

# 洛索洛芬钠滴眼液（润尔卓®）

- 国内首个明确获批用于**白内障手术【炎症+疼痛】**的**双效**非甾体抗炎药
- 说明书明确**规范白内障手术全流程用药管理**的非甾体抗炎药
- 领域内**唯一有中国III期临床试验**有效性和安全性证据的非甾体抗炎药

申报企业：润尔眼科药物（广州）有限公司



# 目录

01

## 基本信息

- ❖ 国内首个明确获批用于白内障**术后炎症+疼痛**的NSAID
- ❖ **唯一有中国III期临床试验有效性和安全性**证据的NSAID

02

## 创新性

- ❖ **领域内首个前体药物设计**眼用NSAID，有效降低角膜刺激
- ❖ **首次全覆盖白内障手术【炎症+疼痛】、规范【术前1天+术后2周】全流程用药管理**
- ❖ 相比其他NSAID，**用药频次减少一倍，疗程大幅缩短**，有效提升用药依从性

03

## 安全性

- ❖ **无中重度治疗相关AE；轻度AE整体发生率低，且为一过性，无需干预**
- ❖ 相比其他NSAID，**无重大不良反应，具备角膜保护及干眼改善功能，眼部耐受性优**

04

## 有效性

- ❖ **有效治疗白内障术后炎症；术前1天使用可有效减轻术后早期炎症**
- ❖ **有效治疗白内障术后疼痛**

05

## 公平性

- ❖ 限白内障手术患者使用，替代现有NSAID，**适用人群清晰且无增量，基金冲击可控**
- ❖ 弥补“抗炎+镇痛”空白的同时，**规范用法用量且疗程明确，方便临床管理**

# 当前白内障术后常用的NSAID抗炎药物难以同时兼顾安全性、持续抗炎与疼痛控制，以及围手术期规范使用，临床未满足需求显著

白内障是全球首位致盲性眼病<sup>1,2</sup>，手术是主要疗法，但术后炎症与疼痛会严重影响患者术后恢复

❖ 白内障术后炎症控制不足可导致并发症并影响视觉恢复，甚至造成不可逆损害



❖ 术后疼痛可能引发并发症，并降低依从性，削弱整体治疗获益



目录内现有NSAID滴眼液难以兼顾安全耐受、持续抗炎、有效镇痛与良好依从性

白内障术后治疗常用方案：**激素与非甾体抗炎药物(NSAID)局部联合用药**<sup>9</sup>

目录内现有NSAID滴眼液：

- 1 长期使用存在角膜损伤（甚至溃疡、穿孔）等安全性风险<sup>10</sup>
- 2 均未获批“术后疼痛”适应症<sup>11,12</sup>
- 3 尚未规范“术前”用法用量
  - 术前启动治疗可显著降低高危患者术中瞳孔缩小及术后黄斑囊样水肿发生风险<sup>13</sup>
- 4 用药频次较高且无固定疗程，患者依从性差
  - 与每日2次给药相比，每日>2次给药不依从风险（OR）约为1.33倍<sup>14</sup>
- 5 缺乏中国人群临床证据

