



盐酸西替利嗪注射液

效敏乐®

山东科信惠益药业有限公司



目录

—CONTENTS—

01

药品基本信息

02

安全性

03

有效性

04

创新性

05

公平性

01 药品基本信息 国内首家获批上市，填补了国内没有二代抗组胺药注射剂的空白



- 通用名：盐酸西替利嗪注射液
- 批准文号：国药准字H20244299
- 中国大陆首次上市时间：2024年6月28日 **(首家和独家)**
- 注册规格：1ml:10mg
- 适应症：本品用于治疗成人急性荨麻疹。
- 用法用量：本品为一次性注射制剂，仅供静脉注射给药。治疗急性荨麻疹时的推荐剂量方案为按需每24小时注射一次，在1至2分钟内静脉推注。成人推荐剂量为静脉注射10mg。
- 全球首个上市国家/地区及上市时间：美国，2019年10月。



- 参照药物建议：富马酸氯马斯汀注射液
- 参照药物选择理由：
 - 富马酸氯马斯汀注射液用于治疗急性过敏性疾病(如荨麻疹、过敏性鼻炎等)，与盐酸西替利嗪注射液的适应症相同，均可用于治疗急性荨麻疹。
 - 给药途径相同，均为注射剂型。因此选择富马酸氯马斯汀注射液作为参照药物。

01 药品基本信息

✓ 荨麻疹首选二代抗组胺药

- 荨麻疹对症治疗一般首选无镇静或低镇静作用的二代抗组胺药^[1,2]。

✓ 一代抗组胺注射液禁忌多，临床使用受限，二代可替代一代，可弥补不足

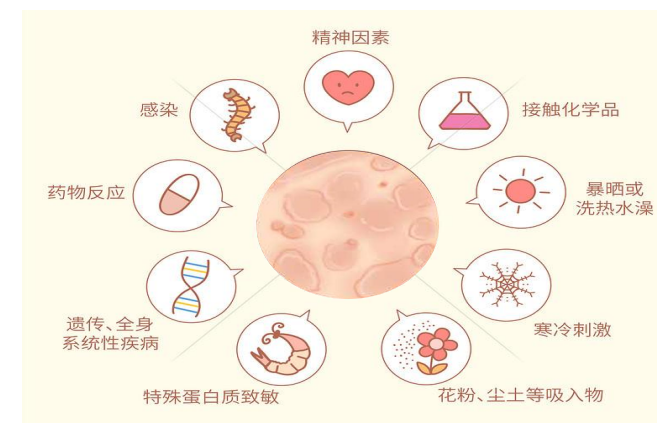
- 目前国内上市的注射剂型均为一代抗组胺药，但禁忌或不良反应较多，在临床使用上受限范围较大^[3]。盐酸西替利嗪注射液为二代抗组胺药，无一代禁忌，且不良反应少。适用于一代抗组胺药限制使用患者的急性荨麻疹治疗。
- 本品经临床试验验证，已证明其有效性明显优于一代抗组胺药（盐酸苯海拉明注射液），且在嗜睡、头晕、头痛等中枢神经抑制产生的不良反应方面也明显优于苯海拉明。

✓ 注射剂型相比口服剂型更适用于急重症的荨麻疹患者

- 急性荨麻疹发作时病程发展快，重症患者可迅速出现喉头水肿甚至呼吸困难，**需要起效迅速、能够快速缓解症状**的治疗药物。口服制剂达峰时间缓慢，无法迅速控制病情，盐酸西替利嗪注射液起效迅速，可直接入血并迅速作用于全身，更适用于急重症的荨麻疹患者。

禁忌或不良反应：

- 苯海拉明：重症肌无力、闭角型青光眼、前列腺肥大者禁用。
- 异丙嗪：易发生锥体外系反应。
- 氯苯那敏：慎用于存在心血管疾病的患者，且可能导致一过性低血压，增加患者离院期间的风险。
- 氯马斯汀：重症肌无力患者，卟啉症患者，下呼吸道疾病包括支气管性哮喘患者，使用单胺氧化酶抑制剂患者禁用。



- 荨麻疹是常见皮肤病，在我国荨麻疹的患病率约为0.75%^[2]。
- 约有20%的人在一生中至少经历过一次急性荨麻疹。
- 目前国内急性荨麻疹患病率数据尚不清楚。

参考文献：

- [1] 张建中,高兴华.皮肤性病学[M].第一版.北京:人民卫生出版社,2018.
- [2] 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,2022,55(12):1041-1049.
- [3] 盐酸苯海拉明注射液说明书、盐酸异丙嗪注射液说明书,马来酸氯苯那敏注射液说明书,富马酸氯马斯汀注射液说明书.



