

核准日期：2023 年 08 月 08 日
修改日期：2023 年 08 月 15 日
修改日期：2023 年 08 月 28 日

汇亮® 外

地夸磷索钠滴眼液说明书

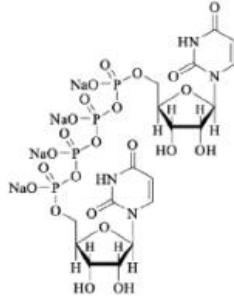
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称：地夸磷索钠滴眼液
英文名称：Diquafosol Sodium Eye Drops
汉语拼音：Dikualinsuona Diyanye

【成份】

活性成分：地夸磷索钠
化学名称： P^1, P^4 -二(5'-尿苷基)四磷酸酯四钠
化学结构式：



分子式： $C_{18}H_{22}N_4Na_4O_{23}P_4$

分子量：878.23

辅料：磷酸氢二钠十二水合物、氯化钠、氯化钾、稀盐酸、氢氧化钠、苯扎氯铵（每 1ml 中含苯扎氯铵 0.075mg）、注射用水。

【性状】

本品为无色的澄明液体。

【适应症】

适用于经诊断为伴随泪液异常的角结膜上皮损伤的干眼患者。

【规格】

3%（5ml：150mg）

【用法用量】

一般 1 次 1 滴，1 日滴眼 6 次。

【不良反应】

在日本共计 655 例患者参加的临床试验中，发现不良反应（包括临床检查值异常在内）的为 155 例（23.7%）。主要不良反应为眼刺激感 44 例（6.7%）、眼分泌物 31 例（4.7%）、结膜充血 24 例（3.7%）、眼痛 18 例（2.7%）、眼痒 16 例（2.4%）、异物感 14 例（2.1%）、眼不适感 7 例（1.1%）等。

发生率 种类	5% 以上	0.1%~5%以下
过敏性疾病	—	眼睑炎
眼	刺激感	眼分泌物、结膜充血、眼痛、眼痒、异物感、不适感、结膜下出血、眼异常感（干燥感、不适感、发黏）、雾视、畏光、流泪
其他	—	头疼、嗜酸粒细胞增多、ALT（GPT）升高

在中国共计 201 例患者参加的临床试验中，发现不良反应 24 例（11.9%），均为眼局部不良反应。主要不良反应为眼分泌物 8 例（4.0%）、眼刺激感 6 例（3.0%）、眼痒 5 例（2.5%）、眼充血 4 例（2.0%）、眼痛 4 例（2.0%）等。此外，该项临床试验中还发现以下不良事件：咽炎、口腔溃疡、慢性咽炎、鼻炎、血小板降低、 γ -GTP 升高、尿白细胞升高、尿菌阳性、谷草转氨酶升高，尚不能确认这些不良事件与本品的相关性。

中国 III 期临床试验不良反应列表

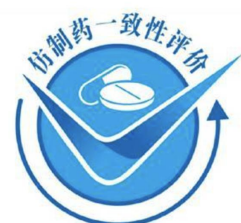
发生率 种类	5% 以上	0.1%~5%以下
眼	—	眼分泌物、眼刺激感、眼痒、眼充血、眼痛、视物模糊、异物感、畏光

【禁忌】

对本品任何成份有过敏史的患者。

【注意事项】

1. 用药途径：仅限于滴眼使用。
2. 用药时：
 - 1) 为了防止污染药液，滴眼时应注意避免容器的前端直接接触眼部。
 - 2) 在联合使用其他滴眼剂时，患者用药间隔时间至少 5 分钟以上。
 - 3) 患者配戴隐形眼镜时应避免滴眼。（本品中含有的苯扎氯铵会被隐形眼镜吸附。）
3. 本品开封后请在 28 天内使用，过期应丢弃。