临床上亟需兼顾**安全性、持续抗炎镇痛以及良好依从性的创新治疗方案**

来源：1.中华医学会儿科学分会白内障及屈光手术学组. 中国成人白内障摘除手术指南（2023年）[J]. 中华眼科杂志, 2023, 59(12): 977-987.; 2. 黄可馨, 陈庆峰. 1990—2021年中国白内障疾病负担变化趋势分析及发展趋势预测[J]. 数理医药学杂志, 2024, 37(12): 888-898.; 3. 张宇, 葛梓樱, 李宁, 等. 干眼症在白内障术后患者中的发生情况及相关影响因素分析[J]. 现代医学与健康研究电子杂志, 2023, 7(22): 121-125.; 4. Ta H, McCann P, Xiao M, et al. BMC Ophthalmol. 2025;25(1):18. Published 2025 Jan 13.; 5. 中华医学会儿科学分会白内障及人工晶状体学组. 中国白内障围手术期干眼防治专家共识(2021年)[J]. 中华眼科杂志, 2021, 57(01): 17-22.; 6. Gangaputra S, Newcomb C, Ying GS, et al. Am J Ophthalmol. 2024;267:182-191.; 7. Porela-Tiihonen S, Kaarmiranta K, Kokki M, Purhonen S, Kokki H. Clin Ophthalmol. 2013;7:1429-1435.; 8. 中华医学会儿科学分会. 成人手术后疼痛处理专家共识. 临床麻醉学杂志, 2017, 33(9): 911-917.; 9. 中华医学会儿科学分会白内障及人工晶状体学组. 我国白内障围手术期非感染性炎症反应防治专家共识(2015年)[J]. 中华眼科杂志, 2015, 51(03): 163-166.; 10. Rigas B, Huang W, Honkanen R. Surv Ophthalmol. 2020;65(1):1-11.; 11. 普拉洛芬滴眼液说明书; 12. 溴芬酸钠滴眼液说明书; 13. Alnagdy AA, Abouelkheir HY, El-Khouly SE, Tarshouby SM. Int J Ophthalmol. 2018;11(4):616-622. Published 2018 Apr 18.; 14. Vandenbroeck S, De Geest S, Dobbels F, Fieuws S, Stalmans I, Zeyen T. J Glaucoma. 2011;20(7):414-421.

# 洛索洛芬钠滴眼液是国内首个明确获批用于白内障术后炎症+疼痛，且唯一有中国III期临床明确证据的非甾体抗炎药，为白内障围手术期用药管理带来有效安全可靠的选择

药品通用名	洛索洛芬钠滴眼液
注册分类	2.2类; 2.4类
说明书适应症	用于治疗白内障术后炎症和疼痛
规格	0.4% (5ml: 20mg, 按C <sub>15</sub> H <sub>17</sub> NaO <sub>3</sub> 计)
用法用量	滴眼给药, 术前1天至术后2周, 患眼每天早晚各给药1次, 每次每眼1滴, 手术当天术前30~120min及术后各给药1次。
作用机制	环氧合酶(COX)抑制剂
首个上市国家	中国
中国大陆首次上市时间	2026年6月
目前大陆地区同通用名药品的上市情况	<b>无, 独家药品</b>
是否OTC药品	否

## 参照药物选择建议: 溴芬酸钠滴眼液

- 1 作用机制相同** 均为COX抑制剂, 核心作用机制相同
- 2 医保支付范围最相似** 溴芬酸钠医保支付限制为眼部术后炎症, 与本品相似
- 3 临床应用最接近** 日给药频次一致, 均为每日2次
- 4 临床试验终点相似** 临床试验炎症和疼痛控制相关指标最相似

## 相较目录内NSAID滴眼液

洛索洛芬钠滴眼液	其他现有NSAID滴眼液
 唯一有中国人群III期临床证据	基于国外或上市后研究
 唯一获批【炎症+疼痛】适应症	均未获批疼痛适应症
 唯一明确规范围手术期用法用量和疗程	无规范围手术期用法用量及疗程
 安全性良好, 眼部耐受性优	溴芬酸钠可引起角膜溃疡、穿孔等严重角膜损伤, 造成不可逆视力损害

# 制剂创新：基于洛索洛芬钠分子本身极强的抗炎止痛效果，开发全球首个洛索洛芬钠全新给药途径，结合前体药物设计及玻璃酸钠辅料，分布更快、安全性更高



**全球首个洛索洛芬钠滴眼剂型，  
基于原分子超强镇痛，眼用更高效**

**中国首个前体药物设计的眼用NSAID，  
分布更快，安全性更高**

**辅料添加玻璃酸钠，  
角膜耐受性更高**

创新机制

- 洛索洛芬钠镇痛效果比传统NSAID等常用抗炎药物强10-20倍<sup>1</sup>
- 解决角膜通透性、pH/渗透压舒适性、无菌控制等多重制剂工艺问题

- 丙酸前体药物<sup>3</sup>，pH偏中性<sup>4</sup>，快速穿透角膜
- 原型在眼表无药理活性，经眼内羧基还原酶催化迅速转化为反式醇代谢物起效

