

申报企业：轩竹生物科技股份有限公司



地罗阿克片

(轩菲宁®)

单药用于未经ALK抑制剂治疗的ALK阳性的局部晚期或转移性NSCLC
国产1类新药



目录



1



基本信息

2



安全性

3



有效性

4



创新性

5



公平性

地罗阿克用于ALK阳性非小细胞肺癌一线治疗，为患者带来更优治疗选择



药品基本信息

药品通用名	地罗阿克片
注册规格	50mg; 0.25g (主规格)
注册分类	化学药品1类
说明书适应症	本品单药适用于未经过间变性淋巴瘤激酶 (ALK) 抑制剂治疗的ALK阳性的局部晚期或转移性非小细胞肺癌 (NSCLC) 患者的治疗
用法用量	推荐剂量为500mg，口服给药，每日一次，与餐同服。连续服药，治疗直至疾病进展或出现不可耐受的毒性反应。
全球首个上市国家地区及上市时间	中国，2025年8月
中国大陆首次上市时间	2025年8月
目前大陆地区同通用名药品的上市情况	无
是否为OTC药品	否
申报目录类别	基本医保目录



参照药建议

参照药品建议：盐酸恩沙替尼胶囊

- 作用机制相似** 恩沙替尼同为二代ALK抑制剂
- 指南推荐** 恩沙替尼为国内外指南均推荐使用
- 临床应用广泛** 恩沙替尼为最早进入基本医保目录的国产二代ALK抑制剂

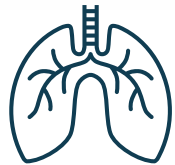
地罗阿克优势

- 疗效优势：**显著提高脑转移患者生存获益
- 安全性良好：**试验观测期内未发生皮疹、水肿、认知影响、间质性肺炎等，血脂异常、肌酐升高发生率低

肺癌是我国发病率和死亡率第一的癌症，脑转移和安全性仍是未满足需求



疾病基本情况



ALK阳性患者约占NSCLC的**5.00%**¹

- 肺癌的发病率和死亡率高居中国肿瘤**首位**，新发肺癌患者106.06万/年²，非小细胞肺癌（NSCLC）在肺癌中占比约为**80%-85%**³
- ALK阳性非小细胞肺癌（ALK⁺ NSCLC）是一种比较**少见而凶险的亚型**¹
- ALK⁺ NSCLC患者中位年龄52岁⁴

临床未满足需求



脑转移

- 约**22-33%**ALK阳性患者治疗前存在脑转移⁵
- ALK阳性NSCLC患者2年及3年累计脑转移发生率分别为**45.5%和58.4%**⁶



安全性

- 已有ALK抑制剂需重点关注的AE类别：**血脂异常、皮疹、血液毒性、间质性肺病、肝毒性、水肿、认知影响、肾毒性**

缩写：ALK, Anaplastic Lymphoma Kinase, 间变性淋巴瘤激酶; NSCLC, Non-small cell lung cancer, 非小细胞肺癌; AE, Adverse event, 不良事件

来源：1. 间变性淋巴瘤激酶酪氨酸激酶抑制剂治疗非小细胞肺癌指南（2025）；2. 郑荣寿, 等, 中华肿瘤杂志, 2024; 3. Chen, P., et al. Cancer Commun (Lond). 2022; 4. Bazzi H, et al. Clinical Lung Cancer, 2025; 5. Aldea M, et al. Eur Oncol Haematol. 2020. 6. Rangachari D, et al. Lung Cancer, 2015.

地罗阿克整体安全性良好，临床管理难度小



中国III期临床试验结果：地罗阿克耐受良好

- 与克唑替尼相比，地罗阿克 ≥ 3 级TRAE发生率更低，**导致永久停用TRAE发生率仅为1.5%**¹
- 上市后无任何安全性警告、黑框警告

说明书收载安全性信息：地罗阿克临床易管理

- 地罗阿克常见不良反应为消化道相关反应，包括腹泻、呕吐等，多发生于用药1-2天内，**中位持续时间为2天，多为轻度（1-2级）**；经对症支持治疗、停药或减量后均可缓解或治愈，临床管理难度小²
- 老年患者（ >65 岁）、轻中度肾功能不全患者使用**无需调整剂量**²

