

盐酸依匹斯汀颗粒

(商标名：一品红®)

广州一品红制药有限公司

01 药物基本信息 | 盐酸依匹斯汀颗粒

【通用名称】盐酸依匹斯汀颗粒

【注册规格】5mg、10mg

【中国获批时间】2022年10月

【注册分类】国家3类新药

【大陆地区同通用名药品上市情况】国内2家

【全球同通用名药品上市情况】日本 2005年3月

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。

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）。

参照药品

- 首选：盐酸西替利嗪滴剂
- 备选：盐酸奥洛他定颗粒

选取西替利嗪滴剂参照的理由：

- ① 适应症一致，均为过敏性鼻炎、过敏性皮肤疾病。
- ② 用药人群一致，西替利嗪滴剂适用于2岁及以上儿童、成人，与依匹斯汀颗粒适用于3岁及以上儿童、成人相似。
- ③ 临床用量最大，2023年目标市场用药频次份额第一为西替利嗪口服液体制剂，高达16.85%。（药融云）
- ④ 剂型相近，口服液体及颗粒均为指南推荐儿童适宜剂型。

备选盐酸奥洛他定颗粒的理由：现有目录内唯一颗粒剂

盐酸依匹斯汀颗粒临床特点 | 起效更快、减少复发、嗜睡率低、儿童适宜

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]

荨麻疹终生患病率近**5.17-8.19%** [2]

疾病特征：**疾病迁移、易复发** [3]

患者治疗效果不佳

超过70%的医生认为**现有药物疗效不足**，
二代抗组胺药物**起始无效**比例近**20.19%** [4]

患者需长期治疗

超**80%**的患者反应受到**嗜睡困扰**，
78.82%的患者将其视为**最主要不良反应** [4]

临床未满足需求

起效慢、易复发

临床治疗需求为**快速缓解症状，减少复发** [5]，现有药物难以满足需求

单一抗组胺无法满足需求

除组胺外，**血小板活化因子、白三烯、细胞因子**等也参与了疾病的进展，**市场上需要多重拮抗的治疗策略** [6]

已有药物嗜睡率高 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** [7]

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) [8]

复发率明显低于左/西替利嗪 [9、10]

多重拮抗，拮抗抑释放

对组胺、白三烯C4、PAF、5-HT有抑制作用，并抑制组胺、慢物质A(白三烯混合物)的释放 [11]

嗜睡率极低、不通过P450酶

依匹斯汀嗜睡率0.09%

不影响儿童认知发育 [12]

[1] 中华耳鼻咽喉头颈外科杂志 2022 年2 月第 57 卷第 2 期 [2] Liu,MaoD,LiuS,etal.EpidemiologyofurticariainChina:apopulation-basedstudy[J].ChinMedJ(Engl).2022Jun5;135(11):1369-1375. [3] 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. [4] 《2023年荨麻疹患者诊疗现状与生活质量调研报告》 [5] 《2022 中国慢性自发性荨麻疹患者疾病负担白皮书》 [6] Allergy. 2011 Mar;66(3):317-30. doi: 10.1111/j.1398-9995.2010.02496.x. Epub 2010 Nov 17. [7] 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. 8] J.A. Grant,L. Danielson, J.-P. Rihoux.A double-blind, single-dose,crossover comparison ofcetirizine, ebastine,epinastine, fexofenadine,terfenadine, and loratadineversus placebo: suppression ofhistamine-induced wheal and are response for 24 h in.[J]Allergy 1999, 54/ 700-707: [9] 李佳妍,林有坤,刘力.依匹斯汀和西替利嗪治疗慢性特发性荨麻疹对照观察[J].中华皮肤科杂志,2008(09):631-632. [10] 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. [11] 盐酸依匹斯汀颗粒说明书 [12] 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