- 玻璃酸钠能增加液体黏度
- 具有高保水性，在眼表形成润滑保护膜

患者获益

- 中国III期试验中验证了其在白内障术后显著镇痛作用
- 无血-房水屏障限制，实现局部高浓度暴露
- 全身暴露低，安全性良好<sup>2</sup>

眼内快速转化分布，  
活性成分在房水快速达峰：  
**0.83h<sup>5</sup> vs. 2h<sup>6</sup>**（溴芬酸钠）

入眼后才转化起效，减少对角结膜  
上皮层的直接刺激

- 延长药物在眼表停留时间
- 稳定泪膜，改善干燥；  
减少摩擦，保护角膜<sup>7</sup>

来源：1. ロキソニン錠60mg/ロキソニン細粒10% IF文件.PMDA. 2.洛索洛芬钠中国说明书. 3. Tanaka Y, et al. Drug Metab Pharmacokinet. 1993;8(4):521-536. 4. 洛索洛芬钠成分资料.日本国立卫生科学研究所. 5. 洛索洛芬钠滴眼液对新西兰兔滴眼给药药代动力学试验探索研究（内部资料）. 6. Cho H, et al. Clin Ophthalmol. 2009;3:199-210. 7. Lazzara F, et al. International Journal of Molecular Sciences, 2021, 22(13): 7010.

# 应用创新：弥补白内障“抗炎+镇痛”空白，规范“术前1天+术后2周”全流程用药，显著缩短用药频次和疗程，推动中国白内障围手术期用药规范化升级

## 首次全覆盖 抗炎+镇痛适应症， 明确规范 术前1天+术后2周全流程用药管理

当前缺口



现有NSAID滴眼液  
仅获批炎症治疗<sup>1</sup>



炎症在术中即被触发<sup>2</sup>，  
指南推荐术前启动用药<sup>3,4</sup>，  
但现有产品未规范术前用法

明确规范



本品经III期验证，  
首次明确覆盖  
“抗炎+镇痛”适应症



明确“术前1天+术后2周”  
完整路径，可预防术中瞳  
孔缩小以及术后炎症  
等并发症

基于高等级证据，推动围术期抗炎镇痛管理规范化升级

## 0.4%高浓度制剂，减少一倍用药次数， 同时大幅缩短治疗时长，显著提高依从性

当前缺口

多数药品给药  
频次高\*

4次/天

未明确疗程，  
按指南使用超4周<sup>5,6</sup>

4-6周  
/周期

老年患者为主，  
依从性差

30%  
不依从率<sup>7</sup>

提高依从性

本品日给药次  
数降低

2次/天

本品说明书  
疗程固定

16天  
全疗程

提高依从超10%

+10%  
依从提升<sup>8</sup>

本品降低执行难度，特别是需交替给药患者，给药负担显著减轻

备注：普拉洛芬滴眼液及双氯芬酸钠滴眼液均为4次/天

来源：1. 非甾体滴眼液说明书。；2. 我国白内障围手术期非感染性炎症反应防治专家共识(2015年).中华眼科杂志。；3. 《成人白内障手术操作规范》2026版.中国国家卫生健康委。4. 《成人白内障临床实践指南》2021版.美国眼科学会(AAO)。；5. 胥陶,等. 中国医学创新,2018,15(33):110-113。；6. 《中国成人白内障摘除手术指南》2023版. 中华医学会眼科学分会。；7. Matossian, C. US Ophthalmic Review, 2020,13(1), 18-22。；8. Coleman CI, et al. J Manag Care Pharm. 2012;18(7):527-539.

