

# 拟谈判新增药品 利非司特滴眼液 立善卓®

新一代干眼免疫制剂，直击炎症核心，打破干眼恶性循环

博士伦  
BAUSCH+LOMB

  
xiidra  
立善卓  
(lifitegrast ophthalmic solution) 5%

## 1 基本信息

中重度干眼患者占比达**73.7%**，**炎症是干眼的重要病因**，严重影响患者生活质量；现有抗炎治疗方案起效慢、疗效与耐受性受限

---

## 2 创新性

**First-in-class**免疫抗炎药物 **LFA-1 拮抗剂**，阻断T细胞介导的炎症级联反应，打破干眼恶性循环

---

## 3 有效性

利非司特**2周快速起效**，**症状与体征双改善**；疗效**优于环孢素滴眼液（II）**

---

## 4 安全性

**刺激感更轻、停药率更低**，不良事件可控

---

## 5 公平性

新一代免疫抑制剂，弥补环孢素滴眼液（II）的不足，为干眼患者提供**起效快、症状体征双改善**的治疗选择

---

# 利非司特是First-in-class靶向LFA-1拮抗剂，可阻断炎症循环的各个环节，为干眼患者提供新的治疗选择

药品通用名	利非司特滴眼液
注册规格	5% (0.2ml:10mg)
注册分类	<b>3类化药</b> (本品为原研授权，在中国本土地产*，制剂工艺、配方等与原研药完全一致)
说明书适应症	本品适用于治疗干眼 (DED) 的体征和症状
用法用量	滴眼，1次1滴，一日2次，需间隔12小时。本品为单剂量包装滴眼液，不含防腐剂，使用后应立即丢弃
全球首个上市国家	美国
中国大陆首次上市时间	2026年1月
目前大陆地区同通用名药品的上市情况	非独家，共2家厂家 (本品为原研授权*)
是否为OTC药品	否
申报目录类别	<b>基本医保目录</b>

参照药品建议：环孢素滴眼液 (II)  
价值分级建议：改进

- 1 **作用机制类似**

本品与环孢素滴眼液 (II) 均为**免疫抗炎类药物**，而人工泪液仅为对症补水
- 2 **临床应用广泛**

环孢素滴眼液 (II) 是干眼患者**最常用的**免疫抗炎类药物，**市场份额约占95%<sup>1</sup>**
- 3 **医保目录内唯一抗炎药物**

环孢素滴眼液 (II) 为**医保目录内唯一获批干眼适应症**的免疫抗炎药物

## 利非司特滴眼液与环孢素滴眼液 (II) 相比的优势

- **创新性更高**：本品是First-in-class靶向LFA-1拮抗剂，抑制T细胞介导的免疫炎症的**各个环节**，而环孢素仅抑制**部分节点**，因此起效速度差异较大
- **疗效优势**：本品**2周迅速起效**，实现症状体征双改善，患者**满意度及依从性高**；环孢素需**2-3个月起效**
- **安全性良好**：本品眼部刺激性更轻，长期耐受性好，**停药率低**

\*已获得博士伦爱尔兰有限公司专利授权，制剂工艺、配方等与原研完全一致，仅在中国本土地产  
1. 艾昆纬MIDAS数据库

# 炎症是干眼的重要病因，“十四五”眼健康规划强调眼表疾病重要性；干眼诊断流程明确，包含主观症状评估和客观体征检查

## 炎症是干眼发病的重要原因，严重干眼甚至导致失明

- 干眼是一种以眼表炎症为核心、伴随泪膜不稳定的慢性疾病<sup>1</sup>，是非感染性且非创伤性角膜穿孔最常见的原因之一<sup>2</sup>，更严重者甚至导致失明
- 眼干、疼痛和视力模糊是干眼患者最常见症状<sup>1</sup>

## 干眼中重度占比高，严重影响患者生活质量

- 中国干眼患病率约21.0% ~ 52.4%<sup>1</sup>，就诊率仅5.38%<sup>3</sup>，中重度\*占比达73.7%<sup>4</sup>
- 重度干眼对患者生活质量的影响程度与血液透析、重度心绞痛等严重慢性疾病相当<sup>4,5</sup>

## “十四五”眼健康规划强调眼表疾病重要性，干眼诊断流程及诊断标准明确，同时包含“主观症状评估”与“客观体征检查”

### “十四五”眼健康规划



中华人民共和国中央人民政府

www.gov.cn

国家卫生健康委关于印发“十四五”全国眼健康规划（2021-2025年）的通知  
国卫医发〔2022〕1号

- 以习近平新时代中国特色社会主义思想为指导，落实健康中国战略，以人民健康为中心，构建覆盖全生命周期的眼健康服务体系，推动眼病防治向规范化、系统化发展
- 进一步提升眼表疾病等眼病治疗水平

