

盐酸依匹斯汀颗粒

多重作用机制的快速强效抗组胺药物
嗜睡率极低，不影响儿童学习及认知能力

广州一品红制药有限公司

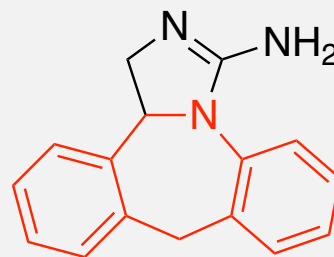
01：基本信息

通用名	盐酸依匹斯汀颗粒	注册规格	10mg（主规格）、5mg
注册分类	化药3类	国内获批时间	2022年10月
大陆同通用名上市情况	国内2家	全球首次上市国家/地区	日本
是否为OTC药品	否	全球首次上市时间	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）。		

建议选择盐酸奥洛他定颗粒作为参照品：

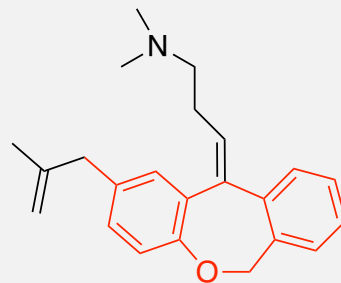
- 作用机制一致：抗组胺+肥大细胞稳定剂
- 适应症一致：均为过敏性鼻炎、过敏性皮肤疾病
- 用药人群一致：儿童、成人
- 剂型一致：颗粒剂
- 化学结构式相似：母环均含二苯并七元杂环
- 盐酸奥洛他定颗粒为2023年国谈产品

盐酸依匹斯汀



含二苯并七元杂环

盐酸奥洛他定



含二苯并七元杂环

疾病情况

患病率高、发病急、易复发

- ◆ 过敏性疾病具有患病率高、发病急、易反复、合并症状多等特性，已成为全球第六大慢性疾病。
- ◆ 我国成人过敏性鼻炎患病率**17.6%**^[1]，**0-18岁**儿童青少年过敏性鼻炎患病率达到**18.46%**^[2]。
- ◆ 我国荨麻疹终生患病率近**5.17%-8.19%**^[3]，**1-7岁**城市儿童特应性皮炎患病率已达**12.94%**^[4]，尚未有过敏性皮肤瘙痒整体的大规模流行病学调查。

临床未满足的治疗需求

仍存在治疗不应答、常见嗜睡

目录内抗组胺药仍存在**治疗不应答情况**，且嗜睡是抗组胺药物最常见不良反应，超**80%**的患者反映受到**嗜睡困扰**^[5]。

本品优势

1. **多重拮抗作用机制**（对组胺、白三烯C4、PAF、5-HT有拮抗作用，并抑制组胺、慢物质A的释放）。
2. 30分钟**快速起效**，症状改善更优，有效**减少复发**。
3. **嗜睡率极低**（难以通过血脑屏障，仅为0.09%），安全性良好。

[1] 中华耳鼻咽喉头颈外科杂志 2022 年2 月第 57 卷第 2 期

[2] 《儿童过敏性鼻炎阶梯治疗中国专家共识》2022

[3] LiJ,MaoD,LiuS,etal.EpidemiologyofurticariainChina:apopulation-basedstudy[J].ChinMedJ(Engl).2022Jun5