【孕妇及哺乳期妇女用药】

未进行该项实验且无可靠参考文献

【儿童用药】

本品对儿童的安全有效性尚未确立（无使用经验）。

【老年用药】

未进行该项实验且无可靠参考文献。

【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

地夸磷索钠系二核苷酸衍生物，通过作用于结膜组织以及杯状细胞膜上的 P2Y2 受体，使细胞内钙离子浓度升高，促进含有水分及粘蛋白的泪液分泌，使泪液层在质和量两方面接近正常状态，进而改善角膜上皮损伤。

毒理研究

遗传毒性

在体外细菌回复突变试验、CHO 哺乳动物细胞染色体畸变试验、小鼠淋巴瘤 tk 试验，以及体内小鼠微核试验中，无论有无代谢活性，地夸磷索钠的反应均为阴性。

生殖毒性

雄性和雌性大鼠分别静脉注射地夸磷索钠 30mg/kg/天和 100mg/kg/天，剂量分别相当于人临床日推荐剂量 0.3mg/kg 的 100 倍和 333 倍，未见对雌雄大鼠生育力和早期胚胎发育的显著影响。雄性大鼠在 100mg/kg/天剂量下出现抑制体重增重和摄食量减少，一过性步态异常、活动减少、肌张力降低，轻度的附睾重量下降、附睾精子数和正常精子数减少和精子运动力降低趋势。

大鼠和兔分别静脉注射地夸磷索钠 300mg/kg/天（相当于人临床日推荐剂量 0.3mg/kg/天的 1000 倍）和 30mg/kg/天（相当于人临床日推荐剂量 0.3mg/kg/天的 100 倍），未见给药相关的胚胎-胎仔发育毒性。大鼠静脉注射地夸磷索钠 100mg/kg/天剂量下（相当于人临床日推荐剂量 0.3mg/kg/天的 333 倍）未见对胚胎和子代发育的不良影响，在 30mg/kg/天剂量下（相当于人临床日推荐剂量 0.3mg/kg/天的 100 倍）未见对妊娠/哺乳雌性的不良影响。

【药代动力学】

1. 血浆中药物浓度

给健康成人男子双眼滴以 0.3%、1%、3%、5%地夸磷索钠滴眼液，1 次 1 滴、1 天 1 次滴眼 1 天，1 天 6 次滴眼 1 天和 1 天 6 次滴眼 7 天，测定血浆中的药物原型和代谢物的浓度。结果发现所有受试者在所有的测定时间点的血浆中药物原型浓度均在定量下限（2ng/ml）以下。其代谢产物（UTP、UDP、UMP、尿苷），对于内源性成份形成的生理浓度也没有影响。（本品被批准的浓度为 3%。）

2. 在动物眼组织内的分布

给家兔以 3% 14C-地夸磷索钠滴眼液单次滴眼后，在结膜、角膜等外眼部组织检测到高浓度放射性。滴眼 5 分钟后，结膜和角膜显示最高放射性浓度，滴眼 24 小时后变为最高放射浓度的 4~30%。

3. 代谢

在人血浆和人肝微粒体的体外代谢反应中，地夸磷索钠迅速代谢，生成 UMP、尿苷和尿嘧啶。

给家兔以 3% 14C-地夸磷索钠滴眼液滴眼 30 分钟后在其眼组织中几乎检测不到地夸磷索钠，但可以检测到 UTP、UDP、UMP、尿苷和尿嘧啶等。

【贮藏】

密封，1~30℃保存。

【包装】

低密度聚乙烯药用滴眼剂瓶，1 瓶 / 盒。

【有效期】

24 个月

【执行标准】

YBH11622023

【批准文号】

国药准字 H20234037

【上市许可持有人】

企业名称：北京诺思兰德生物技术股份有限公司

地 址：北京市海淀区上地开拓路5号A406室

邮政编码：100085

电话号码：010-82890893

传真号码：010-82890892

网 址：<https://www.northland-bio.com/>

【生产企业】

企业名称：北京汇恩兰德制药有限公司

生产地址：北京市通州区靓丽五街3号院7号楼

邮政编码：101106

电话号码：010-56339566

传真号码：010-56339555

网 址：www.huonland.com

