

批准日期：2026 年 07 月 21 日

奥普雷顿片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称：奥普雷顿片

商品名称：奥泽悦/ORZEYFUL

英文名称：Oveporexton Tablets

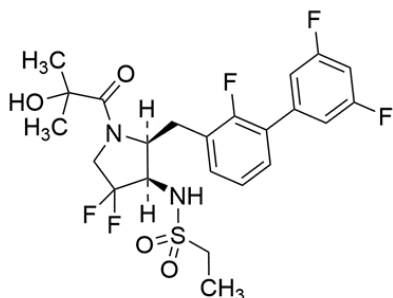
汉语拼音：Aopuleidun Pian

【成份】

本品活性成份为奥普雷顿。

化学名称：*N*-{ (2*S*, 3*R*) -4, 4-二氟-1-(2-羟基-2-甲基丙酰基)-2-[(2, 3', 5'-三氟 [1, 1'-联苯]-3-基) 甲基] 吡咯烷-3-基} 乙基磺酰胺

化学结构：



分子式：C₂₃H₂₅F₅N₂O₄S

分子量：520.51

辅料：羟丙纤维素（口服）、硬脂酸镁、甘露醇、微晶纤维素、羧甲淀粉钠、碳酸钙、羟丙甲纤维素、聚乙二醇 8000、红氧化铁和/或黄氧化铁。

【性状】

本品为浅橙色（0.5mg 规格）或橙色（1mg 规格）或暗红色（2mg 规格）圆形薄膜包衣片，一面刻有“”和“0.5”（0.5mg 规格）或“1”（1mg 规格）或“2”（2mg 规格），除去包衣后，显示白色或类白色。

【适应症】

本品用于 16 岁及以上青少年和成人 1 型发作性睡病患者。

【规格】

(1) 0.5mg (2) 1mg (3) 2mg

【用法用量】

推荐剂量

本品的推荐剂量为 1 mg，每日两次。第 1 剂应在晨醒后服用，第 2 剂在 3-5 小时后服用。根据临床反应和耐受性，剂量可以调整至 2mg，每日两次。

每日不超过两次。

用法

本品应整片用水吞服，请勿掰开、压碎或咀嚼片剂。本品可以空腹或餐后服用（参见【临床药理学】）。

药物漏服

建议每天在大致相同的时间服用本品。如果漏服一剂药物，则应跳过漏服的剂量，按常规服药时间服用下一剂药物。请勿将下次剂量加倍。

肝功能不全患者的剂量调整

对于重度肝功能不全（Child-Pugh C）患者，禁用本品，因为尚未在该人群中进行研究。

轻度或中度肝功能不全（Child-Pugh A 或 B）患者接受本品时无需调整剂量（参见【临床药理学】）。

肾功能不全患者的剂量调整

轻度至中度肾功能不全[估算肾小球滤过率(eGFR)≥30 至<90 mL/min]或无需透析的重度肾功能不全（eGFR≥15 至<30 mL/min）患者无需调整剂量（参见【临床药理学】）。

尚未开展本品在接受透析的重度肾功能不全或终末期肾脏疾病（ESRD）（eGFR<15mL/min）患者中的研究。

与细胞色素 P450 3A（CYP3A）诱导剂合用

应避免本品与强效或中效 CYP3A 诱导剂合用（参见【药物相互作用】和【临床药理学】）。

与 CYP3A 抑制剂合用时的剂量调整

禁止本品与强效 CYP3A 抑制剂合用（参见【禁忌】和【药物相互作用】和【临床药理】）。

如果本品与中效 CYP3A 抑制剂合用，则有必要将剂量降低至 0.5 mg，每日两次。每日最大推荐总剂量不应超过 1 mg。

【不良反应】

由于临床试验是在多种不同条件下开展的，因此一种药物在临床试验中观察到的不良反应发生率，不能直接与另一种药物在临床试验中的不良反应发生率进行比较，也可能无法反映在临床实践中观察到的实际发生率。