### 干眼诊断主观症状

#### 主观干眼评分（EDS）

- 患者自觉眼干症状严重程度
- 0-100分，分值越高通常表示症状越重

#### 眼表疾病指数（OSDI）

- 综合评估眼部不适、视功能受影响情况
- 0-100分，分值越高通常表示症状越重

### 干眼诊断客观体征

#### 下区角膜荧光素染色评分（ICSS）

- 角膜上皮损伤程度（荧光素染色评分），染色点数≥5个即为中重度
- 基于裂隙灯显微镜检查

#### 泪膜破裂时间（TBUT）

- 泪膜稳定性，TBUT≤5s即为中重度
- 基于裂隙灯（荧光素法）、眼表综合分析仪、泪膜镜

\*采用OSDI评分

1. 中华医学会眼科学分会角膜病学组, 等. 中华眼科杂志, 2024 2. Kate A, et al. Indian J Ophthalmol. 2023. 3. 北京朝阳医院眼科主任陶勇, 2023 “两会健康策”系列直播访谈. 4. Kai JY, et al. Br J Ophthalmol. 2024. 5. 杨梦舒, 等. 眼科学报

# 中国患者亟待起效快及症状、体征双重改善的创新干眼药物；原研利非司特滴眼液在多个国家/地区上市并广泛应用

临床亟需更安全有效、具有多作用靶点和新作用机制、眼内穿透力强、性质稳定的创新干眼药物

- 人工泪液仅补水，无法根本解决炎症问题<sup>1</sup>
- 医保目录内，获批干眼适应症的抗炎药物仅有环孢素滴眼液 (II) <sup>2</sup>
- 环孢素滴眼液 (II) 停药率高，患者依从性差<sup>3</sup>
  - 100位中国干眼患者调研显示，约50%的患者反馈环孢素滴眼液 (II) 起效慢且疗效不稳定 (2-3个月起效) <sup>3</sup>
  - 环孢素滴眼液 (II) 有明显刺痛和灼烧感
- 环孢素滴眼液 (II) 通常需联用人工泪液，患者用药负担及费用更高<sup>3</sup>

抗炎药物原研利非司特滴眼液在美国、加拿大、澳大利亚、韩国等国家/地区上市多年并广泛应用



**2016年 美国FDA批准上市**

- 全球首个同时改善干眼体征和症状的创新药
- 美国眼科学会认可其抗炎地位

**2017年 加拿大卫生部批准上市**

- 成为美国以外首个获批上市的国家

**2018年阿联酋和沙特阿拉伯批准上市**

- 进入中东市场

**2019年 澳大利亚TGA#批准上市**

- 进入北美以外的发达国家市场

国际市场一致认可原研药利非司特滴眼液

#TGA: Therapeutic Goods Administration, 药品管理局

1.中华医学会眼科学分会角膜病学组, 等. 中华眼科杂志, 2024. 2. 国家基本医疗保险、生育保险、工伤保险药品目录 (2025年) . 3. 干眼患者白皮书 (待发表)

# First-in-class靶向LFA-1拮抗剂利非司特分子量小、多环节阻断炎症循环、抑制已活化T细胞迁移，起效显著快于环孢素

对比维度	利非司特	环孢素
起效速度	快 (2周即可显著改善症状和体征) <sup>1</sup>	慢 (2-3个月) <sup>1</sup>
分子量大小	约 615.48 Da (小分子) <sup>2</sup>	约 1202 Da (大分子) <sup>3</sup>
药物性质	水溶性 <sup>4</sup>	脂溶性 <sup>5</sup>
是否需要透过细胞膜	不需要 <sup>6,7</sup>	需要 <sup>5,7</sup>
作用靶点	T细胞/mAPC 表面的 LFA-1 整合素 <sup>4,5,7</sup>	T细胞内部的钙调神经磷酸酶 <sup>5,7</sup>
作用环节	多环节: 4,5,7 ① 抑制mAPC迁移; ② 抑制T细胞活化; ③ 抑制T细胞向眼表迁移; ④ 抑制多种炎症因子的释放	单环节: 5,7 主要抑制T细胞活化 (抑制IL-2生成)
作用于T细胞的步骤	1步: 与T细胞表面LFA-1结合, 直接阻断黏附与活化信号 <sup>8-10</sup>	3步: ①穿透T细胞膜 → ②与亲环蛋白结合 → ③抑制钙调神经磷酸酶 <sup>5,7</sup>
对已活化T细胞的作用	能够抑制 (阻断迁移和募集) <sup>4,5</sup>	无法抑制 (需等待细胞凋亡, 约5-6个月) <sup>5,7</sup>
是否需要透过体循环	不需要 <sup>3</sup> (局部渗透至眼表组织即可)	不需要 (局部渗透为主, 但起效仍依赖组织累积) <sup>5,9</sup>