药品说明书载载的安全性信息

【不良反应】

1. **口服盐酸西替利嗪**最常见不良反应为嗜睡（14%）、疲乏（6%）、口干（5%）、咽炎（2%）和头晕（2%）。
2. **盐酸西替利嗪注射液**：在一项随机、双盲、单剂量、非劣效性研究中，对262例急性荨麻疹成人患者进行了盐酸西替利嗪注射液与苯海拉明注射剂的安全性研究。接受盐酸西替利嗪注射液治疗的患者不良反应发生率低于1%，包括：消化不良、发热感、味觉障碍、头痛、感觉异常、昏厥前期和多汗。

✓ 无安全性警告、黑框警告、撤市信息

- 盐酸西替利嗪注射液于2019年在美国完成全球首家上市，至今各国家或地区药监部门未发布任何盐酸西替利嗪注射液的安全性警告、黑框警告、撤市信息。

✓ 经验证性临床表明，二代注射液比一代安全性更高，不良反应发生率更低

- 本品在国内完成了一项252例急性荨麻疹患者的随机对照试验，其中试验组（盐酸西替利嗪注射液）的不良事件和不良反应的发生率均低于对照组（盐酸苯海拉明注射液组），且差异有统计学意义，表明本研究中盐酸西替利嗪注射液安全性更高。
- 研究中所观察到的绝大多数不良反应是嗜睡，CTCAE分级为1级。

临床试验中本品的主要优势

- ✓ 本品在一项252例急性荨麻疹患者的随机对照试验中，**盐酸西替利嗪注射液组在主要疗效指标、次要疗效指标和其他指标均优效于盐酸苯海拉明注射液组。**
- ✓ 药代动力学研究显示，盐酸西替利嗪注射液比口服给药途径在体内的**达峰时间更迅速**，药峰浓度是口服制剂的4倍以上，**吸收程度更好。**
- 主要疗效指标：给药后患者评定瘙痒严重程度评分较基线的下降幅度/变化值。具体见《盐酸西替利嗪注射液III期总结报告摘要》。
- 次要疗效指标和其他指标：治疗成功百分比；瘙痒严重程度评分、风团/红斑程度评分和风团面积较基线的下降幅度/变化值；离院后症状复发和需要接受药物治疗；离院后因急性荨麻疹前往医院或诊所就诊等。具体见《盐酸西替利嗪注射液III期总结报告摘要》。

临床指南/诊疗规范推荐情况

中国荨麻疹诊疗指南(2022年版)	<ul style="list-style-type: none"> 急性荨麻疹的治疗首先应发现并去除病因，治疗用药首选第二代非镇静抗组胺药，必要时可加量或联合用药。
过敏性疾病诊治和预防专家共识（II）	<ul style="list-style-type: none"> 第一代抗组胺药由于其明显的中枢抑制作用和心脏毒性，临床应用受到限制。第二代抗组胺药的低脂溶性降低了对血脑屏障的穿透性，减弱了对中枢系统的抑制作用，同时具有起效快、作用持续时间长等优点。 特应性皮炎（AD）涉及的炎症介质较多，组胺只是其中一部分，因此抗组胺药物对合并荨麻疹、过敏性鼻炎（AR）、过敏性结膜炎的患者疗效较好，而对重度AD患者的瘙痒症状疗效欠佳。推荐第一代抗组胺药短期间断用于因瘙痒、搔抓而睡眠缺失的患者，第二代抗组胺药则用于伴发荨麻疹的患者。
儿童过敏性鼻炎诊疗——临床实践指南	<ul style="list-style-type: none"> 第二代抗组胺药为儿童过敏性鼻炎（AR）的一线治疗药物，临床推荐用于儿童患者的治疗。目前，临床上儿童AR常用的口服二代抗组胺药物为氯雷他定及西替利嗪。
儿童合理应用口服H1抗组胺药的临床实践指南（2022年版）	<ul style="list-style-type: none"> 推荐口服第二代抗组胺药（sgAHs）作为儿童过敏性鼻炎（AR）及荨麻疹的一线治疗药物。 推荐6个月龄及以上的婴儿选用西替利嗪、左西替利嗪或地氯雷他定，2岁及以上儿童还可以选用酮替芬、赛庚啶、氯雷他定或依巴斯汀，咪唑斯汀仅应用于12岁及以上的儿童。