已在 415 例 1 型发作性睡病患者中评估了接受本品治疗的安全性。在这些患者中，196 例患者在两项为期 12 周的 3 期安慰剂对照研究中接受本品治疗，剂量为 1 mg 或 2 mg，每日两次。

在 2 项为期 12 周的 3 期安慰剂对照研究中，未报告与本品使用相关的严重不良反应。接受本品治疗的患者因不良反应导致的停药率为 2.6%，安慰剂组为 1.3%。

在 2 项为期 12 周的 3 期安慰剂对照研究中，用于 1 型发作性睡病患者时，本品最常见的不良反应（发生率 $\geq$ 5%且高于安慰剂组发生率）为失眠、尿频、尿急和唾液分泌过多。

表 1 列出了 2 项为期 12 周的安慰剂对照临床研究中，接受奥普雷顿片治疗的 1 型发作性睡病患者中发生率 $\geq$ 2%且频率高于安慰剂组的不良反应。

表 1：两项 1 型发作性睡病 3 期研究中，奥普雷顿片组中发生率 $\geq$ 2%且高于安慰剂组的不良反应

不良反应	安慰剂 (N=76) %	奥普雷顿片 1 mg (N=60) %	奥普雷顿片 2 mg (N=136) %	奥普雷顿片 汇总 (N=196) %
失眠*	1.3	55.0	59.6	58.2
尿频	5.3	53.3	58.1	56.6
尿急	1.3	15.0	16.2	15.8
唾液分泌过多	0	8.3	6.6	7.1
皮肤异常感觉	0	1.7	2.2	2.0

*包括失眠、中间易醒型失眠和入睡困难

失眠

在为期 12 周的安慰剂对照 3 期研究中，大多数失眠事件发生在早期，严重程度为轻度至中度，且为一过性。接受奥普雷顿片治疗的患者中有 58.2%发生了失眠，1.5%报告为重度。大多数失眠事件发生在开始治疗后的前 2 天内，具有自限性，且在 7 天内缓解。无患者因失眠而停止治疗。

泌尿系统事件

在为期 12 周的安慰剂对照 3 期研究中，大多数泌尿系统事件的严重程度为轻度或中度。接受奥普雷顿片治疗的患者中有 63.3%发生了泌尿系统事件，1.0%报告为重度。最常见的表现为尿频和尿急。大多数泌尿系统事件发生在治疗后的前 2 天内，并在试验结束时缓解。2 例奥普雷顿片治疗的患者分别因尿频和尿失禁事件而停止治疗。

生命体征变化

在为期 12 周的安慰剂对照 3 期研究中，在第 1 天观察到奥普雷顿片组门诊血压升高（> 20 mmHg）和心率加快（> 15 bpm）的发生率高于安慰剂组，但至第 12 周时，奥普雷顿片组和安慰剂组的发生率相似。这些血压/心率升高均未被判定为具有临床意义或导致停止研究治疗。至第 12 周时，经安慰剂校正的较基线平均变化为< 5mmHg 和< 5bpm。

24 小时动态血压和心率监测显示，第 10 周的血压或心率与基线相比无显著差异。

实验室检查

转氨酶升高

在为期 12 周的安慰剂对照 3 期研究中，奥普雷顿片组 (3/196; 1.5%) 和安慰剂组 (1/76; 1.3%) 转氨酶升高>3×正常值上限 (ULN) 的发生率相似。也有病例显示，转氨酶升高>3×ULN 与奥普雷顿片治疗存在时间关系，但患者无症状且被判定为无临床意义。未出现肝损伤或黄疸病例。

肌酸磷酸激酶（CPK）升高

在为期 12 周的安慰剂对照 3 期研究中，在 10.7% (21/196) 的奥普雷顿片组患者和 5.3% (4/76) 的安慰剂组患者中观察到无症状 CPK 升高 >5xULN，大多发生在剧烈体力活动后。这些病例均为无症状且在继续接受奥普雷顿片治疗期间自行缓解，均未报告临床后遗症。