02安全性 | 盐酸依匹斯汀颗粒国内外不良反应信息



说明书载的安全性信息



说明书中不良反应载清晰详实：

- 盐酸依匹斯汀1%干糖浆剂在临床试验及上市产品使用情况的3328例调查病例中（针对儿童荨麻疹），28例（0.84%）有不良反应的报告，**主要不良反应为嗜睡3例（0.09%）、口苦3例（0.09%）、呕气3例（0.09%）等。**
- 严重不良反应：肝功能损害、黄疸（频率不明）；血小板减少（频率不明）。



国内外不良反应发生情况

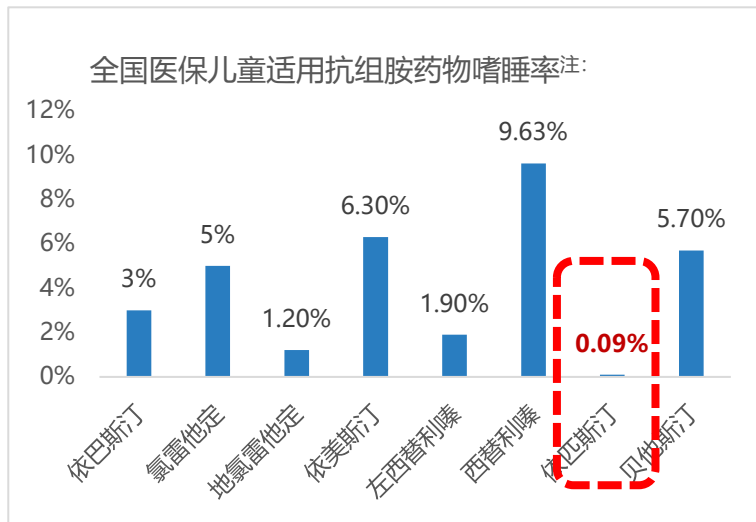


- 盐酸依匹斯汀颗粒于2022年10月获批上市，自上市后按照中国药物警戒相关法规制定产品上市后风险管理计划，开展风险评估与控制。由于本品未开始销售，因此**未收集到上市后不良反应记录。**
- 国内同通用名盐酸依匹斯汀颗粒近5年内**未见任何安全性警告、黑框警告、撤市信息的发布。**

02安全性 | 嗜睡率极低，不影响儿童认知发育

嗜睡率极低

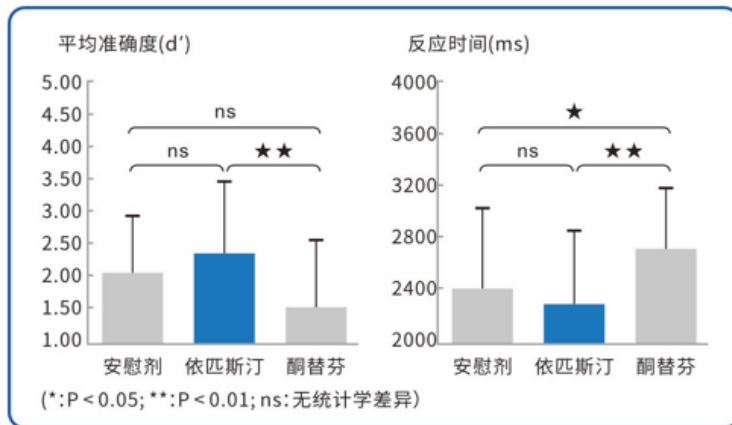
- ▶ 颗粒剂型，不含苯甲酸钠等防腐剂，安全性高
- ▶ 嗜睡率**0.09%**，远低于其他抗组胺药物^[14]



[14] 数据来源自各产品说明书

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^[12]