04 创新性

✓ 填补无二代抗组胺注射液的空白

- 盐酸西替利嗪注射液是国内3类首仿药物，填补了国内没有二代抗组胺药注射剂的空白。

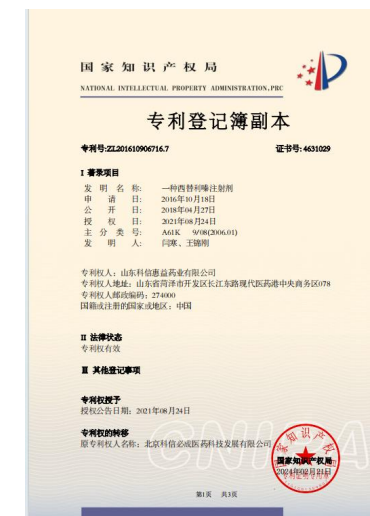
✓ 有效性及安全性均优于一代抗组胺药

- 盐酸西替利嗪为二代抗组胺药，有效性及安全性均优于一代抗组胺药，且嗜睡等不良反应发生率更低和持续时间更短，对于患者日常工作生活的影响更小。

✓ 注射剂型比口服制剂起效迅速、吸收好

- 药代动力学研究显示，盐酸西替利嗪注射液比口服给药途径在体内的达峰时间更迅速，吸收程度更好。

自主知识产权的首仿药，制剂专利
保护期至2036年。





✓ 美国CDC指南中已作为疫苗接种的急救必备药品

✓ 针对急重症荨麻疹

- 本品相对于其口服制剂起效更快，更适用于病程发展快速的伴有喉头水肿和过敏性休克的急重症急性荨麻疹。一日仅需注射一次，较一代抗组胺注射液一日需注射1~2次更为有效方便。

✓ 有效期更长

- 本品有效期为36个月，一代抗组胺注射液均只有24个月。



Interim considerations: preparing for the potential management of anaphylaxis after COVID-19 vaccination

Summary of recent changes (last updated February 10, 2021)

- Personnel, medications, and supplies for assessing and managing anaphylaxis: This section has been expanded to indicate that trained personnel qualified to recognize and treat symptoms of anaphylaxis should be available at vaccination locations at all times. The recommendations for medications and supplies have also been updated.
- Early recognition of anaphylaxis: This section has been updated to provide additional information related to anaphylaxis symptoms.
- Special populations: This section has been updated with considerations for anaphylaxis management of homebound persons requiring home vaccination services.

Should be available at all locations	If feasible, include at locations (not required)
Epinephrine (e.g., prefilled syringe, autoinjector)*	Pulse oximeter
H1 antihistamine (e.g., diphenhydramine, cetirizine)*	Oxygen
Blood pressure monitor†	Bronchodilator (e.g., albuterol)
Timing device to assess pulse	H2 antihistamine (e.g., famotidine, cimetidine)
	Intravenous fluids
	Intubation kit
	Adult-sized pocket mask with one-way valve (also known as cardiopulmonary resuscitation [CPR] mask)

05 公平性

➤ 可促进公共健康的发展

- ✓ 应作为急重症荨麻疹患者的急救必备药品。本品起效快、用药安全，应纳入公共场所和医疗卫生机构的急救用药服务包。
- ✓ 应纳入疫苗接种的急救用药服务包。疫苗接种有可能引发急性荨麻疹，国内尚缺乏此方面的应急处理药品。
- ✓ 美国CDC指南中已作为疫苗接种的急救必备药品。

➤ 符合“保基本”原则

- ✓ 可保障急重症荨麻疹患者的急救需求。重症荨麻疹会危及生命，本品可保障急救需求，安全有效，应纳入医保目录。
- ✓ 可实现国产替代。原料药及制剂等均已本土化，可保证生产和供应。

➤ 弥补药品目录短板

- ✓ 一代抗组胺注射液禁忌多，临床使用受限，二代可替代一代，弥补不足
- ✓ 可弥补目录内口服制剂的用药短板。急性荨麻疹发作时病程发展快，重症患者可迅速出现喉头水肿甚至呼吸困难，口服制剂达峰时间缓慢，无法迅速控制病情，注射剂型比口服制剂起效迅速、吸收好，直接进入血，迅速作用全身，更适用于急重症的荨麻疹患者。

➤ 临床易于管理

- ✓ 便于医保基金管理。适应症表述清晰，便于医生诊断和医保审核，不会发生超说明书使用。
- ✓ 有利于节省医保基金支出。剂量准确，一日一次，不会发生超剂量使用，且不良反应发生率低。
- ✓ 医保基金管理更安全。无成瘾性，无滥用风险。



感谢各位专家领导！