【禁忌】

以下患者禁用本品：

- 服用强效 CYP3A 抑制剂（参见【用法用量、药物相互作用和临床药理学】）。
- 重度肝功能不全（Child-Pugh C）（参见【用法用量和临床药理学】）。

【注意事项】

停用本品

尚未在对照临床试验中对停用本品的影响进行系统评价。因此，建议在停用后对患者进行监测。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠

本品尚无妊娠期间的暴露数据，无法对重大出生缺陷、流产或其他母体或胎儿不良结局的药物相关风险进行评价。目标人群中重大出生缺陷和流产的预期背景风险尚不明确。所有妊娠均存在出生缺陷、流产或其他不良结局的背景风险。

哺乳

尚无本品是否存在于人乳汁中、是否影响母乳喂养婴儿或影响乳汁分泌的数据。动物研究表明，本品存在于哺乳期大鼠的乳汁中。

应综合考虑母乳喂养对婴儿发育与健康的获益、母亲对本品的临床需求、以及对母乳喂养婴儿的任何潜在不良影响。

【儿童用药】

尚未确定本品在小于 16 岁人群中的安全性和有效性。

【老年人用药】

本品临床试验中，65 岁及以上患者数量有限，因此无法确定本品在该人群中的安全性特征是否与年轻成人患者存在差异。有限的临床经验和药代动力学数据（参见【临床药理学】）未显示老年和年轻成人患者之间的应答差异。

【药物相互作用】

预计本品不会影响主要 CYP、UGT 和转运蛋白底物的血药浓度；因此，无需调整剂量。表 2 列出了与其他药物合用时，可能影响本品使用的药物相互作用。

表 2：可能影响本品使用的与其他药物合用情况

强效 CYP3A 抑制剂	
临床影响	本品与强效 CYP3A 抑制剂合用，可增加本品的暴露量（参见【临床药理学】）。
预防或管理	禁止本品与强效 CYP3A 抑制剂合用（参见【禁忌】）。
示例	克拉霉素、伊曲康唑和葡萄柚汁
中效 CYP3A 抑制剂	
临床影响	本品与中效 CYP3A 抑制剂合用，可增加本品的暴露量（参见【临床药理学】）。
预防或管理	与中效 CYP3A 抑制剂合用时，将本品剂量降低至 0.5 mg，每日两次（参见【用法用量】）。
示例	地尔硫卓和氟康唑
强效和中效 CYP3A 诱导剂	
临床影响	与强效和中效 CYP3A 诱导剂何用，可增加本品的代谢，从而导致本品血药浓度降低（参见【临床药理学】）。
预防或管理	避免与强效和中效 CYP3A 诱导剂合用。
示例	苯妥英和依法韦伦

本品对其他药物的影响

预计本品不会影响主要 CYP、UGT 和转运蛋白底物的血药浓度；因此，无需调整剂量。

药物相互作用研究

临床研究和模型引导方法

其他药物对本品的影响

强效和中效 CYP3A 抑制剂：

与单独给药相比，伊曲康唑（一种强效 CYP3A4 抑制剂）与本品合并使用可导致本品 AUC_{inf}（增加至 7.43 倍）和 C_{max}（增加至 1.67 倍）增加。与伊曲康唑合并使用时，本品的半衰期延长约 5 倍（参见【禁忌】和【药物相互作用】）。

与单独给药相比，氟康唑（一种中效 CYP3A4 抑制剂）与本品合并使用可导致本品 AUC_{inf} （增加至 2.87 倍）和 C_{max} （增加至 1.50 倍）增加。与氟康唑合并使用时，本品的半衰期延长约 2 倍（参见【用法用量】和【药物相互作用】）。