[4] 《特应性皮炎的研究与治疗新策略》2018年上海交通大学医学院附属新华医院牵头项目

[5] 《2023年荨麻疹患者诊疗现状与生活质量调研报告》

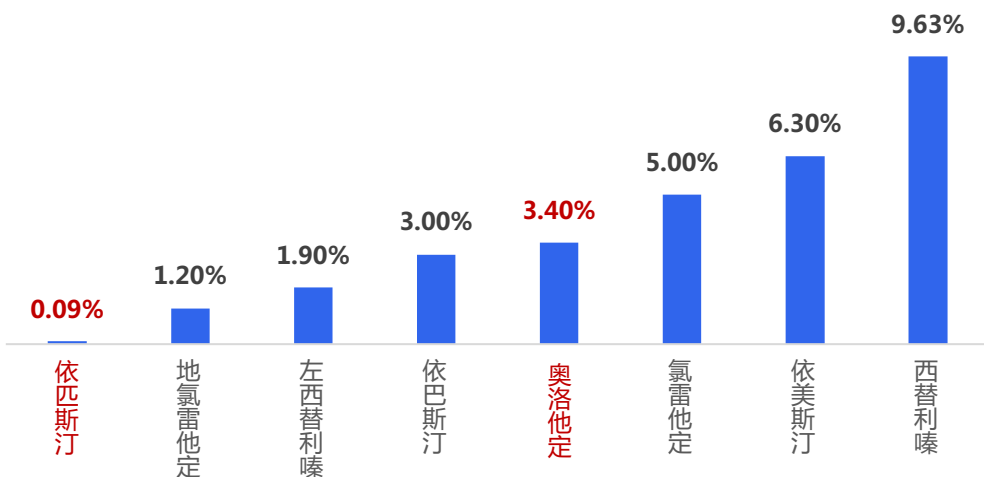
02：安全性

嗜睡率极低，不影响儿童学习及认知能力

嗜睡率低于目录内其他抗组胺药物

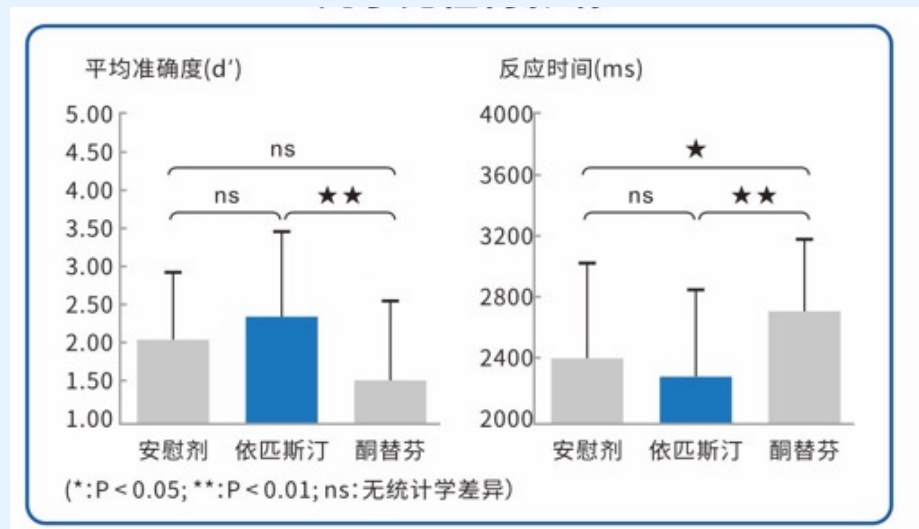
- 颗粒剂型，不含苯甲酸钠等防腐剂，安全性高。
- 低脂溶性，难以通过血脑屏障，嗜睡率**0.09%**，远低于奥洛他定(3.4%)等其他抗组胺药物^[6]。

全国医保儿童适用抗组胺药物嗜睡率



不影响儿童学习及认知能力

- 中国医学科学院总结发现：抗组胺药的嗜睡副作用与认知功能损害直接相关^[7]。
- 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^[8]。



[6] 数据源自各产品说明书

[7] 支玉香, 张宏誉. 抗组胺药对认知功能和执行能力的影响[J]. 中国新药杂志, 2007, 16(10): 777-780.

[8] 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

说明书收载的 安全性信息

- 依匹斯汀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

- 2022年上市至今，**未监测到不良反应报告。**
- 计算机检索维普、万方、中国医院数字图书馆，及查阅近5年内监管机构发布的警示信息，未发现本品或本品活性成份“依匹斯汀”相关的警示信息,盐酸依匹斯汀颗粒**未出现不良反应事件（SAE）。**