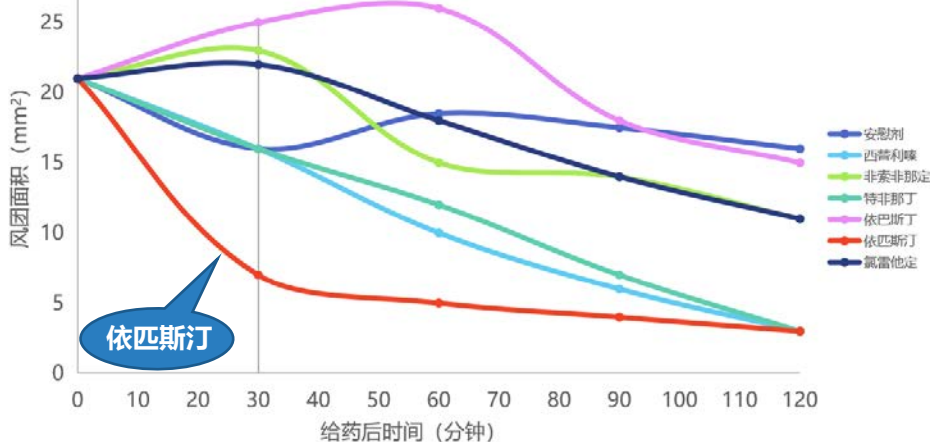
[12] Takeo Tsujii a, Eriko Yamamoto a, Takayuki Ohira b. Antihistamine effects on prefrontal cortex activity during working memory process in preschool children: A near-infrared spectroscopy (NIRS) study [J] Neuroscience Research 67 (2010) 80-85

03有效性 | 依匹斯汀治疗荨麻疹起效更快速，复发率低于西替利嗪

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 [8]

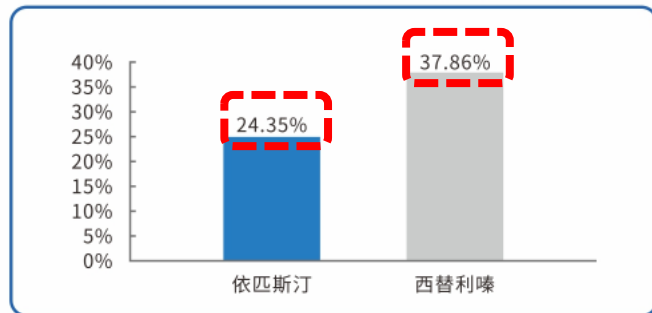


对抗组胺药物治疗荨麻疹患者的一项随机、双盲、单剂量、交叉研究

依匹斯汀治疗荨麻疹复发率低于西替利嗪

治疗28天后随访2周，慢性荨麻疹复发率，依匹斯汀组**24.35%**，优于西替利嗪组**37.86%** [9]。

2周内复发率显著低于西替利嗪



随机、开放、对照研究

237名慢性荨麻疹患者入组，随机分为2组，实验组 (n=137) 使用依匹斯汀10mg,qd；对照组 (n=100) 使用西替利嗪10mg,qd；评估2周内复发率。

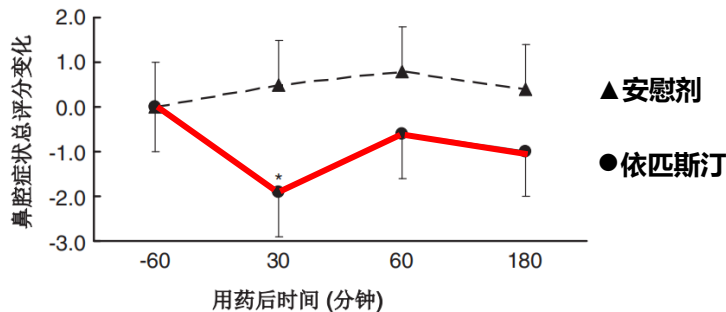
[8] J. A. Grant, L. Danielson, J.-P. Rihoux. A double-blind, single-dose, crossover comparison of cetirizine, ebastine, epinastine, fexofenadine, terfenadine, and loratadine versus placebo: suppression of histamine-induced wheal and flare response for 24 h in. [J] Allergy 1999, 54/ 700-707.

[9] 李佳妍, 林有坤, 刘力. 依匹斯汀和西替利嗪治疗慢性特发性荨麻疹对照观察[J]. 中华皮肤科杂志, 2008(09):631-632.