弱效 CYP3A 抑制剂：

基于生理药代动力学（PBPK）模型，预计奥普雷顿与弱效 CYP3A 抑制剂合并使用时，不会发生具有临床意义的相互作用。

强效和中效 CYP3A 诱导剂：

与单独给药相比，苯妥英（一种强效 CYP3A4 诱导剂）与本品合并使用会导致本品 AUC_{inf} 和 C_{max} 分别降低 81% 和 56%（参见【药物相互作用】）。

基于 PBPK 模型，与单独给药相比，预计中效 CYP3A 诱导剂与本品联合使用会使本品 AUC_{inf} 和 C_{max} 分别降低 73% 和 55%（参见【药物相互作用】）。

弱效 CYP3A 诱导剂：

基于 PBPK 模型，预期本品与弱效 CYP3A 诱导剂合并使用时，不会发生有临床意义的相互作用。

本品对其他药物的影响

基于 4 β -羟基胆固醇/胆固醇比值和 PBPK 模型，对本品对 CYP3A 活性的影响进行了临床评估。预计在最大推荐剂量下，本品既不会影响 CYP3A 活性，也不会改变 CYP3A 底物的全身暴露量。

根据本品对 OATP1B1/B3 活性影响的临床评估结果（通过粪卟啉 I（CPI）与粪卟啉 III（CPIII）评估），在最大推荐剂量下，未发现本品存在抑制这些转运蛋白的明显风险。

体外研究

细胞色素 P450 (CYP) 酶

体外研究中，在最大推荐剂量下，预计本品的暴露量不会直接抑制或诱导 CYP 酶（CYP1A2、CYP2B6、CYP2C8、CYP2C9、CYP2C19 和 CYP2D6）。

药物转运蛋白系统

转运蛋白抑制：

体外研究中，本品不抑制 P-gp、BCRP、OAT1、OAT3、OCT1、OCT2、MATE1、MATE2K 或 MRP2。

体外研究中，本品是外排转运蛋白 BSEP、MRP3、MRP4 和 MDR3 的抑制剂。然而，在最大推荐剂量下，预计本品不会抑制这些转运蛋白。

转运蛋白底物：

体外研究中，本品不是 P-gp、BCRP、OATP1B1 或 OATP1B3 的底物。

【药物滥用和依赖】

滥用

奥普雷顿是一种新型小分子化合物，其结构与所有已知滥用物质均明显不同。作为一种高效且高度选择性的 OX2R 激动剂，奥普雷顿对与滥用潜力相关的受体、离子通道、酶和转运体通道未显示出任何显著活性。在非临床自我给药研究中，测试的四个剂量水平中，三个剂量水平下未观察到强化效应，仅在一个中等剂量下显示出微弱的强化效应。该效应不具有剂量依赖性。药物辨别研究显示，奥普雷顿不会在大鼠中产生可训练识别的内感受线索，亦未对右旋安非他明的辨别刺激产生泛化反应，表明奥普雷顿与安非他明、中枢神经兴奋剂或其自身均不存在相同的辨别线索。

在安慰剂对照的临床研究中，共有 415 名 1 型发作性睡病（NT1）患者接受了为期 4 至 12 周的奥普雷顿片治疗。总体而言，与潜在滥用相关的不良事件发生率较低，且与安慰剂相当。

