

佐来曲替尼片

(宜诺欣®)

北京地产1类新药

国内首款新一代TRK抑制剂

适应症： NTRK基因融合阳性的成人和12岁以上青少年实体瘤患者



INNOCARE

诺诚健华

目录

基本信息

- **佐来曲替尼**是国内首款新一代TRK抑制剂**1类新药**，拥有完整自主知识产权

有效性信息

- 与同治疗领域TRK抑制剂相比，佐来曲替尼各项临床结局指标最优，尤其**治疗基线脑转移患者ORR高达100%**

安全性信息

- 佐来曲替尼整体安全性良好，**因AE导致的永久停药的比例仅0.4%**，优于拉罗替尼0.7%、恩曲替尼4%

创新性信息

- **首创大环化母核**并引入特色氟原子修饰，**攻克耐药痛点**

公平性信息

- 在肿瘤患者中的NTRK融合率仅为0.3%~0.4%，**患者罕见，对基金影响极小**

佐来曲替尼片是国内首款获批的新一代TRK抑制剂，具有更好的安全性和疗效

药品基本信息

通用名	佐来曲替尼片
适应症	<p>本品适用于符合下列条件的成人和12岁以上青少年实体瘤患者：</p> <ul style="list-style-type: none"> - 经充分验证的检测方法诊断为携带神经生长酪氨酸受体激酶(NTRK)融合基因且不包括已知获得性耐药突变， - 患有局部晚期、转移性疾病或手术切除可能导致严重并发症的患者，以及无满意替代治疗或既往治疗失败的患者。
用法用量	推荐剂量为每次8mg，口服，每日一次
注册规格	4mg
大陆地区同通用名药品的上市情况	无， 独家品种
全球首个上市国家/地区及上市时间	中国大陆，2025年12月11日
是否为 OTC 药品	否

参照药品信息

参照药品建议	硫酸拉罗替尼胶囊
建议理由	<ul style="list-style-type: none"> • 同为针对NTRK融合的靶向药，且都是仅此适应症。 • 目录内另一个TRK抑制剂恩曲替尼核心适应症为ROS1阳性肺癌，NTRK适应症销售额占比不足10%。

对比参照药品的优势和不足

- **优势：**
 - ✓ **疗效显著：**佐来曲替尼ORR、PFS和OS数据均显著优于同类药物，MAIC分析佐证差异显著。
 - ✓ **安全性更优：**佐来曲替尼**永久停药率仅0.4%**，显著低于同类药物，中枢毒性小，脑转移人群用药更安全。
 - ✓ **依从性更好：**佐来曲替尼半衰期持续24小时，每日一次给药，相比一代可减少漏服风险，改善长期依从性。
 - ✓ **双领域破局：**打破一代TRK抑制剂耐药治疗瓶颈，填补国内自研NTRK融合靶向药物空白。
- **不足：**由于上市时间晚，真实世界数据相对较少。

佐来曲替尼结构优化带来耐药克服和透脑活性提升，弥补临床未满足需求

疾病基本情况

- **中国 NTRK 融合实体瘤临床需求迫切**：NTRK融合在多种实体瘤中存在，中国每年新发NTRK融合晚期实体瘤患者为6500人¹，现有治疗手段有限，缺乏高效低毒的靶向药物。
- **人群分布广，合并症多**：NTRK融合可发生于成人及儿童，涵盖肺癌、肉瘤、甲状腺癌、结直肠癌等多个癌种，部分患者合并脑转移、骨转移等复杂情况，对治疗耐受性要求高。
- **现有治疗局限性大，生存获益有限**：一代TRK抑制剂存在耐药率高、中枢活性不足、不良反应发生率高等问题，患者亟需**疗效更优、安全性更好的新一代药物**。