利非司特 vs 环孢素  
起效快的特性:

分子量小,  
角膜穿透性强

水溶性好,  
无需辅助剂穿透

作用于细胞表面,  
无需穿透T细胞膜

ICAM-1: 细胞间黏附分子-1; LFA-1: 淋巴细胞功能相关抗原-1; APC: 抗原呈递细胞; IL: 白介素

1. Li JX, et al. J Clin Med. 2022. 2. Uğur M, et al. J Pharm Biomed Anal. 2024. 3. Gawande RS, et al. Drug Dev Res. 2024. 4. Assi L, et al. Cochrane Database Syst Rev. 2025. 5. Fan NW, et al. Ocul Surf. 2021. 6. Landsend ECS, et al. J Ophthalmol. 2025. 7. Locatelli EVT, et al. Cornea. 2024. 8. Huang D, Li Z. Front Ophthalmol (Lausanne). 2024. 9. Gordhan HM, et al. J Med Chem. 2023. 10. Oh JY, et al. Ocul Surf. 2022.

# 利非司特获国内外权威指南/共识一致推荐，认可其在症状和体征方面的双重获益

利非司特是指南推荐的抗炎药物，2周快速、显著改善中重度干眼的症状和体征

指南	利非司特	环孢素
TFOS DEWS III 管理和治疗报告(2025) <sup>2</sup>	均用于中重度干眼的抗炎治疗	
	<ul style="list-style-type: none"> <li>2周显著改善干眼症状和体征</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>指南未说明0.05%环孢素滴眼液改善干眼症状和体征的起效时间</li> </ul>
2023年美国眼科学会 (AAO) 干眼临床实践指南 <sup>3</sup>	均用于中重度干眼的抗炎治疗	
	<ul style="list-style-type: none"> <li>3个月期间，体征和/或症状均显示获益</li> <li>12个月内表现出良好的安全性</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>治疗6个月，体征显著改善</li> </ul>
中国干眼临床诊疗专家共识(2024) <sup>1</sup>	中重度干眼均强调抗炎治疗的重要性，且均作为免疫抑制剂推荐	
	<ul style="list-style-type: none"> <li>新型小分子整合素抑制剂，降低由T淋巴细胞介导的干眼炎症反应水平</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>抑制T细胞活化和炎症反应因子释放</li> </ul>

中国、美国首款获批用于治疗干眼体征和症状的药物，临床价值获得干眼国际权威指南一致认可

1.中华医学会眼科学分会角膜病学组, 等. 中华眼科杂志, 2024. 2. Jones L, et al. Am J Ophthalmol. 2025. 3. Amescua G, et al. Ophthalmology. 2024.

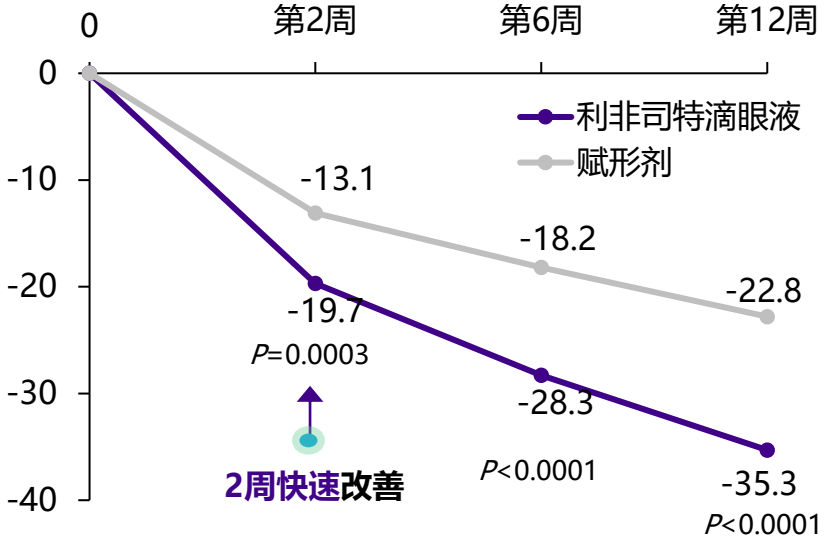
# 中国及国际多中心RCT显示，接受原研授权\*利非司特治疗2周后患者症状和体征改善显著，疗效可持续至少12周