03 : 有效性

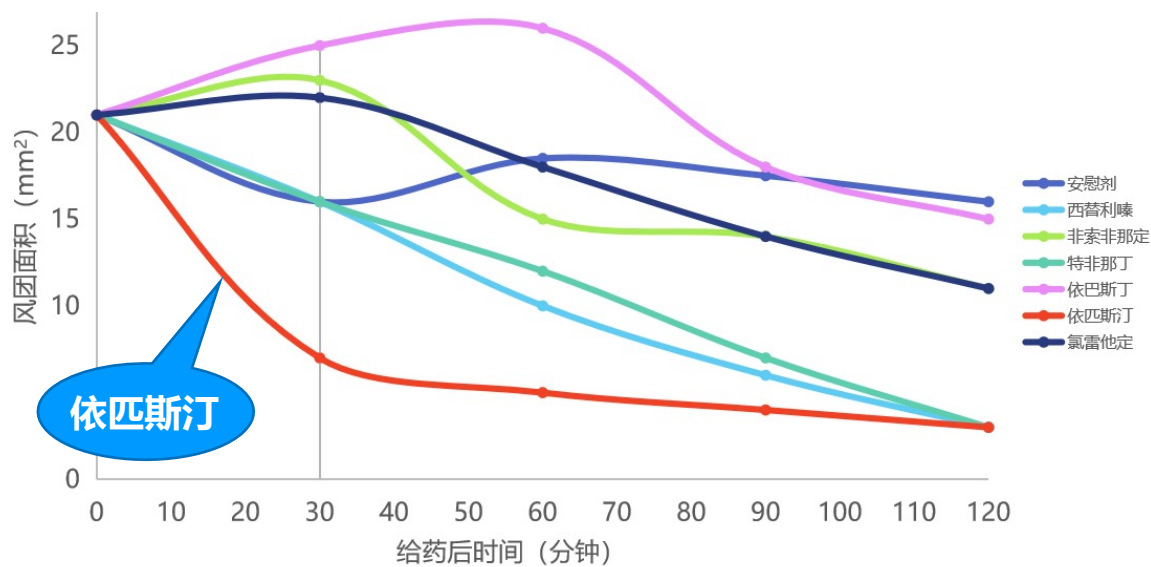
治疗荨麻疹起效更快速，复发率低

- **起效迅速**：起效时间（六款二代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^[9]

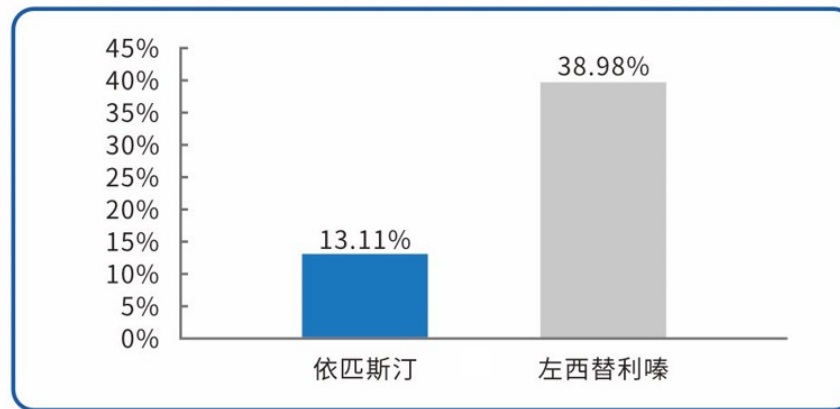
- **复发率更低**：治疗28天后随访3个月，慢性荨麻疹复发率，依匹斯汀组**13.11%**，优于左西替利嗪组**38.98%**^[10]。

依匹斯汀30min起效，有效控制过敏症状



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

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^[24]

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

[9] 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;

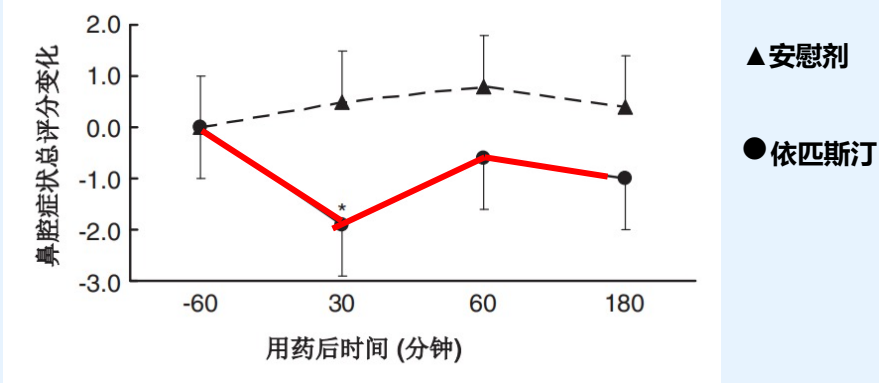
[10] 闫毅 曾海 李健 钟瑞平 卢建华. 依匹斯汀与左西替利嗪治疗慢性荨麻疹多中心随机双盲对照研究. 中华皮肤科杂志, 2009, 42(04): 285