目录内TRKi未满足需求

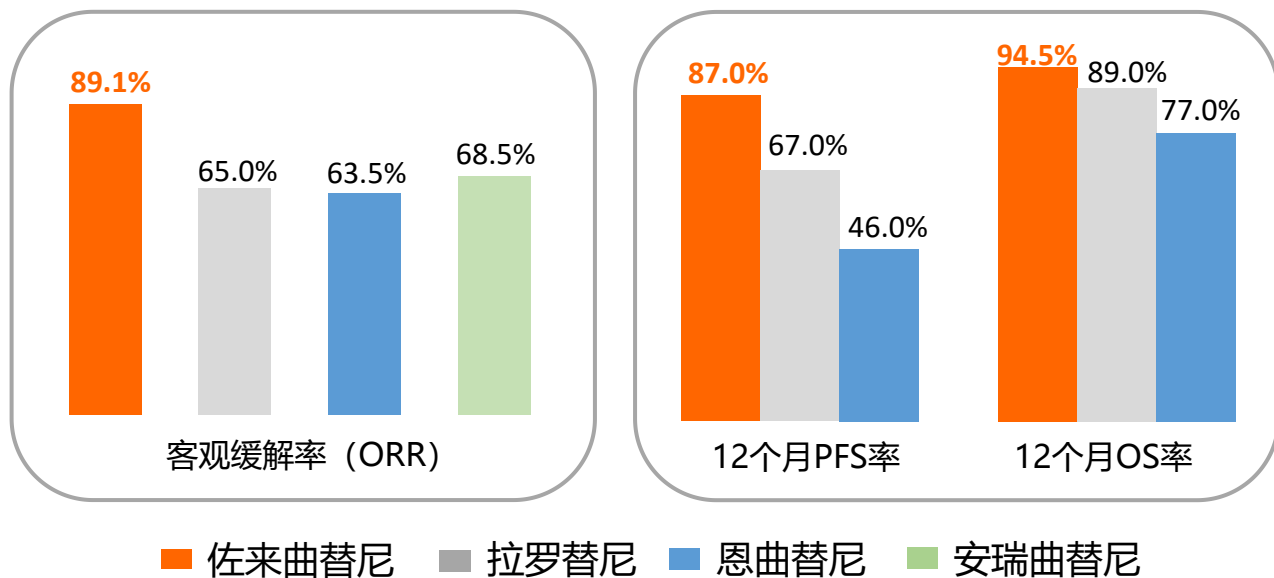
- **安全性不足**：拉罗替尼/恩曲替尼作为一代TRK抑制剂，存在肝毒性、神经毒性、体重增加等不良反应，部分患者因耐受性问题中断治疗，影响长期获益²⁻³。
- **耐药率高，复发率高**：一代TRK抑制剂治疗后，约50%-60%的患者会在9-12月内出现耐药⁴，包括溶剂前沿突变等，而佐来曲替尼对多种常见耐药突变均具有显著抑制活性，可有效克服耐药。
- **中枢活性有限**：一代TRK抑制剂对脑转移患者的疗效有限，部分药物血脑屏障穿透率不足，佐来曲替尼具有更高的血脑屏障穿透率，对中枢神经系统转移患者的治疗优势显著。**佐来曲替尼治疗基线脑转移患者，ORR高达100%⁵**。

1. Westphalen C B, Krebs M G, Le Tourneau C, et al. Genomic context of NTRK1/2/3 fusion-positive tumours from a large real-world population[J]. NPJ Precision Oncology, 2021, 5(1): 69.
 2. 数据来源：(FDA-Labeling, 2023; FDA review report, 2018).
 3. 数据来源：(FDA-Labeling, 2024b; FDA review report, 2019).
 4. <https://mp.weixin.qq.com/s/SQefobhcuNKQ78DIbv4fkg>.
 5. 佐来曲替尼片药品说明书..核准日期：2025年12月9日。