## 利非司特组患者，眼干涩症状快速改善： 2周起效，持续12周<sup>1</sup>



干预措施	利非司特滴眼液 vs. 赋形剂 <sup>#</sup>
样本量	718 (482 vs. 360)
研究类型	国际多中心RCT (OPUS-2)

两组相较基线眼干涩评分 (EDS) 变化

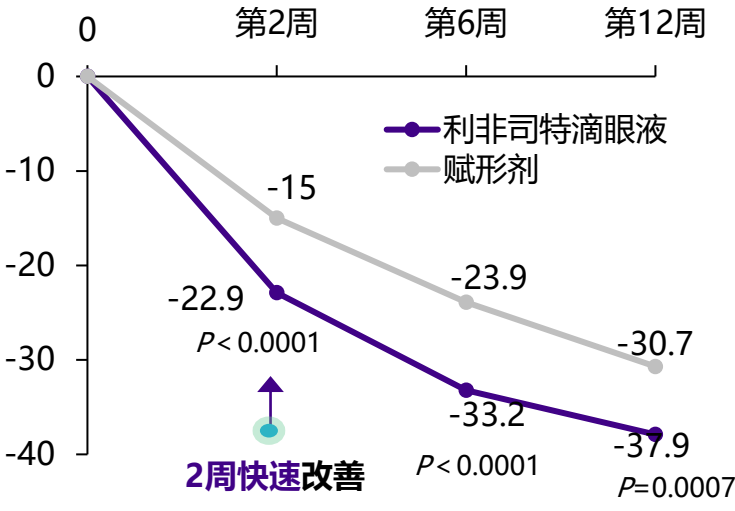


## 利非司特组患者，症状及体征双改善： 眼干涩评分2周显著改善，12周时ICSS多降低27%<sup>2</sup>

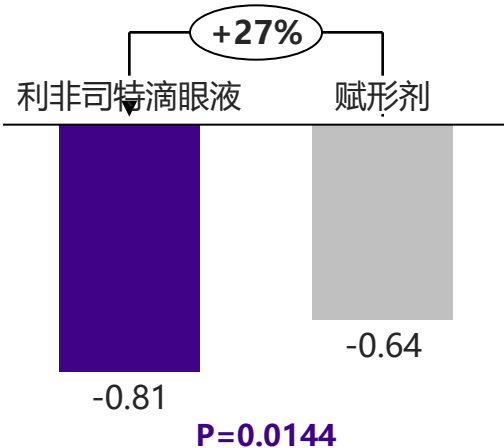


干预措施	利非司特滴眼液 vs. 赋形剂 <sup>#</sup>
样本量	711 (355 vs. 356)
研究类型	国际多中心RCT (OPUS-3)

两组相较基线眼干涩评分 (EDS) 变化



第12周时相较基线下角膜荧光染色评分 (ICSS) 变化



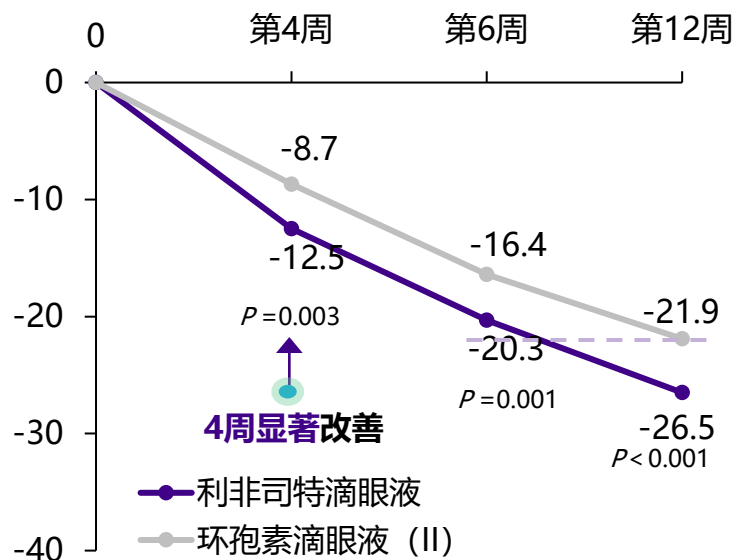
\*已获得博士伦爱尔兰有限公司专利授权，制剂工艺、配方等与原研完全一致，仅在中国本土地产；#赋形剂：对照活性药物成分以外的其他组成成分（即所有辅料）：硫代硫酸钠、磷酸氢二钠、氯化钠、氢氧化钠和/或稀盐酸、注射用水  
1. Tauber J, et al. Ophthalmology, 2015. 2. Holland EJ, et al. Ophthalmology. 2017