地罗阿克不增加新的安全性风险^{1,2}

- 地罗阿克在试验观测期内**皮疹、水肿、视觉障碍、咳嗽、间质性肺病、认知影响、体重增加**的不良反应**发生率为0**
- 地罗阿克在其他 ≥ 3 级不良反应方面（包含**贫血2.2%、ALT升高2.5%、AST升高2.2%、中性粒细胞减少1.2%、血肌酐升高0.3%**）**发生率低**
- 地罗阿克 ≥ 3 级**血脂异常**发生率仅**3.7%**

缩写：ALK, Anaplastic Lymphoma Kinase, 间变性淋巴瘤激酶; TRAE, treatment-related adverse event, 治疗相关不良事件; ALT, Alanine aminotransferase 丙氨酸氨基转移酶; AST, Aspartate aminotransferase 天冬氨酸氨基转移酶

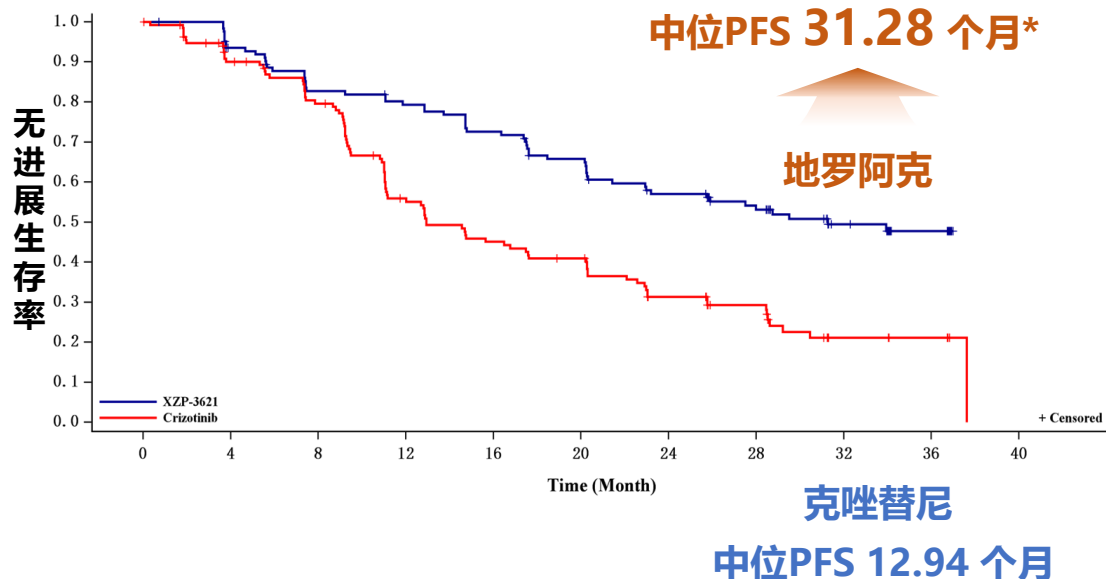
来源：1.地罗阿克AACR会议摘要及口头报告. 2. 地罗阿克说明书.

地罗阿克可显著降低患者的疾病进展风险，中位PFS长达31.28个月



头对头临床试验结果显示，地罗阿克和克唑替尼相比，可显著延长患者PFS¹

➤ 一项**中国人群**多中心、随机、开放对照的III期临床研究，纳入275例ALK阳性晚期NSCLC初治患者



- 地罗阿克mDOR达32.1个月，可以快速、深度、持久缓解脑及非脑部的肿瘤负荷，使患者获得更长生存获益
- ITT和mITT人群 PFS HR结果一致¹

地罗阿克 PFS HR结果

0.465

$p < 0.0001$

注：地罗阿克PFS、生存曲线图、PFS HR和ORR数据来自AACR会议摘要及口头报告

备注：*此处展示研究者评估，mITT人群（8例患者因基线ALK重排检测所用试剂盒的监管批准状态信息不可用而被排除在ITT人群外）数据。

缩写：ALK, Anaplastic Lymphoma Kinase, 间变性淋巴瘤激酶; NSCLC, Non-small cell lung cancer, 非小细胞肺癌; PFS, Progression-Free Survival, 无进展生存期; HR, Hazard Ratio, 风险比; mDOR, median Duration of Response, 中位缓解持续时间

来源：1.地罗阿克AACR会议摘要及口头报告.