佐来曲替尼治疗NTRK融合阳性实体瘤各项临床结局指标均优于所有TRK抑制剂

佐来曲替尼疗效显著，患者获益明显

- IRC评估佐来曲替尼的ORR为89.1%，12个月PFS率和OS率¹均显著优于医保目录内一代TRK抑制剂拉罗替尼、恩曲替尼²及目录外安瑞曲替尼³。



匹配调整间接比较结果 (MAIC)⁴

- 使用佐来曲替尼患者IPD数据与拉罗替尼和恩曲替尼的已发表数据²进行MAIC，结果显示匹配后佐来曲替尼ORR分别为94.0%和94.6% (* $P < 0.05$)，**显著性高于参照药物，进一步论证疗效的稳定性。**
- 生存数据方面，MAIC结果显示，在NTRK阳性实体瘤患者中，佐来曲替尼的中位PFS达34个月，显著优于恩曲替尼 (23.2个月，**HR=0.19, $P < 0.05$**)，与拉罗替尼 (33.4个月) 相当；OS方面，佐来曲替尼尚未达到中位值，相比恩曲替尼 (24.8个月，**HR=0.12, $P < 0.05$**) 和拉罗替尼 (NR，**HR=0.24, $P < 0.05$**) 均展现出更优的生存获益趋势。

■ 基于卓越疗效，2026年CSCO头颈部肿瘤诊疗指南已将佐来曲替尼片列入了II级推荐⁵

- 佐来曲替尼的ICP-CL-00501和ICP-CL-00505研究汇总分析。
- Garcia-Foncillas J, Bokemeyer C, Italiano A, et al. Indirect treatment comparison of larotrectinib versus entrectinib in treating patients with TRK gene fusion cancers[J]. Cancers, 2022, 14(7): 1793.
- 安瑞曲替尼官网. https://www.vcarepharmatech.com/news_detail/2062522929585774592-120-6.html.
- Ying Chen, Bin Wu. Abstract, ISPOR Europe 2026 (待投稿).
- 中国临床肿瘤学会. CSCO 头颈部肿瘤诊疗指南 (2026) [M]. 北京: 人民卫生出版社, 2026.

佐来曲替尼整体安全性优于目录内同类产品

对比目录内同类药品安全性

- 在肝毒性、神经系统毒性、心脏毒性、消化道毒性方面，**佐来曲替尼表现出明显的安全性优势：**

不良事件分类	佐来曲替尼 (N=272) ¹	拉罗替尼 (N=279) ²	恩曲替尼 (N=355) ³
ALT升高	37.1%	45%	38%
AST升高	36.4%	52%	44%
头晕	21.7%	27%	38%
认知障碍	0.7%	11%	27%
睡眠障碍	3.7%	10%	14%
充血性心脏衰竭	0%	/	3.4%
腹泻	7.0%	27%	35%
恶心	5.5%	25%	34%
呕吐	2.6%	25%	24%

说明书收载的安全性信息¹

- 本品在所有肿瘤受试者中，认知和睡眠障碍等各方面都具有更好的安全性，尤其是在消化道毒性（腹泻、恶心、呕吐）发生率显著低于同类药品，能够有效减少因消化道不耐受引发的临时减药以及停药。

上市后安全性得到充分认证

- 自2025年上市至今，各国家/地区药监部门未发布安全性警告、黑框警告、撤市信息等。
- 截至目前，真实世界中患者治疗体验：**安全性与说明书整体一致**，患者耐受性良好。

因AE导致的停药比例更低

- 佐来曲替尼永久停药的比例0.4%⁴，均低于拉罗替尼0.7%和恩曲替尼4%⁵。

1. 数据来自3项ICP-723临床试验汇总分析（所有肿瘤受试者），数据截止日期为ICP-CL-00505（2025-07-31）、ICP-CL-00501（2025-07-31）、ICP-CL-00502（2023-06-19）。

2. 数据来源：(FDA-Labeling, 2023; FDA review report, 2018).

3. 数据来源：(FDA-Labeling, 2024b; FDA review report, 2019).