# 洛索洛芬钠滴眼液整体安全性良好，较同类NSAID，可降低角膜刺激和损伤风险，展现更优眼部耐受性

## III期临床试验显示 安全性良好

未发生中重度  
不良反应

轻度不良反应事件  
发生率较低，  
且为一过性，无需干预

无全身不良反应，  
眼部不良事件发生率  
低于安慰剂

说明书明确  
老年患者剂量与成人相同，  
无需调整剂量

## 相比其他非甾体抗炎药物，洛索洛芬钠滴眼液眼部耐受性较好

无角膜溃疡及角膜穿孔等重大不良反应

非一过性不良反应发生率：

AE 事件	洛索洛芬钠滴眼液	溴芬酸钠		普拉洛芬
		III期RCT <sup>2</sup>	中国说明书	中国说明书
数据来源	III期RCT <sup>1</sup> , 说明书	III期RCT <sup>2</sup>	中国说明书	中国说明书
结膜炎	0	结膜充血2.2%	0.29%	结膜充血0.27%;
眼睑炎	0	/	0.23%	0.12%
浅表层角膜炎	0	/	0.16%	0.07%
其他重要不良反应	无	⚠️ 角膜糜烂 0.42% 角膜上皮剥离 0.03%		无
重大不良反应	无	⚠️ 角膜溃疡及角膜穿孔		无

- 丙酸前体型药物，局部pH更接近生理<sup>3</sup>，降低角膜上皮刺激，眼表细胞损伤小
- 辅料含玻璃酸钠，具有润滑作用，降低角膜损伤及干眼风险<sup>4</sup>
- 动物试验证实可以保护角膜、改善干眼、提升泪膜稳定性

- 溴芬酸钠滴眼液易造成角膜损伤，其中国说明书标注曾出现**角膜溃疡及角膜穿孔**等重大不良反应

- 普拉洛芬中的吡喃结构及辅料PS80，导致其制剂和储存中更易产生氧化降解杂质<sup>5</sup>，增加角膜磨损刺激，降低患者用药感受

简称：PS80: 聚山梨酯80

来源：1. 企业内部数据。2. Eric D. et al., Ophthalmology, 2007. 3. 洛索洛芬钠成分资料. 日本国立卫生科学研究所; 4. Lazzara F, et al. International Journal of Molecular Sciences, 2021, 22(13): 7010.

5. 张桢珍, 等. 中国现代应用药学, 2025, 42(7): 1132-1139.