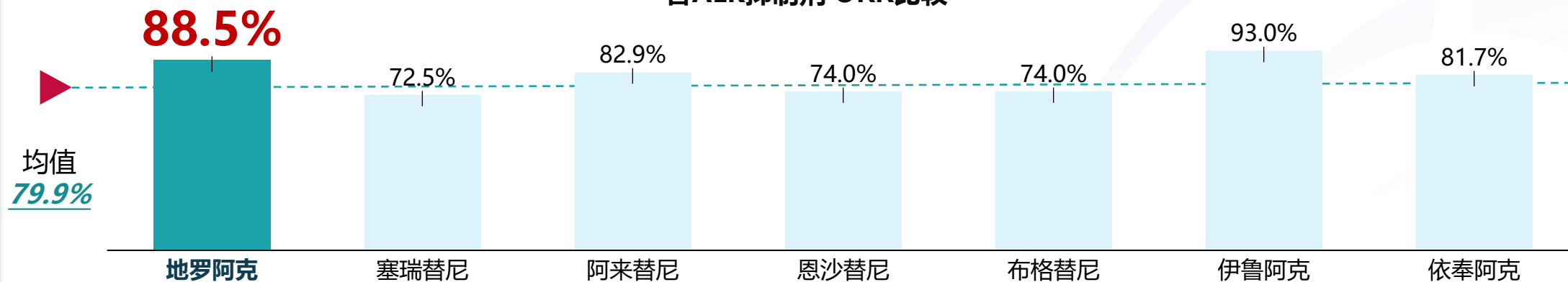
地罗阿克展现出较高的客观缓解率，ORR高达88.5%



地罗阿克ORR 水平处于二代ALK抑制剂前列¹⁻⁷

- 一项**中国人群**多中心、随机、开放对照的III期临床研究，纳入275例ALK阳性晚期NSCLC初治患者
- 地罗阿克**起效快，可持久、深度缓解肿瘤负荷**，ORR达**88.5%**

各ALK抑制剂 ORR比较*



*以上数据均为各产品III期临床试验报告结果，非头对头

备注：* 对于同时报告了研究者评估、第三方评估数据的研究，此处展示主要评估指标数据；均为关键III期临床试验基础研究结果

缩写：ALK, Anaplastic Lymphoma Kinase, 间变性淋巴瘤激酶；ORR, Objective Response Rate, 客观缓解率

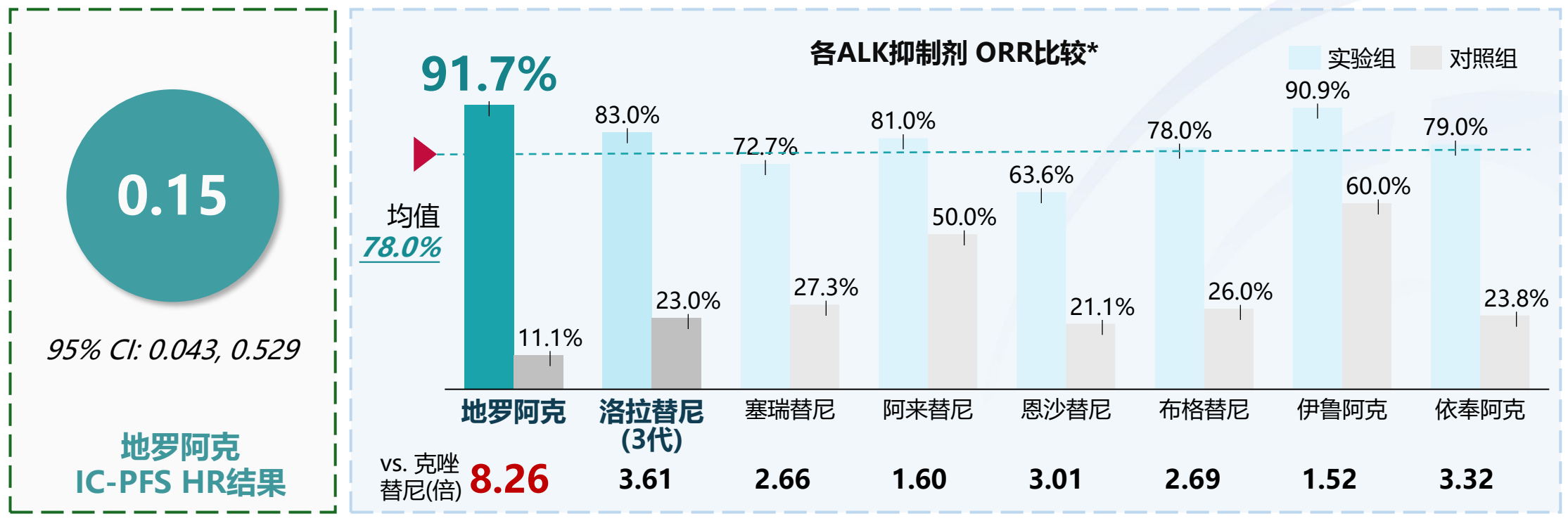
来源：1. 地罗阿克AACR会议摘要及口头报告. 2. Soria JC, et al. Lancet. 2017. 3. Peters S, et al. N Engl J Med. 2017. 4. Horn L, et al. JAMA Oncol. 2021. 5. Camidge DR, et al. J Clin Oncol. 2020. 6. Shi Y, et al. J Thorac Oncol. 2024. 7. Yang Y, et al. Signal Transduct Target Ther. 2023.