03 : 有效性

治疗过敏性鼻炎、慢性荨麻疹安全有效，改善更优

依匹斯汀治疗过敏性鼻炎 30分钟快速起效

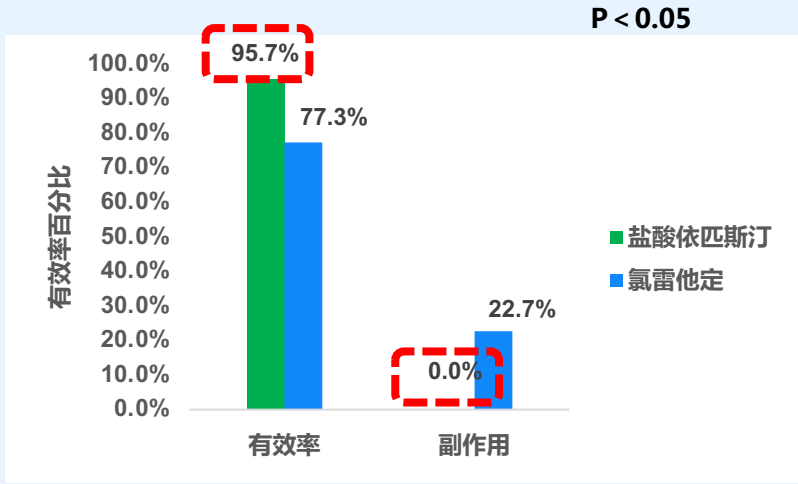
过敏性鼻炎患者随机服用20mg盐酸依匹斯汀或安慰剂。与安慰剂相比，依匹斯汀治疗30分钟、60分钟后鼻腔症状总评分**显著降低** [11]。



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

45例荨麻疹患者纳入研究，盐酸依匹斯汀20mg/天，氯雷他定10mg/天，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 [12]。



[11] Minoru Gotoh1, Kazuhiro Hashiguchi2 and Kimihiro Okubo1.Efficacy of Epinastine Hydrochloride for Antigen-Provoked Nasal ymptoms in Subjects with Orcha Grass Pollinosis. [J]Allergology International2011;60:69-77 7
[12] 徐惠兴 世界最新医学信息文摘 2018年第18卷第47期 . 依匹斯汀治疗慢性荨麻疹临床疗效评价

	指南名称	推荐内容描述
国内指南	 《中国荨麻疹诊疗指南（2022版）》	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、奥洛他定、左西替利嗪、地氯雷他定、非索非那定、依巴斯汀、依美斯汀等。〔13〕
	 《慢性瘙痒管理指南（2024版）》	第二代抗组胺药如：依匹斯汀、奥洛他定、地氯雷他定、左西替利嗪、依巴斯汀、非索非那定、咪唑斯汀、卢帕他定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。〔14〕
国外指南	 《日本过敏性鼻炎诊疗指南2020》	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、奥洛他定、依巴斯汀、西替利嗪、非索非那定等。〔15〕
	 《日本痒疹的诊断与治疗指南2020》	非镇静类的抗组胺药物为一线治疗方案，如依匹斯汀、奥洛他定、非索非那定、左西替利嗪、氯雷他定等。〔16〕

〔13〕 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.
〔14〕 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.
〔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 Yokoze2 | Hiroyuki Murota3 | Yoshiki Tokura4, et al.,editors. [2020 guidelines for the diagnosis and treatment of prurigo. 8th ed. Tokyo: Life Science; 2021 (in Japanese).

产品创新性

- 颗粒剂为**儿童适宜剂型**，具有明确的儿童用法用量；
- 依匹斯汀在拮抗组胺、白三烯C4、PAF之外还能抑制5-HT及组胺、慢物质A（荨麻疹复发与白三烯B4水平过高有关）的释放^{〔17〕}，更符合临床上治疗过敏性疾病对**多重拮抗**药物的需求；
- 化学结构亲水性高，脂溶性低，难以通过血脑屏障^{〔17〕}，**嗜睡率仅为0.09%**，远低于其他抗组胺药；
- **不依赖P450酶**，联合用药无禁忌。

患者获益点

- ◆ **快速起效**，有效控制过敏症状，减少复发，**不易嗜睡**，保障患者正常的生活和工作，**不影响儿童学习及认知发育**；
- ◆ 口感微甜，有效**提高患者服药的依从性**；
- ◆ 相比其他瓶装液体制剂，本品单剂量分装固体制剂，**便于外出携带，随时应对突发过敏情况**。

弥补目录短板

- 患者对抗组胺药耐受性存在个体化差异，依匹斯汀能快速缓解症状，嗜睡率极低，补充现有目录，**增加患者用药新选择**。
- 依匹斯汀颗粒**适用于3岁以上儿童**，**增加儿童适宜剂型**，符合国家鼓励儿童适宜剂型研发的政策指导方向。

对公共健康的影响

- 过敏性疾病具有高患病率、高复发率等特点，且低幼化趋势明显。**依匹斯汀起效迅速、强效抗敏、减少复发**，可减轻患者疾病负担。
- 依匹斯汀嗜睡率远低于其他二代抗组胺药物，**不影响日常生活、工作，儿童学习和认知发育**。

符合“保基本”原则

- 指南推荐**的一线用药**，多重作用机制、起效快、更符合临床治疗需求。
- 依匹斯汀可减少过敏性疾病复发，从而**降低患者用药负担**，对医保资金支出影响有限。

临床管理难度

- 无临床滥用及超说明书用药风险，**用法用量明确**。
- 患者依从性更好，本品一天一次，方便给药。