

核准日期：2023 年 06 月 14 日
修改日期：2023 年 07 月 04 日

苯磺贝他斯汀口崩片说明书

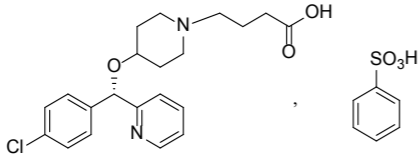
请仔细阅读说明书并在医师或药师指导下使用

【药品名称】

通用名称：苯磺贝他斯汀口崩片
英文名称：Bepotastine Besilate Orally Disintegrating Tablets
汉语拼音：Benhuang Beitasiting Kou Bengpian

【成份】

本品活性成份为苯磺贝他斯汀。
化学名称：(S)-4-[4-(4-氯苯基)(2-吡啶)甲氧基]哌啶}丁酸苯磺酸盐
化学结构式：



分子式：C₂₁H₂₅ClN₂O₃·C₆H₄O₃S
分子量：547.06

辅料：甘露醇、微晶纤维素、交联羧甲纤维素钠、纽甜、粉末桔子香精、硬脂酸镁。

【性状】

本品为白色片。

【适应症】

- 过敏性鼻炎；
- 荨麻疹；
- 皮肤疾病引起的瘙痒（湿疹、皮炎、痒疹、皮肤瘙痒症）。

【规格】

10mg

【用法用量】

成人：口服，每次 10mg，每日 2 次。根据年龄、症状适当增减剂量。

儿童：7 岁以上儿童，口服，每次 10mg，每日 2 次。

注：当本品放在舌头上并被唾液浸润时就会崩解，因此本品可以在没有水的情况下服用。另外，本品也可以与水一起服用。

躺下时不要让患者在没有水的情况下服用本品。

【不良反应】

由于有时会会出现以下不良反应，应充分进行观察，如果发现异常，应采取停止给药等适当措施。

	0.1~<5%	<0.1%	频率不明
血液	白细胞数增加、白细胞数减少、嗜酸性细胞增多		
精神神经系统	困倦、疲倦感、头痛、眩晕		头重感
消化系统	口渴、恶心、胃痛、胃部不适、腹泻、口干、呕吐	舌炎、腹痛	便秘
过敏症状	皮疹、荨麻疹	肿胀	
肝胆	AST、ALT、γ-GTP 上升、LDH、总胆红素上升		
肾脏	尿潜血、尿蛋白、尿糖、尿胆原		尿量减少、排尿困难、尿闭
其他		月经异常、浮肿、味觉异常	心悸、呼吸困难、麻木

【禁忌】

对本品的成分有过敏史的患者。

【注意事项】

- 有肾功能障碍的患者应慎重给药，可能使本品的血中浓度上升，并可能持续维持高血药浓度，因此应从低剂量（例如 1 次量 5mg）开始慎重给药，出现异常时采取适当的处置，如减量，停药等。
- 重要的基本注意事项
 - 因可能引起困倦，服用本品的患者，在进行汽车驾驶等伴有危险的机械操作时，应加以注意。
 - 使用本品不见效果时，应注意不要盲目长期服用。
 - 对季节性患者，应考虑多发季节因素，最好在发病季节到来之前开始给药，并持续到多发季节结束。
 - 长期接受类固醇疗法的患者，想通过本品的使用来减少类固醇剂量时，应严格管理缓慢进行。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

- 孕妇或有可能妊娠的妇女慎用，必须用药时，应仅限于在判断其治疗意义大于治疗风险时使用。妊娠中给药的安全性尚不明确。此外，动物实验（大鼠）发现该药物向胎鼠有转移。
- 对哺乳期妇女慎用。必须用药时，须避免哺乳。有报告称动物实验（大鼠）发现向乳汁中有转移。

【儿童用药】

对低出生体重儿、新生儿、乳儿或幼儿的安全性尚未确立。

【老年用药】

本品主要从肾脏排泄，老年人生理机能往往降低，因此可能持续高血药浓度，需要注意。

【药物相互作用】

未进行该项实验且无可靠参考文献。

【药物过量】

未进行该项实验且无可靠参考文献。

【药理毒理】

药理作用

苯磺贝他斯汀对组胺 H₁ 受体具有选择性的抑制作用，对 5-HT₂、α₁、α₂ 无亲和性，能够抑制过敏性炎症时嗜酸性粒细胞向炎症部位的浸润，抑制活化嗜酸性粒细胞 IL-5 的生成。

毒理研究

生殖毒性

苯磺贝他斯汀对生殖功能及胎仔的安全剂量为 100mg/kg。大鼠口服给药后乳汁中有转移，并有部分转移到了胎仔。

苯磺贝他斯汀遗传毒性试验、致癌性试验结果均为阴性。

【临床药理学】

药代动力学

1. 血浆药物浓度

成人：健康成年男性以苯磺贝他斯汀口崩片 10mg 的剂量单次口服给药后，血浆中贝他斯汀浓度和药代动力学参数如下：

给药剂量	T _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	AUC _{0-10hr} (ng·hr/mL)	t _{1/2}
苯磺贝他斯汀口崩片 10mg*	1.0±0.4	98.1±24.2	369.4±58.5	2.5±0.3

