: Alesion ®Dry Syrup 1%), 10 mg

盐酸依匹斯汀颗粒餐后 与原研生物等效

- **研究结论：**受试者餐后口服受试制剂与参比制剂具有生物等效性。

表 2 受试者药代动力学参数生物等效性结果汇总 (餐后)

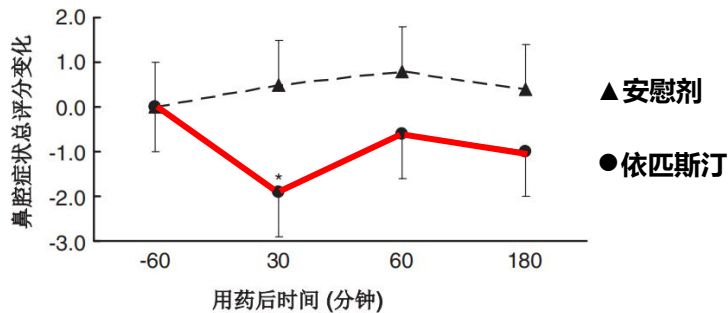
药动学参数 (单位)	均值及比值			受试者个体内 变异 CV%	90%置信区间
	受试制剂 (22)	参比制剂 (22)	受试/参比 (%)		
C _{max} (ng/mL)	7.39	7.82	94.59	7.20	91.11 ~98.21
AUC ₀₋₄ (h*ng/mL)	92.54	94.61	97.81	7.24	94.19 ~101.58
AUC _{0-∞} (h*ng/mL)	101.19	102.22	98.99	7.91	94.99 ~103.16

受试制剂：盐酸依匹斯汀颗粒剂, 10mg; **参比制剂：**盐酸依匹斯汀干糖浆1% (英文商品名: Alesion ®Dry Syrup 1%), 10 mg

02 有效性 | 治疗过敏性鼻炎、荨麻疹安全有效

依匹斯汀治疗过敏性鼻炎 安全有效

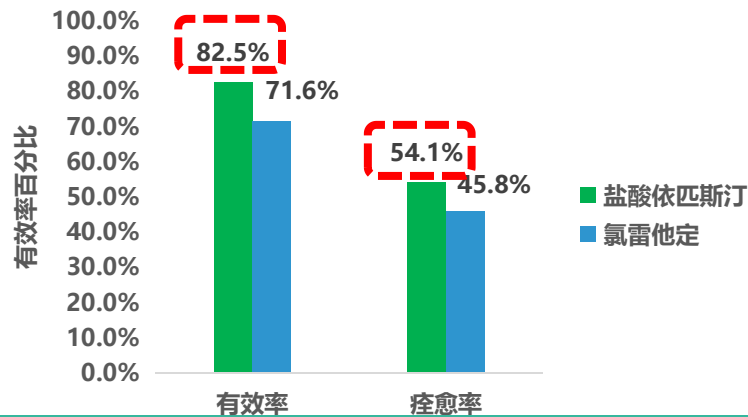
16名过敏性鼻炎患者随机服用20mg盐酸依匹斯汀或安慰剂。与安慰剂相比，**依匹斯汀治疗30分钟、60分钟后鼻腔症状总评分显著降低** [14]。



日本一项单剂量、安慰剂对照、双盲、交叉临床研究

依匹斯汀治疗荨麻疹 优于对照药

240例荨麻疹患者纳入研究，盐酸依匹斯汀10mg，氯雷他定10mg，服用4周，**依匹斯汀治疗荨麻疹总有效率、痊愈率均优于对照药，差异具有统计学意义** [15]。



[14] Minoru Gotoh1, Kazuhiro Hashiguchi2 and Kimihiro Okubol. Efficacy of Epinastine Hydrochloride or Antigen-Provoked Nasal symptoms in Subjects with Orcha Grass Pollinosis. [J]Allergology International 2011;60:69-77

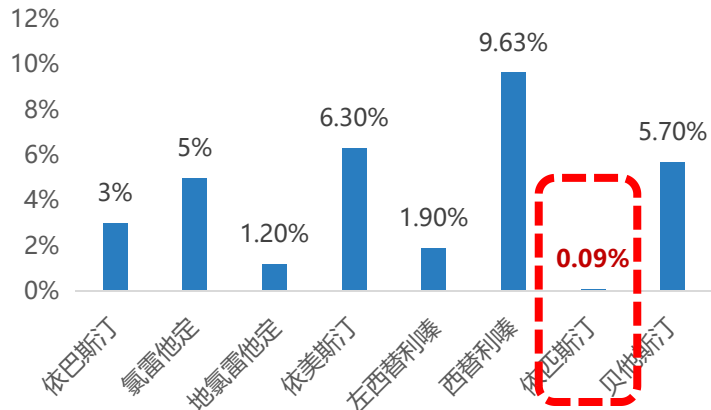
[15] 贾冬梅 苏海辉 李丽莉 孙颖. 盐酸依匹斯汀治疗人工荨麻疹多中心开放研究. 中华皮肤科杂志, 2011, 44(03): 217.

