

注射用盐酸伊吡诺司他（贝特琳®）

国内自主研发、**全球首创（First-In-Class）**
HDAC/PI3K α 双靶点抑制剂、**国家1类新药**



目录

01

基本信息

自主研发、国家1类新药，全球首创（First-In-Class）HDAC/PI3K α ①双靶点抑制剂，用于三线及以上复发或难治性弥漫大B细胞淋巴瘤（r/r DLBCL）

02

有效性

单药客观缓解率（ORR）54.6%、中位无进展生存期（PFS）4.1个月、中位总生存期（OS）12.7个月②

03

安全性

不良反应可控，严重不良反应发生率低，不增加额外医疗支出

04

创新性

全球唯一获批HDAC/PI3K α 双靶点抑制剂，被纳入突破性治疗品种并授予优先审评资格，荣获“十三五”国家“重大新药创制”科技专项

05

公平性

CAR-T及CD3/CD20双抗治疗失败患者仍有效，弥补三线r/r DLBCL缺少有效治疗药物短板

注：有效性数据基于说明书认可的盐酸伊吡诺司他关键注册临床研究中排除疫情干扰敏感性分析人群（n=44）

基本信息1:

三线及以上 r/r DLBCL 疾病危害严重，存在巨大未被满足临床需求

疾病危害严重，生存现状堪忧

我国非霍奇金淋巴瘤（NHL）发病率为4.29/10万，每年新发病例大约98,000例，最常见的弥漫性大B细胞淋巴瘤（DLBCL）约占40%，初治DLBCL 患者治疗后近40%会复发。^①

- 三线及以上r/r DLBCL患者大约 **5000例/年**
- 三线及以上患者疾病进展快、预后极差，传统化疗患者总生存期 **不足6个月**

现有疗法局限性凸显，未满足临床需求巨大

尽管新药不断上市，但三线患者仍面临“无药可用”的困境：

1. **格菲妥单抗（CD3/CD20双特异性抗体）（目录内）**
 - 二线已纳入医保并广泛使用，**暴露或治疗失败患者在三线面临单药耐药风险**
2. **塞利尼索（目录内）**
 - FDA已撤回三线 r/r DLBCL适应症^②，国内存在潜在**撤回风险**
3. **CAR-T（目录外）**
 - 价格昂贵，制备周期长、CRS反应等，**患者可及性差**

综上，目录内仍缺乏机制创新，高效、安全、可及性高，临床管理方便的治疗药物

基本信息2:

国内自主研发、全球首创 (First-In-Class) HDAC/PI3K α 双靶点抑制剂

申报目录类别	基本目录				
通用名	注射用盐酸伊吡诺司他	商品名	贝特琳®	注册分类	化学药品1类
注册规格	20.6mg (按C ₂₃ H ₂₅ N ₉ O ₃ S计)				
适应症	本品单药适用于既往接受过至少两线系统性治疗的复发或难治性弥漫性大B细胞淋巴瘤成人患者 ^①				
用法用量	推荐给药剂量为 18.5mg/m ² (按C ₂₃ H ₂₅ N ₉ O ₃ S计)，静脉滴注，连续给药 2周，停药1周，共21天为1个周期，每周期第 1、3、5、8、10、12 天给药，直至疾病进展或出现不可耐受的毒性 ^①				
中国大陆首次上市时间	2025年6月30日		目前大陆地区同通用名上市药品		无
全球首次上市国家/地区及上市时间	中国		是否为OTC药品		否