地罗阿克显著提高脑转移患者的生存获益，降低85%的颅内进展风险



地罗阿克可显著降低基线脑转移人群的颅内进展风险，HR值达0.15^{1,*}

地罗阿克基线脑转移患者ORR为克唑替尼的8.26倍¹⁻⁷



注：地罗阿克基线脑转移PFS HR和ORR数据均来自CSCO口头报告，ORR为颅内可测量病灶结果

*以上数据均为各产品III期临床试验报告结果，非头对头

备注：*对于同时报告了研究者评估、第三方评估数据的研究，此处展示主要评估指标数据；均为关键III期临床试验研究时限最相近的研究结果；颅内可测量病灶

缩写：ALK, Anaplastic Lymphoma Kinase, 间变性淋巴瘤激酶；IC-ORR, Intracerebral Objective Response Rate, 颅内客观缓解率；IC-PFS, Intracerebral Progression-Free Survival, 颅内无进展生存期；HR, Hazard Ratio, 风险比

来源：1.地罗阿克CSCO口头报告。2. Soria JC, et al. Lancet. 2017. 3. Peters S, et al. N Engl J Med. 2017. 4. Horn L, et al. JAMA Oncol. 2021. 5. Camidge DR, et al. J Clin Oncol. 2020. 6. Shi Y, et al. J Thorac Oncol. 2024. 7. Yang Y, et al. Signal Transduct Target Ther. 2023.



地罗阿克在多个耐药位点的抑制活性强，可为耐药后的重要选择



EML4-ALK 变异类型	细胞ALK磷酸化IC ₅₀ * 均值(nmol/L)#				
	塞瑞替尼 ¹	布格替尼 ¹	阿来替尼 ¹	洛拉替尼 ¹	地罗阿克 ^{2,3}
V1融合突变	4.9	10.7	11.4	2.3	3
C1156Y	5.3	4.5	11.6	4.6	13.6
I1171N	8.2	26.1	397.7	49.0	7.5
I1171S	3.8	17.8	177.0	30.4	6.9
I1171T	1.7	6.1	33.6	11.5	6.6
F1174C	38.0	18.0	27.0	8.0	10.8
V1180L	15.6	10.4	469	5.2	5.0
L1196M	9.3	26.5	117.6	34.0	4.79
L1198F	196.2	13.9	42.3	14.8	3.8
G1202R	124.4	129.5	706.6	49.9	40.98
G1202del	50.1	95.8	58.8	5.2	20.2
D1203N	35.3	34.6	27.9	11.1	8.3
E1210K	5.8	24.0	31.6	1.7	4.5
G1269A	0.4	/	25.0	10.0	4.0