03安全性 | 嗜睡率极低，不影响儿童认知发育

嗜睡率极低

- ▶ 颗粒剂型，不含苯甲酸钠等防腐剂，安全性高
- ▶ 嗜睡率**0.09%**，远低于其他抗组胺药物^[16]

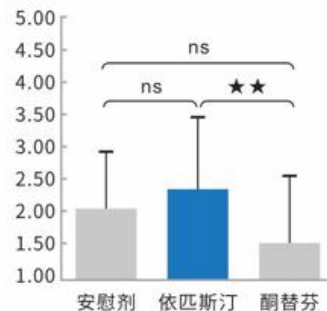
全国医保儿童适用抗组胺药物嗜睡率注：



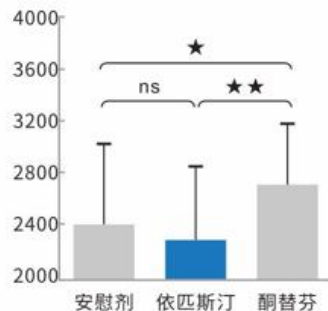
不影响儿童学习认知能力

- ▶ 依匹斯汀难以通过血脑屏障，不与脑内H1受体结合
- ▶ 日本一项单剂量、双盲对照、交叉研究表明：
依匹斯汀不影响学龄前儿童学习及认知能力^[17]

平均准确度(d')



反应时间(ms)



(*: P < 0.05; **: P < 0.01; ns: 无统计学差异)

[16] 数据源自各产品说明书

[17] Takeo Tsujii a, Eriko Yamamoto a, Takayuki Ohira b. Antihistamine effects on prefrontal cortex activity during working memory process in preschool children: A near-infrared spectroscopy (NIRS) study [J] Neuroscience Research 67 (2010) 80-85

04 创新性

化药3类

斯汀类化合物中首个儿童剂型，嗜睡率极低，复发率低

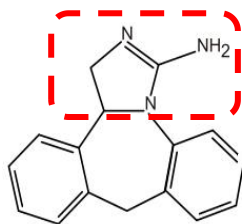
剂型创新 斯汀类首个儿童剂型

- 依匹斯汀颗粒为斯汀类首个颗粒剂型，现医保目录内斯汀类抗组胺药物，均为口服常释剂型。
- 依匹斯汀颗粒可用于3岁以上儿童及成人，便于儿童、老人及吞咽困难者。

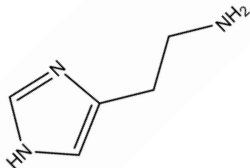
更适宜

化学结构创新 嗜睡率极低

- 依匹斯汀化学结构亲水性高，脂溶性低，难以通过血脑屏障^[18]，嗜睡率仅为0.09%，低于其他抗组胺药物。



依匹斯汀化学结构

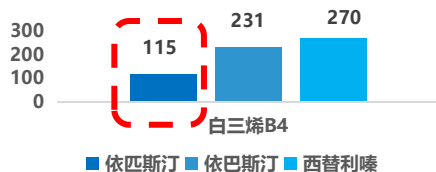


组胺化学结构

嗜睡低

机制创新 减少复发

- 依匹斯汀对组胺、白三烯C4、PAF之外还能抑制5-HT及组胺、慢物质A的释放，更符合临床上治疗过敏性疾病对多重拮抗药物的需求。



- 荨麻疹复发与白三烯B4水平过高有关^[3]，依匹斯汀抑制白三烯B4明显更优^[19]。

少复发

[3] 慢性自发性荨麻疹发病机制的研究进展 [J] 谢苗苗, 朱小飞, 免疫学杂志 2023年4月 第39卷 第4期.

[18] 盐酸依匹斯汀颗粒说明书.

[19] 依匹斯汀等抗组胺药物抗炎作用的研究, 谭燃景郝进, 中华皮肤科杂志2008年12月第41卷第12期.

05 公平性一 | 弥补目录短板，便于临床科学管理

所治疗疾病对公共健康的影响

- 01
- ▶ 过敏性疾病具有高患病率（过敏性鼻炎17.6%，过敏性皮肤瘙痒10%）、高复发率等特点。
——研究证明依匹斯汀治疗慢性荨麻疹**三个月后复发率13.1%**，显著低于左西替利嗪**复发率38.9%**，可减轻患者负担。
 - ▶ 第二代抗组胺药物嗜睡率普遍在1.2%-9%区间，影响日常驾驶、高空作业及儿童学习认知。
——依匹斯汀低脂溶性，难以通过血脑屏障，嗜睡率仅0.09%，较其他二代抗组胺药物嗜睡率更低。

符合“保基本”原则

- 02
- ▶ 国内外指南均推荐依匹斯汀用于过敏性鼻炎、荨麻疹、过敏性皮肤瘙痒。
 - ▶ 依匹斯汀颗粒人均年用药治疗费用占城乡居民家庭年可支配收入**0.88%**，价格适中。
 - ▶ 依匹斯汀可减少过敏性疾病复发，整体降低患者用药负担，降低社会支出总成本。

弥补目录不足

- 03
- ▶ 医保目录抗组胺类药品中**尚无颗粒剂型**，依匹斯汀颗粒是斯汀类唯一适用于3-6岁的儿童剂型，口感微甜，提高儿童依从性。
 - ▶ 说明书标注：本品对组胺、白三烯C4、PAF之外还具有抑制5-HT及组胺、慢物质A（白三烯混合物）的释放，更能满足临床上治疗过敏性疾病对多重拮抗药物的需求。

临床管理难度

- 04
- ▶ **无临床滥用及超说明书用药风险**：①，属处方药，需医生处方使用；②说明书适应症明确，用法用量明确。
 - ▶ 患者依从性高：一天一次，一次一袋；双规格，方便给药。