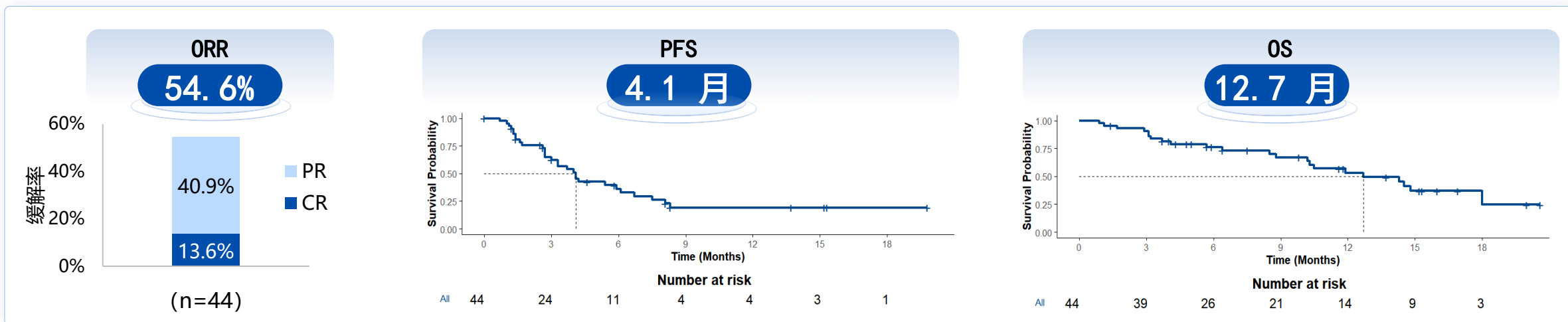
参照药物：空白

1. 全球首创 (First-In-Class) HDAC/PI3K α 双靶点抑制剂
2. 经国家医保局参照药预申请论证：“参照药为空白”
3. 目录内同适应症无相同作用机制药物

^① 注射用盐酸伊吡诺司他说明书

有效性1：伊吡诺司他单药疗效突出，有效弥补三线r/r DLBCL治疗短板

01 单药疗效突出^①



02 免疫治疗失败患者仍有效^②

★ CAR-T 治疗失败患者：ORR 达 67% (4/6例)

★ CD3*CD20 双抗治疗失败患者：ORR 达 100% (2/2例)

03 权威指南一致推荐^③

★ CSCO 淋巴瘤诊疗指南（2026版）II级推荐

★ 中国淋巴瘤诊疗指南（2026版）推荐

1. 关键IIb期研究正值新冠疫情期间，因管控导致部分患者停药、漏药或评估超窗，影响整体疗效评估；有效性数据是基于说明书认可的排除疫情干扰敏感性分析人群。
2. 尽管亚组分析样本量较小，但伊吡诺司他与免疫疗法作用机制不同，观察到明确的缓解信号，为该类药物提供潜在后线治疗选择。

① 注射用盐酸伊吡诺司他说明书；② 数据来自关键IIb期研究亚组分析；③ 《中国临床肿瘤学会（CSCO）淋巴瘤诊疗指南 2026 版》；中华肿瘤杂志 2026 年3 月第 48 卷第 3 期 - 中国淋巴瘤诊疗指南（2026版）

有效性 2：伊吡诺司他与目录内同适应症药物相比疗效优异

目录内同适应症药物注册临床试验：患者基线和疗效对比

	伊吡诺司他 ^①	维泊妥珠单抗联合BR ^②	塞利尼索 ^③	格菲妥单抗 ^④
中国注册临床试验	关键IIIb期中国注册试验 单药（排除疫情防控因素 n=44）	中国桥接试验 联合方案 Pola+BR n=28	中国桥接试验 单药 n=60	中国桥接试验 单药 n=27
作用机制/靶点	HDAC/PI3K α ^⑤	CD79b ^⑥	XP01 ^⑦	CD3*CD20双特异性抗体
入组基线水平				
末次难治	91.3%	96.4%	90%	90%
既往治疗线数	2L 58.7% ≥3L 41.3%	1L 32.1% ≥2L 67.9%	2L 45% ≥3L 55%	2L 56.7% ≥3L 43.3%
疗效				
ORR	54.6%	28.6% (BOR 53.6%)	21.7%	66.7%
PFS (月)	4.1	4.6	1.9	8.6
OS (月)	12.7	10.6	8.5	61.3% (12个月)

1. 该数据是格菲妥单抗未暴露人群，现格菲妥已获批二线适应症、并已纳入医保，**二线广泛应用导致格菲妥单抗暴露或失败患者三线单药面临耐药风险。**
2. 2026年4月30日，**FDA已撤回塞利尼索r/r DLBCL适应症^⑧**，国内存在潜在撤回风险。
3. Pola+BR中国桥接试验入组了**近1/3 二线r/r DLBCL患者**，相对三线及以上患者人群，二线治疗应答率高，生存期长。
4. 伊吡诺司他联合利妥昔单抗在二线及以上人群探索性试验结果显示**ORR高达76.2%，其中CR为47.6%**，该联合方案正在进行III期确证性临床研究^⑨