■ 表示IC₅₀ ≤ 30nM, ■ 表示30 < IC₅₀ < 100nM, ■ 表示IC₅₀ ≥ 100nM

地罗阿克在多个耐药位点上显示出较强抑制活性，具备更强耐药潜力

对关键耐药突变位点抑制活性更强

- 对L1196M、G1202R双领域突变均保持<45 nM，提示后续可作为其他ALK抑制剂耐药后的治疗选择之一

对高发耐药突变位点抑制活性更强

- G1269A、I1171N/S、V1180L等高发耐药突变位点

备注：*IC50全称为半抑制浓度（half maximal inhibitory concentration），是50%抑制所需的药物浓度，药物发现和药理学研究使用IC50值来确定药物有效性（效力），通常数值越低意味着药物越有效；#其他ALK抑制剂数据来源为以临床耐药样本为基础的转化医学研究，结合体外和体内模型进行耐药机制及药物敏感性验证；地罗阿克数据来源为临床前体外药效学研究

缩写：ALK, Anaplastic Lymphoma Kinase, 间变性淋巴瘤激酶

来源：1. Gainor JF, et al. Cancer Discov. 2016; 2. 姜本科, 中国临床药理学杂志, 2025; 3. 地罗阿克CSCO口头报告

地罗阿克具有创新结构，为脑转移患者带来更优治疗选择



中国自主研发，国产1类新药



指南推荐

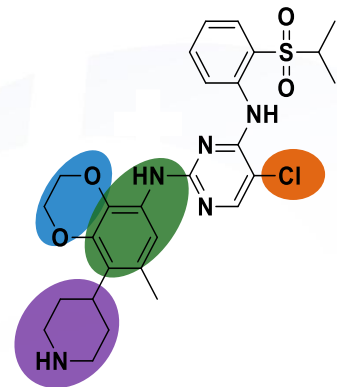
《IV期原发性肺癌中国治疗指南 2026》¹
 《肺癌脑转移中国治疗指南 2026》²
 《CSCO非小细胞肺癌诊疗指南 2026》³

结构创新



通过化学结构优化，地罗阿克获得更高活性和安全性⁴

- **Cl基**：有利于加强与“守门”残基（L1196M）的分子作用
- **芳香胺基**：无法生成1,4-二氨基醌结构的代谢产物，避免潜在氧化代谢毒性，提高安全性
- **二噁英基**：提供氢键受体，增强与Arg1120、Glu1132等铰链区的相互作用，提高活性
- **哌啶NH基**：与Glu1210形成盐桥，增强其与靶点的结合能力，提高活性和选择性



应用创新



地罗阿克可为基线脑转移患者带来更优质的治疗选择

- 地罗阿克可透过血脑屏障，人源肺癌颅内接种模型显示，能够显著抑制肿瘤生长，显著延长存活时间⁵

缩写：ALK, Anaplastic Lymphoma Kinase, 间变性淋巴瘤激酶; TGI, Tumor Growth Inhibition, 肿瘤生长抑制率

来源：1. 中国医疗保健国际交流促进会肿瘤内科学分会 中国医师协会肿瘤医师分会《IV期原发性肺癌中国治疗指南 2026版》；2. 中国医疗保健国际交流促进会肿瘤内科学分会 中国医师协会肿瘤医师分会《肺癌脑转移中国治疗指南 2026》；3. 中国临床肿瘤学会（CSCO）非小细胞肺癌诊疗指南 2026；4. 地罗阿克说明书；5. 姜本科，中国临床药理学杂志，2025。

地罗阿克可显著提高脑转移患者生存获益，临床和医保管理可控



1

弥补目录短板

- 国产1类新药，临床研究数据基于中国患者，更具参考性
- 为脑转移患者带来疗效更优且耐受性更好、停药率更低更安全的治疗选择

2

便于临床管理

- 固定剂量，口服给药，每日仅一次
- 老年患者 (>65岁)、轻中度肾功能不全患者使用无需调整剂量

3

对公共健康的影响

- ALK阳性晚期NSCLC易发生脑转移及耐药，患者预后差
- 地罗阿克可显著降低脑转移人群的颅内进展风险，颅内客观缓解率高，提高脑转移患者的生存获益

4

符合“保基本”原则

- ALK阳性NSCLC患者占比约5%
- 地罗阿克可替代目录内ALK抑制剂，医保基金影响小