# 非甾体抗炎药物被国内外多项指南和专家共识推荐用于白内障围手术期炎症和疼痛治疗



国内外多项指南/专家共识推荐非甾体抗炎滴眼液用于白内障围手术期用药作为标准治疗，且推荐术前1天用药用于降低术中缩瞳，术后炎症以及并发症风险

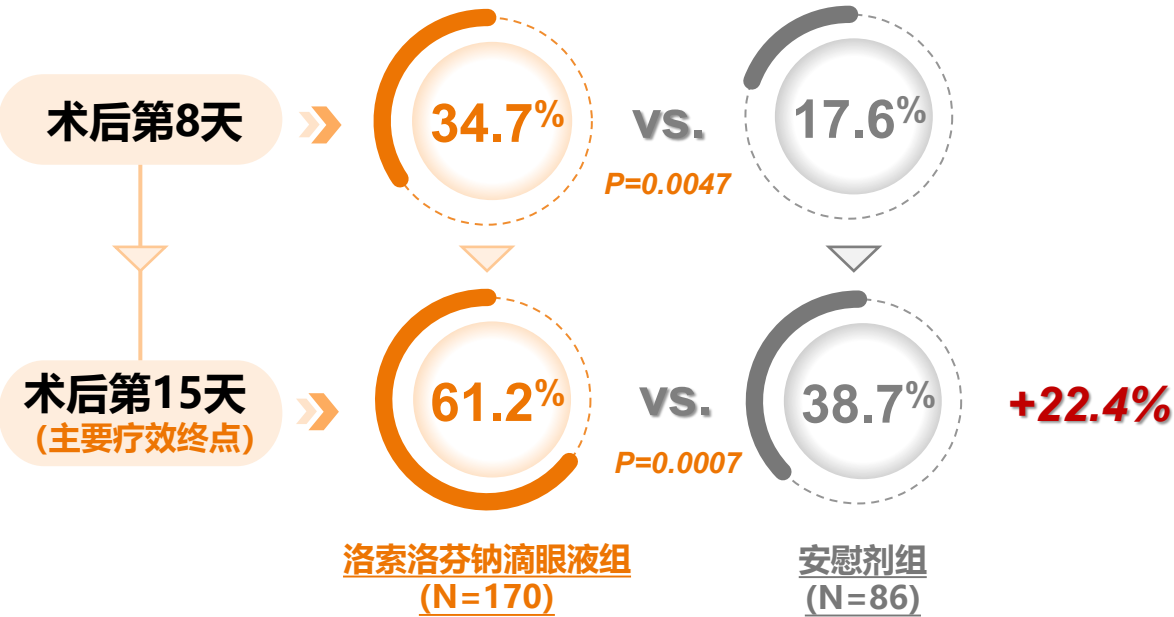
	国内外权威指南	年份	推荐内容描述
中国	《成人白内障手术操作规范》 中国国家卫生健康委	2026年	<p><b>术后常规用药：</b>建议应用抗生素滴眼液、联合使用糖皮质激素和<b>非甾体抗炎药滴眼液</b></p> <p><b>围手术期用药：</b>建议糖尿病患者<b>在围手术期使用非甾体类抗炎药物</b>，以预防术中瞳孔缩小、黄斑囊样水肿，减轻炎症反应</p>
	《中国成人白内障摘除手术指南》 中华医学会眼科学分会白内障学组	2023年	<p><b>术后用药：</b>术后常规建议使用<b>非甾体抗炎药滴眼液</b>，常规使用4-6周</p>
	《白内障健康管理流程专家共识》 中国康复医学会视觉康复专业委员会	2024年	<p><b>术前用药：</b>若为飞秒激光辅助白内障手术，建议术前1天点用<b>非甾体类抗炎眼药</b>；合并糖尿病者可术前1周使用<b>非甾体类抗炎眼药</b></p> <p><b>术后用药：</b>高度近视、青光眼、糖尿病等糖皮质激素反应过强者，可联合<b>非甾体类抗炎眼药</b></p>
国际	《成人白内障临床实践指南》 美国眼科学会(AAO)	2021年	<p><b>围手术期用药：</b>建议对高危眼患者在围手术期预防性使用<b>非甾体抗炎药</b>以预防黄斑囊样水肿。<b>术前和术后立刻给予非甾体抗炎药</b>可能加速术后前几周的视力恢复</p>
	《现代白内障手术的争议、共识和指南》 亚太眼科教授学会 (AAPPO)	2025年	<p><b>术后用药：</b>对于无并发症的白内障手术，术后用药包括局部类固醇、抗生素、<b>非甾体类抗炎药</b>和人工泪液；且<b>术后第一天访视和处方泪液替代品</b>是非常必要的</p>