① 注射用盐酸伊吡诺司他说明书；② 注射用维泊妥珠单抗（JXSS2101036-37）-申请上市技术审评报告，Pola+BR ORR指标：治疗结束时客观缓解率（EOR）为28.6%，最佳客观缓解率（BOR）为53.6%；

③ 塞利尼索片（JXHS2300097）申请上市技术审评报告；④ 格菲妥单抗注射液（JXSS2300014）申请上市技术审评报告；

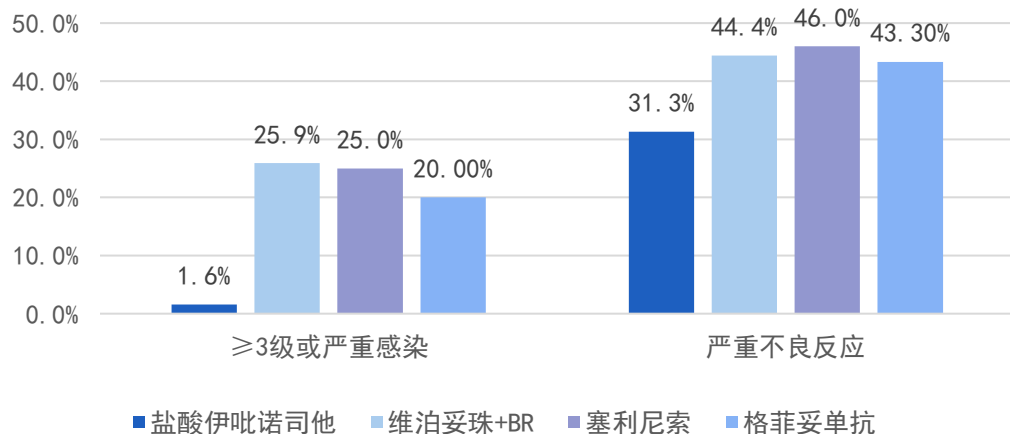
⑤ HDAC/PI3K α ：组蛋白去乙酰化酶（HDAC）与磷脂酰肌醇-3-激酶 α （PI3K α ）⑥ CD79b蛋白 ⑦ XP01：输出蛋白1