在一项随机、双盲、安慰剂对照并设有阳性对照药的五序列交叉人体滥用潜力研究中，进行了奥普雷顿片的滥用潜力评估。该研究纳入了 50 名具有中枢神经系统（CNS）兴奋剂使用经验的健康成年男性和女性娱乐性药物使用者。受试者分别单次口服奥普雷顿片 6 mg、18 mg 和 30 mg（分别为推荐最大日剂量的 1.5 倍、4.5 倍和 7.5 倍）、安非他明类药物芬特明 75 mg 以及安慰剂。通过视觉模拟量表（VAS）评估“药物喜好”。结果显示，6 mg 剂量的奥普雷顿片与芬特明 75 mg 相比具有更低的滥用潜力；而超治疗剂量 18 mg 和 30 mg 的奥普雷顿片则表现出与芬特明 75 mg 相似的滥用潜力。就主要终点“此刻的药物喜好”而言，奥普雷顿片 6 mg、18 mg 和 30 mg 的最小二乘均值（LSM）评分分别为 66.9、72.8 和 78.0，均高于安慰剂的 LSM 评分。关键次要终点（总体药物喜好、再次用药意愿以及“High” VAS Emax）显示：在 6 mg 剂量下，奥普雷顿片的效应显著低于芬特明 75 mg；而在 18 mg 和 30 mg 剂量下，其效应与芬特明相当，未观察到显著的统计学差异。

医生在开具奥普雷顿片处方前，应认真评估患者近期是否存在药物滥用史，尤其是对曾有兴奋剂（例如哌甲酯、安非他明或可卡因）或酒精滥用史的患者；对此类患者需密切随访，观察是否出现奥普雷顿片的误用或滥用迹象（例如自行增加用药剂量、寻药行为等）。

依赖

通过动物研究和临床试验对躯体依赖性进行了评价。共有 277 例完成或停用治疗的患者接受了停药后不良事件的监测。结果显示，长期使用奥普雷顿片剂后停药时，未见提示躯体依赖性的戒断体征或症状（见【注意事项】）。

【药物过量】

本品药物过量的临床经验有限，尚无特效解毒剂。应给予对症支持治疗。监测患者的不良反应体征和症状（参见【不良反应】）。

【临床药理学】

药效学

暴露效应

临床试验显示，在所有评价剂量下，本品与日间过度思睡（EDS）存在暴露-效应关系。在第1天观察到清醒维持试验（MWT）的平均睡眠潜伏期增加。

心脏电生理学

基于全面的血药浓度-QTc 分析，在最大推荐剂量下（最高达平均稳态 C_{max} 的16倍），本品未对 QTc 间期产生临床相关影响（即 ≥ 10 ms）。

药代动力学

本品暴露量随剂量成比例增加。每日2次给药时，5天内达到稳态，蓄积比约为1.6。

吸收

每次给药后，本品吸收的中位 T_{max} 为1.5小时（范围：1-4小时）。

与高脂肪高热量餐同服后，未观察到本品的药代动力学出现有临床意义的差异。

分布

本品的表观稳态分布容积约为325L（ $IIV = 19.0\%$ ）。在人血浆中，蛋白结合率较高（ $> 96\%$ ），且本品呈非浓度依赖性变化。全血与血浆浓度比值范围为0.61-0.90。

消除

本品的平均终末消除半衰期约为23.2小时。

代谢

本品主要通过肝脏代谢消除。CYP3A4是参与本品代谢的主要CYP，在循环中未发现主要代谢物。

排泄

单次口服25 mg放射性标记的奥普雷顿片后，粪便回收率为80.5%，尿液回收率为11.0%。通过肾脏排泄的原型药物仅占总清除量的不到1%。

特殊人群

肝功能不全患者

轻度肝功能不全（Child-Pugh A 级）或中度肝功能不全（Child-Pugh B 级）患者与肝功能正常患者的本品暴露量的比较汇总于图1。与匹配的对照组相比，肝功能不全导致的本品暴露量（AUC）升高不超过2倍。