# 中国III期临床试验结果显示，洛索洛芬钠滴眼液可有效治疗白内障术后炎症，且术前1天使用可有效减轻术后早期炎症

洛索洛芬钠滴眼液可有效治疗白内障术后炎症

洛索洛芬钠滴眼液术后第8天和第15天实现炎症分级最轻（即ACC和ACF分级均为0级）的患者比例均显著高于安慰剂组

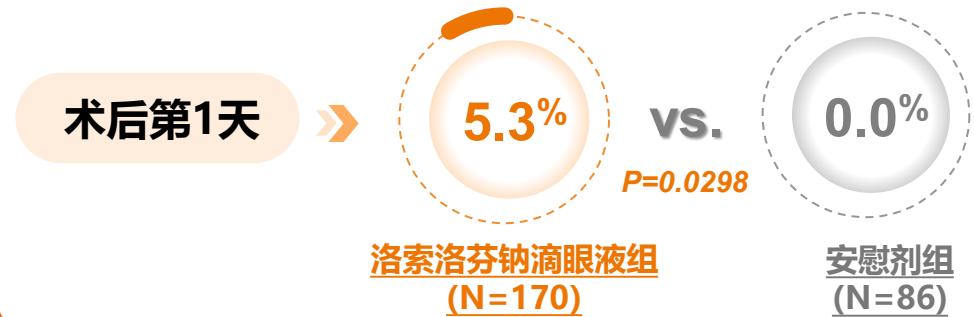
ACC和ACF分级均为0级的受试者比例



术前1天使用洛索洛芬钠滴眼液可有效减轻术后早期炎症

术前1天使用洛索洛芬钠滴眼液，术后第1天，炎症分级最轻（ACC及ACF分级均为0级）的患者比例即显著高于安慰剂组

ACC和ACF分级均为0级的受试者比例



中国多中心、随机、双盲、安慰剂平行对照III期临床试验，炎症相关疗效终点：ACC和ACF分级均为0级的受试者比例

- ACC：前房细胞，根据细胞计数分为0-4级，细胞越多则分级越高，提示炎症越活跃。因此，**0级代表炎症最轻**，4级代表炎症最重
- ACF：前房闪辉，根据前房闪辉特征分为0-3级，闪辉特征越严重则分级越高，提示血-房水屏障受损越严重。因此，**0级代表无受损**，3级代表严重受损

注：ACC：前房细胞（Anterior Chamber Cell），反映前房内炎症细胞的数量，是评估炎症活动程度的核心指标。检查时在裂隙灯下计数，细胞越多代表炎症越重。分级（细胞计数）：0级（0），1级（1-5），2级（6-15），3级（16-30），4级（>30）；ACF：前房闪辉（Anterior Chamber Flare），反映前房内蛋白质的浓度，是由于血-房水屏障破坏导致蛋白渗出，用于评估屏障功能受损程度，即炎症的“严重性”或“渗透性”。0级（与正常眼相比无可见闪辉），1级（轻度：瞳孔区可见闪辉，虹膜区不可见闪辉），2级（中度：虹膜区和瞳孔区均可见闪辉），3级（重度：极为密集的闪辉，或裂隙灯低倍镜下观察眼前节仍呈“混浊”样外观，或表现为显著的丁达尔（Tyndall）效应）