4. 佐来曲替尼片药品说明书.核准日期：2025年12月9日。

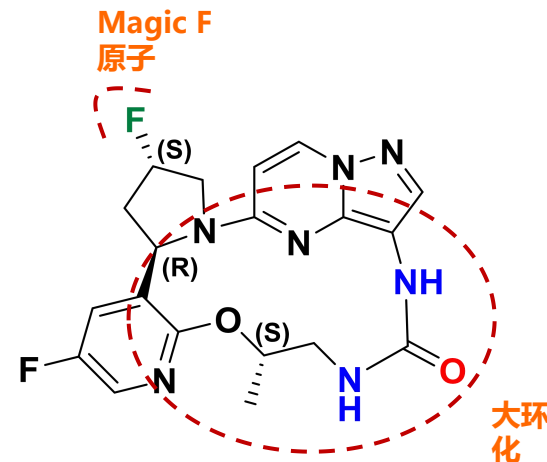
5. Garcia-Foncillas J, Bokemeyer C, Italiano A, et al. Indirect treatment comparison of larotrectinib versus entrectinib in treating patients with TRK gene fusion cancers[J]. Cancers, 2022, 14(7): 1793.

佐来曲替尼多重技术创新，为脑转移及耐药患者提供更优质选择

创新程度

依托结构与工艺双重创新，攻克耐药痛点，兼顾疗效、安全性与适用性

- **分子结构创新**：首创**大环化母核**并引入特色氟原子修饰，对TRKA G595R、G667C等耐药突变抑制活性显著提升，相较拉罗替尼最高提升285倍，可有效克服一代药物耐药；同时大幅增强分子中枢（CNS）穿透能力。
- **药效与成药性优异**：药物口服生物利用度高，神经系统和消化道毒性更低，依托**优异的中枢穿透能力**，可用于脑转移及低龄患者人群。在耐药突变药效模型中，本品以百倍更低剂量展现出优于拉罗替尼的药效。
- **制剂工艺升级**：创新应用固体分散体制备技术，有效提升药物体内暴露水平与吸收效果。



应用创新

自主原研创新，技术领先，走向国际

- **突破创新**：佐来曲替尼是**国内首款**新一代大环化TRK抑制剂**1类新药**，拥有完整自主知识产权，有效破解一代药物耐药难题。
- **使用便利性**：**一天一次口服给药，依从性更好。**
- **CNS渗透性优异**：脑转移患者颅内ORR/DCR均达100%，实现“全身 + 颅内”双重控制。
- **儿科布局领先**：儿童适应症获CDE优先审评，**纳入国家“星光计划”**（儿童抗肿瘤药专项）。
- **全球同步开发**：美国 I 期、II 期注册研究规划中。

佐来曲替尼弥补目录短板，纳入医保将惠及更多患者

弥补药品目录短板

- 一代TRK抑制剂耐药后无医保可选方案，佐来曲替尼可**填补一代药物耐药后的治疗空白**。
- 现有药物颅内有效率有限，佐来曲替尼CNS渗透性强、颅内ORR/DCR达100%，**填补对NTRK融合脑转移患者的保障短板**。

临床/医保管理

- 适应症界定清晰，**无滥用风险**。
- 每日一次口服，依从性高、疗效、安全性数据明确，**便于医保监测与评估**。
- 国内1类新药，可形成良性竞争，**提升基金使用效率**与患者支付公平性。

公共健康影响

- 大幅降低患者自费压力，减少因病致贫现象。
- 有效延长患者生存期、改善生活质量，节约整体医疗资源。
- **支持国产创新，促进产业高质量发展**。

符合“保基本”原则

- 在肿瘤患者中的NTRK融合率仅为0.3%~0.4%，患者数量少，**对基金影响极小**。
- 减少脑转移风险，节省医保基金支出。
- 口服用药，节约住院费用，基金影响有限。



INNOCARE
诺诚健华

感谢审阅！

期待对北京地产1类新药的支持