(平均值±标准差, n=21)

(*用水服用)

健康成年男性给药 20mg 每日 2 次、7 天多次给药，没有发现积蓄，用药开始第 2 天血浆药物浓度变化基本达到稳态（末次给药后的 C_{max} =138.4±23.4ng/mL，平均值±S.D.，n=6）。

儿童：对 7~15 岁的儿童常年性过敏性鼻炎和儿童特应性皮炎患者将苯磺贝他斯汀 10mg 以每日 2 次、2 周多次给药时，给药后 1~3 小时和给药后 9~11 小时的血中苯磺贝他斯汀浓度如下。

	常年性过敏性鼻炎患者		特应性皮炎患者
	C _{1-3hr} * ¹	C _{9-11hr} * ²	C _{9-11hr} * ²
平均值±标准差 (例数)	92.0±56.1 (62)	8.2±4.0 (43)	8.3±4.1 (106)

(ng/mL)

※1：给药 1 周时间点，※2：给药 2 周时间点

2. 吸收

餐食影响：几乎没有观察到餐食对血浆中贝他斯汀的影响。

生物利用度：根据健康成年男性单次经口给药苯磺贝他斯汀时的尿中排泄率，推测生物利用度约为 82%。

3. 分布

健康成年男子 10mg 单次口服给药，1 小时和 2 小时后的血浆蛋白结合率分别为 55.9%和 55.0%。

4. 代谢

健康成年男性口服苯磺贝他斯汀时，血浆及尿中几乎没发现代谢物，用药后 24 小时内，给药量的 75~90%以药物原型（贝他斯汀）从尿中排泄。

5. 排泄

6 例健康成年男性单次口服给药苯磺贝他斯汀 2.5~40mg 时，给药后 24 小时内，相对于给药量 76.4%~87.9%排泄到尿中。另外，每天 2 次 7 天多次口服给药 20mg 时，尿液中排泄率也为 80.7%，与单次给药时基本一致。

6. 肾功能障碍患者的血浆药物浓度

对肾功能障碍患者（肌酐清除率 6~70mL/min）以苯磺贝他斯汀 5mg 的剂量单次口服给药时，与肾功能正常者相比，由于肾功能低下，最高血药浓度有所上升。AUC 明显上升。对肾功能障碍患者多次口服给药时，达稳态的最高血药浓度与肾功能正常者相比，预计将增加到 1.2~1.8 倍。

肾功能障碍患者的分类 (肌酐清除率)	T _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	t _{1/2} (hr)	AUC ₀₋₆ (ng·hr/mL)
肾功能正常者 (n=5) (>70mL/min)	1.2±0.4	55.1±16.8	2.9±0.5	241.1±50.6
轻度肾功能障碍患者 (n=5) (51~70mL/min)	1.0±0.0	61.0±10.8	3.1±0.6	304.0±61.7
中度或重度肾功能障碍患者 (n=6) (6~50mL/min)	3.3±1.0	66.3±7.7	8.5±3.6	969.1±398.3

(平均值±标准差)

7. 老年人

65 岁以上健康老年男性（肌酐清除率 61.7~126.7mL/min）以苯磺贝他斯汀 10mg 的剂量 1 日 2 次 3 天（最后一天 1 次）多次口服给药时，末次给药后的最高血药浓度为 103.8±13.2 ng/mL（平均值±S.D.，n=10）。

【贮藏】

密封，不超过 30℃ 保存。开封后避免受潮。

【包装】

聚氯乙烯固体药用硬片和药用铝箔泡罩包装，密封于聚酯/铝/聚乙烯药用复合袋，袋内装有固体药用纸袋装硅胶干燥剂。

7 片×1 板/盒；7 片×2 板/盒；10 片×1 板/盒；10 片×2 板/盒；12 片×1 板/盒；12 片×2 板/盒。

【有效期】

24 个月

【执行标准】

YBH06542023

【批准文号】

国药准字 H20233733

【药品上市许可持有人】

企业名称：宏越科技(湖州)有限公司

注册地址：浙江省湖州市龙溪街道王母山路 1800 号 1 号楼 218

邮政编码：313000

联系方式：0572-2971315

传 真：0572-2971315

网 址：http://www.hykhz.com

【生产企业】

企业名称：浙江贝得药业有限公司

生产地址：浙江省绍兴市越城区袍江工业区三江路

邮政编码：312071

联系方式：0575-88919723

传 真：0575-88919712

网 址：http://www.betterpharma.com

Size
148mm×250mm