# 中国III期临床试验结果显示，洛索洛芬钠滴眼液可有效治疗白内障术后疼痛

## 洛索洛芬钠滴眼液为同领域唯一覆盖【疼痛】适应症

白内障手术技术迭代和设备革新已显著减轻术后切口疼痛，因炎症控制不足仍可导致疼痛

炎症相关的疼痛随炎症发展波动和反复，难以随时间缓解

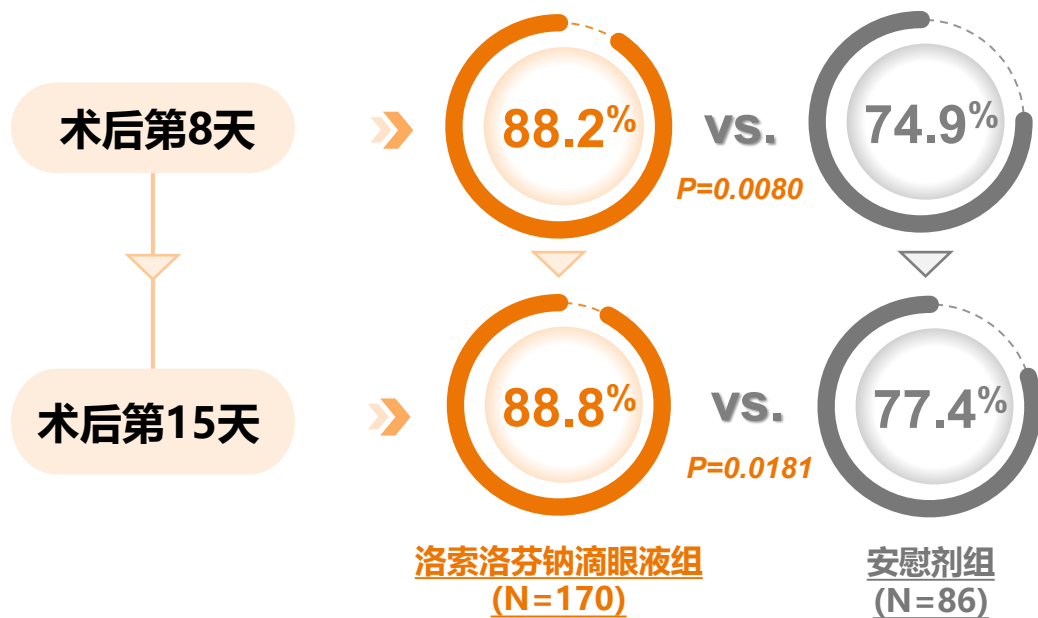
疼痛和炎症相互协同放大，疼痛应激可诱导炎性介质释放，加重炎症反应

随医疗条件提升，患者对手术舒适度要求提高，术后抗炎治疗药物兼顾镇痛的需求升级

## 洛索洛芬钠滴眼液可有效治疗白内障术后疼痛

洛索洛芬钠滴眼液术后第8天和第15天实现疼痛分级最轻（即疼痛分级为0级）的患者比例均显著高于安慰剂组

### 疼痛分级为0级的受试者比例



中国多中心、随机、双盲、安慰剂平行对照III期临床试验，疼痛相关疗效终点：疼痛分级为0级的受试者比例

根据医生判断患者眼部状况，对访视前24h内的疼痛程度进行评估分级，0-5级分级越高代表疼痛程度越高，0级代表疼痛最轻，5级代表疼痛最重

注：疼痛，0级（无痛感），1级（有轻度痛感或不适），2级（轻度：可以忍受的疼痛），3级（中度：中度或较长时间的疼痛需要使用OTC止痛药对乙酰氨基酚），4级（中重度：较长时间的疼痛需要使用除对乙酰氨基酚外的OTC止痛药），5级（重度：强烈的眼痛、眼周痛或放射痛需要处方类止痛药）

# 在基金影响可控前提下，洛索洛芬钠滴眼液弥补白内障术后抗炎镇痛管理短板，以低频给药和更短疗程提升依从性，惠及老年患者与公共眼健康



## 低频给药、疗程缩短，显著提高依从性

- **每日2次给药**显著简化术后用药方案（现有大多需**4次/天**），降低执行难度，提高依从性
- **术后疗程明确为2周**，相比常规**4-6周治疗**，疗程缩短

## 弥补“抗炎+镇痛”空白，规范围手术期用药



- 首次用于白内障围手术期炎症和疼痛控制，填补了目前医保目录在术后疼痛管理方面的空白
- **用药覆盖术前1天至术后2周且用法用量规范**，更有效控制早期炎症并降低术后并发症风险，**推动围手术期管理升级**

### 填补围手术期 抗炎镇痛空白



## 替代现有NSAID产品， 且疗程更短，不会造成额外基金增量

- 本品**仅用于白内障手术患者**，适用人群清晰，无滥用风险
- 替代现有NSAID，**无额外基金增量**
- **用药周期短、疗程固定**，单支5ml规格可满足疗程用量需求
- **减少因炎症控制不足或角膜损伤带来的额外医疗资源消耗**

## 用药安全性佳，便于基层使用监管



- 产品安全性佳，**无重大不良反应**，无需复杂监测要求，没有临床管理负担
- 强效抗炎镇痛，且用法用量明确，方便手术技术欠发达地区规范用药
- **老年患者无需调整剂量，全效发挥作用**