# 与环孢素滴眼液 (II) 相比，原研授权\*利非司特治疗4周后患者症状和体征显著改善；真实世界疗效及依从性好

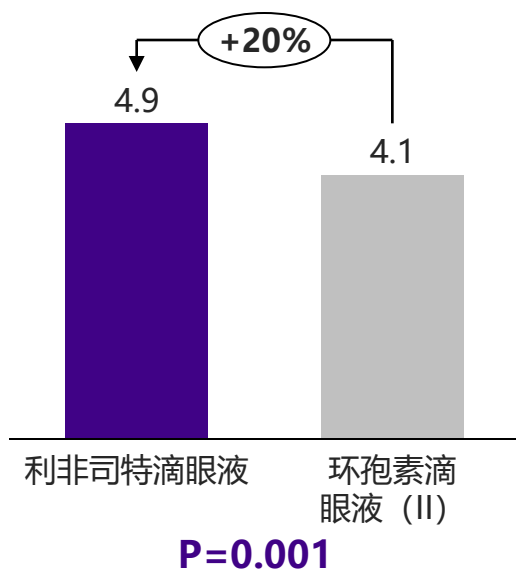
**【症状体征双改善】** 利非司特组患者起效快一倍，利非司特组6周即可接近环孢素组12周疗效；12周时，利非司特组患者TBUT显著延长约20%<sup>1</sup>

- 利非司特滴眼液 vs. 环孢素滴眼液 (II)：亚洲单中心、随机、对照上市头对头试验，纳入110名干眼患者<sup>#</sup>

两组相较基线主观症状眼表疾病指数 (OSDI) 变化



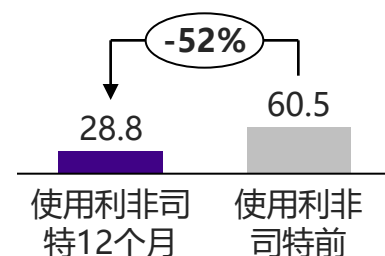
第12周时相较基线客观体征泪膜破裂时间TBUT变化 (s)



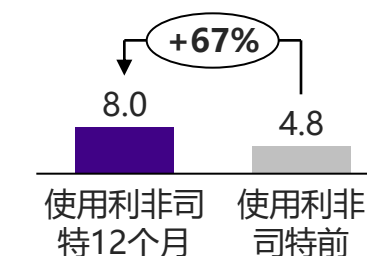
使用12个月时，利非司特组患者维持症状、体征双改善，长期疗效及依从性好

- 美国、加拿大开展的多中心、非干预性、回顾性真实世界研究，纳入600例干眼患者，最长随访时间为24个月<sup>1</sup>
- 利非司特长期有效性好，症状、体征双改善

眼表疾病指数 (OSDI)



泪膜破裂时间TBUT变化



- 美国多中心回顾性真实世界研究，纳入40,573例干眼患者，利非司特使用时长相比环孢素长约1个月<sup>2</sup>

\*已获得博士伦爱尔兰有限公司专利授权，制剂工艺、配方等与原研完全一致，仅在中国本土地产

<sup>#</sup>该研究为前瞻性随机对照头对头研究，但未设定非劣效界值或优效性假设，本质为探索性比较研究，但结果采用P值进行组间差异分析，且结果显示差异有统计学意义

1. Agarwal S, et al. International Journal of Life Sciences, Biotechnology and Pharma Research, 2025. 2. Hovanesian JA, et al. Clin Ophthalmol. 2021.