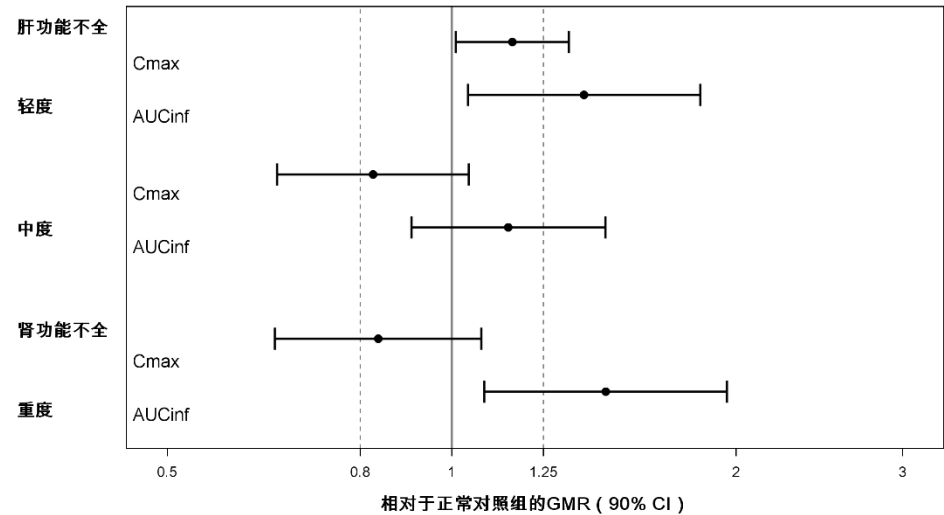
临床试验中未评价重度肝功能不全（Child-Pugh C 级）患者。

肾功能不全患者

重度肾功能不全（eGFR 15-29 mL/min；未接受透析）患者与肾功能正常患者的本品暴露量的比较汇总于图 1。与匹配的对照组相比，肾功能不全导致的本品暴露量（AUC）升高不超过 2 倍。

临床试验中未评价 ESRD 患者（eGFR<15 mL/min 或透析患者）。

图 1. 肝功能不全和肾功能不全对本品药代动力学的影响



其他特殊人群

基于群体药代动力学分析，年龄、性别、人种/种族和体重不会对本品的药代动力学产生临床相关影响。

【临床试验】

在两项多中心、随机、双盲、安慰剂对照、12 周平行组研究[研究 1（NCT06470828）和研究 2（NCT06505031）]中评价了奥普雷顿片的疗效。

在研究 1 中，1 型发作性睡病患者随机接受安慰剂、奥普雷顿片 1 mg 或 2 mg 每日两次给药。在研究 2 中，1 型发作性睡病患者随机接受安慰剂或奥普雷顿片 2 mg 每日两次给药。

研究 1 和研究 2 的主要疗效终点是清醒维持试验（MWT）的平均睡眠潜伏期从基线至第 12 周的变化。次要终点包括 Epworth 思睡量表（ESS）总分、每周猝倒率（WCR）。与安慰剂相比，两种剂量的主要和所有次要终点均显示具有统计学意义的改善（ $p < 0.001$ ）。按性别和人种进行亚组分析，未提示应答差异。