03有效性 | 治疗过敏性鼻炎、慢性荨麻疹安全、有效，改善效果优于西替利嗪

依匹斯汀治疗过敏性鼻炎 30分钟快速起效

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** [18]。

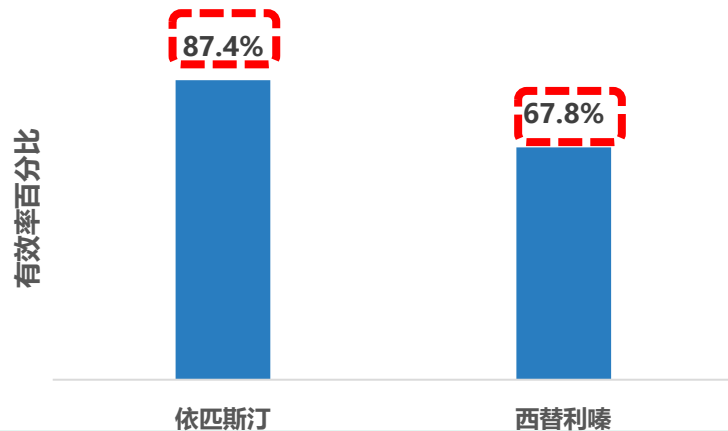


日本一项单剂量、安慰剂对照、双盲、交叉临床研究

依匹斯汀治疗慢性荨麻疹 优于西替利嗪

174例荨麻疹患者纳入研究，盐酸依匹斯汀20mg/天，西替利嗪10mg/天，服用2周，**依匹斯汀治疗荨麻疹总有效率、痊愈率均优于西替利嗪，差异具有统计学意义**

[19]



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

[19] 黄如英 孙学成. 依匹斯汀胶囊治疗慢性荨麻疹疗效和不良反应分析. 中华皮肤科杂志, 2012, 24(12): 139.

03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

指南名称	推荐内容描述
 《日本过敏性鼻炎诊疗指南2020》 ^[15]	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》 ^[16]	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

指南名称	推荐内容描述
 -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）》 ^[3]	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 。
 -中国医师协会皮肤科医师分会 《慢性瘙痒管理指南（2024版）》 ^[17]	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。

[15] 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).

[16] 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).

[3] 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.

[17] 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（2024版） [J]. 中华皮肤科杂志, 2024,51 (7) :481-487.

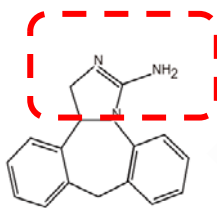
04 创新性 | 化药3类 儿童适宜剂型、嗜睡率极低，多重拮抗，复发率低

弥补颗粒剂型 儿童适宜

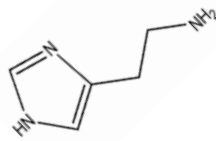
- 过敏性鼻炎、荨麻疹等过敏性疾病，儿童发病率较高^[3]^[21]^[22]，口服液体、颗粒为儿童适宜剂型。
- 弥补现医保目录内抗组胺药物儿童适宜剂型少，颗粒剂型仅1个。
- 依匹斯汀颗粒可用于3岁以上儿童及成人，便于儿童、老人及吞咽困难者。

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^[11]，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

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^[11]，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，依匹斯汀抑制白三烯B4的效果，明显优于西替利嗪、依巴斯汀等抗组胺药物^[23]。

[3] 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. [11] 盐酸依匹斯汀颗粒说明书.

[21] 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2月第53卷第2期

[22] 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年4月第57卷第4期

[23] 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

- 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**2周后复发率24.35%**，显著低于西替利嗪复发率**37.86%**，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

- 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**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

- 现行目录抗组胺类药品中**颗粒剂型仅1个**，依匹斯汀颗粒适用于**3岁以上的儿童**，口感微甜，提高儿童依从性，增加儿童适宜剂型。
- 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

- **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。