⑧ www.fda.gov/；⑨ https://ascopubs.org/doi/10.1200/JCO.2025.43.16_suppl.7050

安全性：不良反应可控，严重不良反应 (SAE) 发生率低

与目录内同适应症药物相比安全性优势

目录内适应症药物≥3级或严重感染/及SAE对比^{①②③④}



1. 常见不良反应是易于监测、可逆的血液学毒性
2. 严重不良反应发生率明显低于目录内同适应症药物
3. 感染及免疫相关毒性低，不增加额外不良反应处理或干预

与PI3K δ/γ 抑制剂相比安全性优势

1. 选择性抑制PI3K α ，无PI3K δ/γ 相关免疫毒性

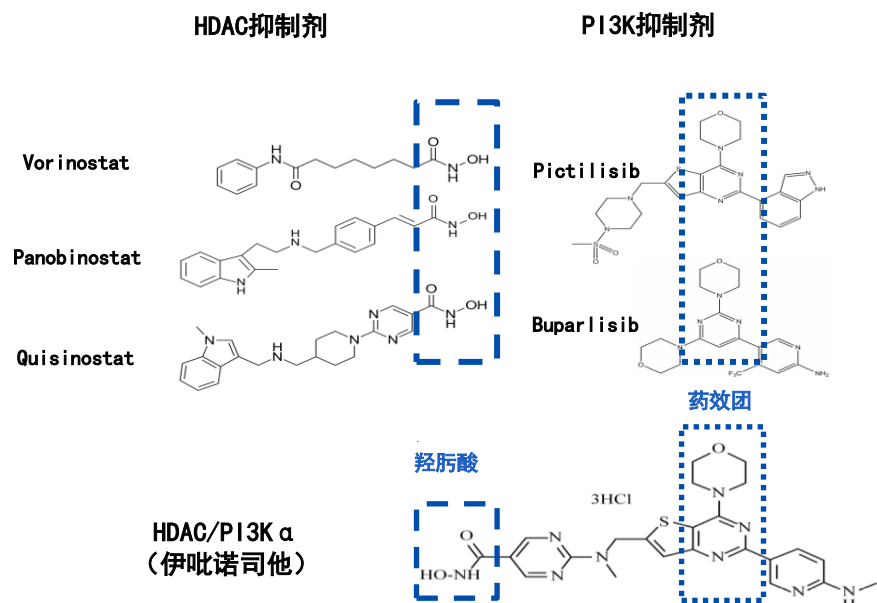
- 伊吡诺司他是HDAC/PI3K α 双靶点抑制剂，其PI3K抑制作用与目录内单靶点PI3K α 抑制剂伊那利塞类似，避免因抑制PI3K δ/γ 引起的免疫相关毒性，安全性更优。

2. 双靶点协同作用机制，降低免疫毒性

- HDAC抑制剂可下调 PI3K抑制剂诱导的髓系炎症相关基因表达，降低炎症介质水平，从而降低PI3K抑制剂相关免疫介导毒性^⑤

创新性：国内自主研发、全球首创 (First-In-Class) HDAC/PI3K α 双靶点抑制剂，国家1类新药

采用独特化合物技术，创造性的将HDAC抑制功能(羟肟酸部分)整合到PI3K抑制剂的药效团中，实现单一分子对HDAC和PI3K α 双重抑制^{①②③}



创新作用机制实现三大临床价值

1. 提升疗效、克服耐药

协调抑制PI3K-AKT/mTOR通路及阻断组蛋白去乙酰化，增加抗肿瘤活性；同时阻断肿瘤细胞的代偿逃逸，有效克服单靶点药物耐药

2. 提高安全性

HDAC抑制剂可下调 PI3K抑制剂诱导的髓系炎症相关基因表达，降低炎症介质水平，从而降低 PI3K 抑制剂相关免疫介导毒性^④

3. 增强免疫调节功能

增强肿瘤抗原性，重塑肿瘤免疫微环境，增强免疫调节功能^⑤

国家权威认证

★ 突破性治疗品种

★ 优先审评资格

★ "十三五"国家"重大新药创制"专项

^①Qian C. et al., Clin. Cancer Res. 2012, 18: 4104-4113; ^②蔡雄, 钱长庚. 等 ZL201080010977.1; ^③Cai X., Zhai H., Lai C., Qian C. WO 201008996 A ^④Horwitz SM, et al. Nat Med. 2024;30(9):2517-2527; ^⑤Fushun Fan, Pei Liu, Rudi Bao, et al. Cancer Res 2021;81:6233-6245.

公平性：弥补三线治疗短板，目标人群明确，基金影响可控

对公共健康的影响

- 三线及以上 r/r DLBCL 年患者约 5,000 例，尚无标准方案，疾病进展快、预后极差；
- 伊吡诺司他：ORR 54.6%，中位 OS 12.7 个月；
- 改善三线及以上患者的治疗可及性和生存结局，符合提高重大疾病保障水平的公共健康方向

弥补目录短板

- 自主研发、全球首创 HDAC/PI3K α 双靶点抑制剂；
- 获《中国临床肿瘤学会 (CSCO) 淋巴瘤诊疗指南2026》和《中国淋巴瘤诊疗指南2026版》双重推荐；
- 对 CAR-T 及 CD3/CD20 双抗治疗失败患者仍有效，弥补了三线r/r DLBCL治疗短板。

符合保“基本”原则

- 目录内缺乏高效、安全且能覆盖多种既往治疗失败人群三线及以上治疗药物；
- 本品临床价值显著，满足亟需的临床需求；
- 适用患者规模相对有限，预算影响可预测。

便于临床管理

- 安全性可控，常见不良反应为可逆的血液学毒性；
- 严重不良反应发生率低，不增加额外医疗支出。