研究 1 和研究 2 的关键疗效结果总结如下。

表 3: 第 12 周时 1 型发作性睡病患者的 MWT、ESS 和 WCR 疗效结果（研究 1 和研究 2）

研究	治疗组 (N)	基线平均值 (SD)	较基线的 LS 平均变化 (SE)	与安慰剂相比的 LS 平均差异 (95% CI)
MWT 的平均睡眠潜伏期 (分钟)				
研究 1	安慰剂 BID* (41)	5.1 (6.8)	-1.3 (1.5)	
	奥普雷顿片 1 mg [†] BID* (61)	5.5 (7.7)	12.5 (1.3)	13.8 (10.2, 17.4)
	奥普雷顿片 2 mg [†] BID* (66)	4.4 (5.5)	15.9 (1.2)	17.2 (13.7, 20.7)
研究 2	安慰剂 BID* (35)	4.1 (4.9)	-1.0 (1.5)	
	奥普雷顿片 2 mg [†] BID* (70)	4.8 (4.9)	19.1 (1.3)	20.1 (16.6, 23.6)
ESS 总分				
研究 1	安慰剂 BID* (41)	18.2 (3.6)	-1.4 (0.8)	
	奥普雷顿片 1 mg [†] BID* (61)	18.2 (2.6)	-9.4 (0.7)	-8.0 (-9.9, -6.1)
	奥普雷顿片 2 mg [†] BID* (66)	19.0 (3.2)	-11.2 (0.6)	-9.8 (-11.6, -7.9)
研究 2	安慰剂 BID* (35)	17.9 (3.0)	-1.6 (0.7)	
	奥普雷顿片 2 mg [†] BID* (70)	17.3 (3.4)	-11.1 (0.6)	-9.5 (-11.1, -8.0)
每周猝倒率				
	治疗组 (N)	较基线的中位百分比变化		发生率比 vs.安慰剂 (95% CI)
研究 1	安慰剂 BID* (41)	-27.7%		
	奥普雷顿片 1 mg [†] BID* (61)	-82.6%		0.3 (0.2, 0.6)
	奥普雷顿片 2 mg [†] BID* (66)	-79.0%		0.4 (0.2, 0.6)
研究 2	安慰剂 BID* (35)	-39.1%		
	奥普雷顿片 2 mg [†] BID* (70)	-88.8%		0.3 (0.2, 0.4)

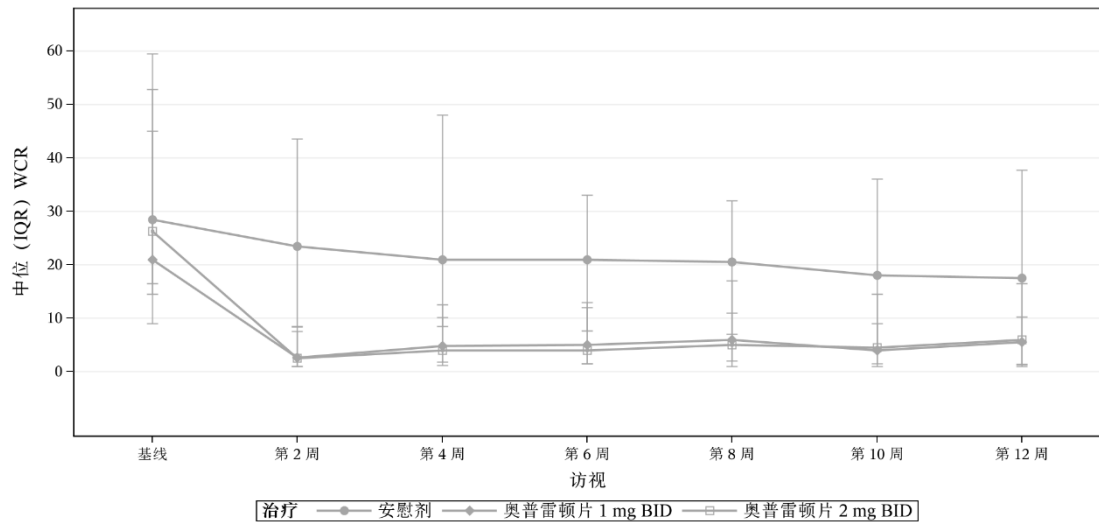
SD = 标准差; SE = 标准误; LS Mean = 最小二乘均值; CI = 置信区间

* 每日两次, 至少间隔 3-5 小时

[†] 经多重性校正后, 在统计学上显著优于安慰剂 (p<0.001)

在第一个的评估时间点 (第 2 周), 奥普雷顿 1mg 和 2mg 每日两次治疗组显示 WCR 改善 (图 2), 并持续至第 12 周。

图 2: 研究 1 中从基线至第 12 周的每周猝倒率



IQR-四分位距

【药理毒理】

药理作用

奥普雷顿治疗 1 型发作性睡病的作用机制被认为是对食欲素受体 2 (OX2R) 的激动作用。食欲素神经肽信号系统在觉醒中发挥作用，激动食欲素受体被认为可以促进觉醒。