# 原研授权\*利非司特为干眼患者提供一种可长期使用且安全耐受的选择

## 药品说明书记载的安全性信息： 易于临床管理<sup>1</sup>

治疗相关不良反应 (发生率≥1%)	利非司特滴眼液组 (N=482)	安慰剂组 (N=481)
视物模糊	23 (4.8%)	0
眼痛	19 (3.9%)	4 (0.8%)
味觉倒错	13 (2.7%)	1 (0.2%)
滴用部位 局部刺激作用	11 (2.3%)	0

- 利非司特大多数不良反应都是一过性的，且为轻度<sup>2</sup>
- 最常见的不良反应为视物模糊，且通常无需特殊干预<sup>3</sup>
- 老年患者使用本品的安全性和有效性与其他成年患者未见总体差异

## 利非司特相比于环孢素滴眼液 (II)，滴眼后舒适度更高

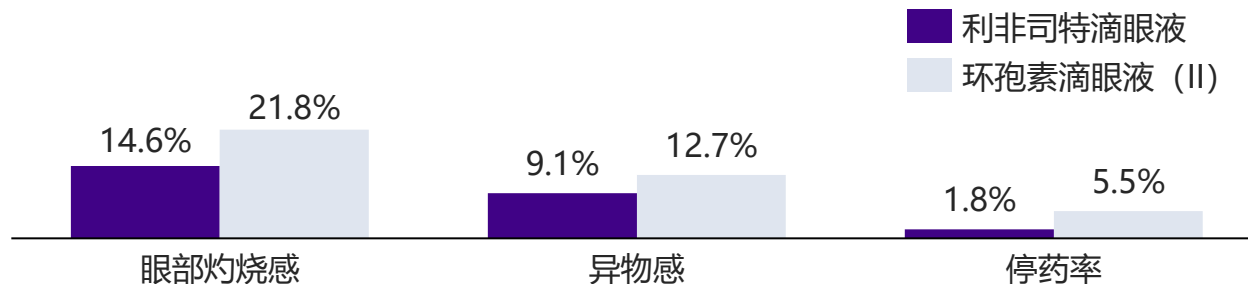
利非司特滴眼后舒适度下降在**3分钟内改善**<sup>3</sup>



环孢素滴眼液 (II) 滴眼后刺激症状**20分钟内缓解**<sup>4</sup>

## 头对头研究显示，相比环孢素滴眼液 (II)，使用利非司特的患者眼部不良事件发生率及停药率均更低<sup>5</sup>

使用利非司特和环孢素滴眼液 (II) 不良反应发生率(%)<sup>#</sup>



单中心随机对照研究纳入了110名临床诊断为OSDI≥23的DED患者

\*已获得博士伦爱尔兰有限公司专利授权，制剂工艺、配方等与原研完全一致，仅在中国本土地产；#利非司特组头痛发生率5.5%，但未提示与治疗相关

1. 利非司特滴眼液 (立善卓®) 说明书. 2. Tauber J, et al. Ophthalmology, 2015. 3. Donnenfeld ED, et al. Cornea. 2016. 4. 殷丽,等. 南京医科大学学报 (自然科学版), 2025. 5. Agarwal S, et al. International Journal of Life Sciences, Biotechnology and Pharma Research, 2025

# 利非司特，First-in-class靶向LFA-1拮抗剂，为干眼患者提供起效快、症状体征双改善的治疗选择

## 提升公共健康获益，符合“十四五”眼健康规划

- “十四五”眼健康规划强调眼表疾病防治重要性
- 干眼患病率达到**21.0% ~ 52.4%**<sup>1</sup>，中重度干眼患者占比高达**73.7%**<sup>2</sup>，重度干眼生活质量受影响大，严重者导致角膜穿孔甚至失明
- **疗效好、起效快及症状、体征双重改善**是干眼治疗的主要需求及管理目标

## 符合“保基本”原则

- **可替代目录内已有的环孢素滴眼液（II）**，医保基金支出增量有限
- **疗效及安全性相比环孢素均具有优势**，可减少干眼患者对人工泪液及其他辅助疗法的依赖，其中联合人工泪液比例降低**30.3%**<sup>3</sup>，**降低用药及经济负担**

## 弥补目录短板

- **First-in-class靶向LFA-1拮抗剂，直击炎症核心，打破干眼恶性循环**，弥补医保目录内无全链条抗炎药物的短板
- **2周起效快速**，疗效优于现有免疫抗炎药物，满足患者**快速缓解**的治疗需求，**实现症状体征双改善**，**弥补了目录内无快速起效药物的空白**

## 易于临床管理

- 干眼临床诊断依赖**客观体征和主观症状**，诊断标准明确，**不易出现药物滥用**
- **不良事件可控**，与现有抗炎治疗药物相比无新增不良事件，且通常无需额外处理，临床管理难度低