毒理研究

遗传毒性

奥普雷顿 Ames 试验、大鼠体内骨髓微核和肝脏彗星试验结果为阴性，体外人 TK6 细胞微核试验结果为阳性。

生殖毒性

在大鼠生育力与早期胚胎发育毒性试验中，雄性大鼠于交配前 9 周和交配期间、雌性大鼠于交配前 2 周至妊娠第 6 天经口给予奥普雷顿 10、100、750 mg/kg/天，雄性大鼠在 750 mg/kg/天[以 AUC 计，为人最大推荐剂量 (MRHD) 的 747 倍]剂量下未见对雄性生育力的影响，雌性大鼠在 750 mg/kg/天 (以 AUC 计，为 MRHD 的 1499 倍) 剂量下可见黄体数、着床数和活胎数减少，在 100 mg/kg/天 (以 AUC 计，为 MRHD 的 455 倍) 剂量下未见对雌性生育力和早期胚胎发育的影响。

在胚胎-胎仔发育毒性试验中，妊娠大鼠于器官发生期 (妊娠第 6~17 天) 经口给予奥普雷顿 10、100、750 mg/kg/天，妊娠兔于器官发生期 (妊娠第 7~20 天) 经口给予奥普雷顿 4、20、100 mg/kg/天，未见胚胎-胎仔发育毒性和致畸性；大鼠剂量为 750 mg/kg/天、兔剂量为 100 mg/kg/天 (以 AUC 计，分别为 MRHD 的 1166 和 153 倍) 时，可见体重降低、体重增量降低和摄食量减少等母体毒性；大鼠剂量达 100 mg/kg/天、兔剂量达 20 mg/kg/天 (按 AUC 计，分别为 MRHD 的 346 和 38 倍) 时，未见明显母体毒性。

在大鼠围产期毒性试验中，大鼠于妊娠第 6 天至哺乳期 20 天经口给予奥普雷顿 1、3、10 mg/kg/天 (以 AUC 计，高剂量为 MRHD 的 118 倍)，未见母体毒性和对子代发育的明显影响。

在妊娠大鼠中可见奥普雷顿的胎盘转运。在哺乳期大鼠乳汁中可检出奥普雷顿。

致癌性

大鼠连续2年经口给予奥普雷顿 1、20、100 mg/kg/天（以 AUC 计，雌、雄性大鼠高剂量分别为 MRHD 的 335 倍、482 倍），未见致癌性。Tg rasH2 小鼠连续 26 周经口给予奥普雷顿，雄鼠剂量为 6、20、60、600 mg/kg/天，雌鼠剂量为 3、30、300 mg/kg/天（以 AUC 计，高剂量分别为 MRHD 的 400 倍、173 倍），未见致癌性。

【贮藏】

密闭，不超过 30℃保存。请将本品放在儿童不能接触的地方。

【包装】

高密度聚乙烯瓶和防儿童开启聚丙烯盖。30 片/瓶，1 瓶/盒；60 片/瓶，1 瓶/盒。

【有效期】

18 个月

【执行标准】

JX20260076

【批准文号】

0.5mg：国药准字 HJ20260068

1mg：国药准字 HJ20260069

2mg：国药准字 HJ20260070

【上市许可持有人】

名 称：Takeda Pharmaceuticals U.S.A., Inc.

注册地址：500 Kendall Street, Cambridge, MA 02142 United States of America

【生产企业】

企业名称：Takeda GmbH

生产地址：Takeda GmbH-Betriebsstätte Oranienburg, Lehnitzstraße 70-98, 16515 Oranienburg, Germany

【境内责任人】

名 称：武田（中国）国际贸易有限公司

地 址：中国上海市上海自由贸易试验区海阳西路 555 号/东育路 588 号 36 层

邮政编码：200126

联系电话：400-069-0980

传真号码：021-68279998

网 址：<http://www.takeda.com.cn>