

康特替尼颗粒（首要泽®）

- 化药1类创新药
- 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
- 唯一的口服颗粒剂ALK抑制剂
- 国家重大新药创制专项品种

首药控股（北京）股份有限公司

目 录

01

基本信息

化药**1类**创新药，国产二代ALK抑制剂，国家重大新药创制专项品种

02

安全性

安全性与**耐受性**较同类品种呈现差异化**优势**；**减量/停药**发生率较**低**

03

有效性

显著提高ALK阳性患者**临床获益**，特殊人群疗效突出

04

创新性

多靶点**协同**作用，差异化获益；首创**颗粒剂型**，提升特殊人群给药可及性

05

公平性

较低治疗成本，减轻**低收入**患者负担，**防范**因病致贫返贫，每日**一袋**，用药便利

康特替尼颗粒 满足吞咽困难人群给药需求，提升用药可及性

唯一颗粒剂型ALK抑制剂，满足多样化临床需求

通用名	康特替尼颗粒
注册分类	化药1类创新药
商品名	首要泽®
剂型	颗粒剂
规格	600mg/袋、450mg/袋
适应症	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600mg，每日一次，空腹口服，持续给药直至疾病进展或患者无法耐受；如出现不耐受情况，可减量至450mg，每日一次
中国获批时间	2026年6月
目前大陆地区同通用名药品的上市情况	无，独家药品
全球首次上市时间及国家/地区	2026年6月 中国
是否为OTC药品	否

建议参照药品：盐酸恩沙替尼胶囊

【参照药品选择理由】

- 1 适应症基本一致：**均用于ALK阳性局部晚期或转移性NSCLC的一线治疗。
- 2 医保指定参照品：**既往两年国谈同类产品医保局指定参照品。
- 3 国产自主研发代表性品种：**首个国产上市的第二代ALK抑制剂，具有良好的本土临床实践基础和可及性。
- 4 价格较低：**医保目录中价格**较低**的ALK抑制剂。

康特替尼颗粒¹

- 颗粒冲服，易于吞咽
推荐剂量600mg，每日一次
- 固定规格（600/450mg/袋）
每次1袋，给药路径简化
- 安全性和耐受性好，减药和停药比率低

盐酸恩沙替尼胶囊²

- 胶囊整粒吞服
推荐剂量225mg，每日一次
- 多规格组合服用（100/25mg/粒）
每次2-3粒，给药路径相对复杂
- 皮疹、便秘等副作用高发

参考文献：

1. 康特替尼颗粒中文说明书（2026年5月）；2. Horn, L., et al. JAMA Oncol 2021.

康特替尼颗粒 安全性良好、给药便捷，弥补现有治疗局限

疾病基本情况

肺癌患者存活率和生活质量低

- 肺癌的发病率和死亡率居中国肿瘤首位，2022年新增肺癌患者人数106.06万人，肺癌死亡患者人数73.33万人，且新增患者人数仍呈递增趋势¹。
- 肺癌患者生活质量低于其他恶性肿瘤患者²，晚期非小细胞肺癌患者5年存活率不足5%³。

ALK阳性非小细胞肺癌

- NSCLC在肺癌中占比80-85%，中国人群ALK阳性发生率为5-7%⁴。按照人群占比估计，中国新发ALK阳性NSCLC患者约每年4.2-6.3万人。
- 目录内第一代ALK抑制剂疗效不佳，第二、三代获益更优，但**安全性和耐受性**仍需持续关注。

临床亟待解决的核心痛点：

1 耐受性不足限制持续治疗

现有ALK抑制剂治疗中，**剂量调整及治疗中断**发生率较高，影响持续给药；临床研究显示，约**16-67%**患者需**剂量降低**，**19-72%**发生**治疗中断**，**6-13%**最终**停药**⁵⁻¹¹。

2 特定人群给药可及性不足

晚期NSCLC**体能状态差**和**吞咽困难**患者预后不佳，死亡风险显著增加 (ECOG PS 2-4分和吞咽困难患者HR分别为1.89和1.34)^{12, 13}片剂胶囊剂存在**给药障碍**，依从性不高。

3 用药复杂性影响患者依从性与疗效稳定性

复杂给药和**剂量调整**方案导致**依从性下降**，影响长期疗效获益。临床需要服药频次低，服药更**便捷**的药物。

参考文献：

1. Han B., et al. J Natl Cancer Cent 2024; 2. Polanski, J., et al. Onco Targets Ther 2016; 3. 原发性肺癌诊疗指南，2022版； 4. Yang C., et al. Annu Rev Med 2020; 5. Horn, L., et al. JAMA Oncol 2021; 6. Yang, Y., et al. Signal Transduct Target Ther 2023; 7. Shi Y., et al. J Thorac Oncol 2024; 8. Peters, S., et al. N Engl J Med 2017; 9. Camidge, D. R., et al. J Thorac Oncol 2021; 10. Tan, D. S. W., et al. JTO Clin Res Rep 2020; 11. Solomon, B. J., et al. J Clin Oncol 2024; 12. Ajaykumar Singh, et al. Ecancermedicallscience 2022; 13. Marmor, S., et al. J Geriatr Oncol 2020.

康特替尼颗粒 安全性良好、耐受性佳，不良事件发生率低

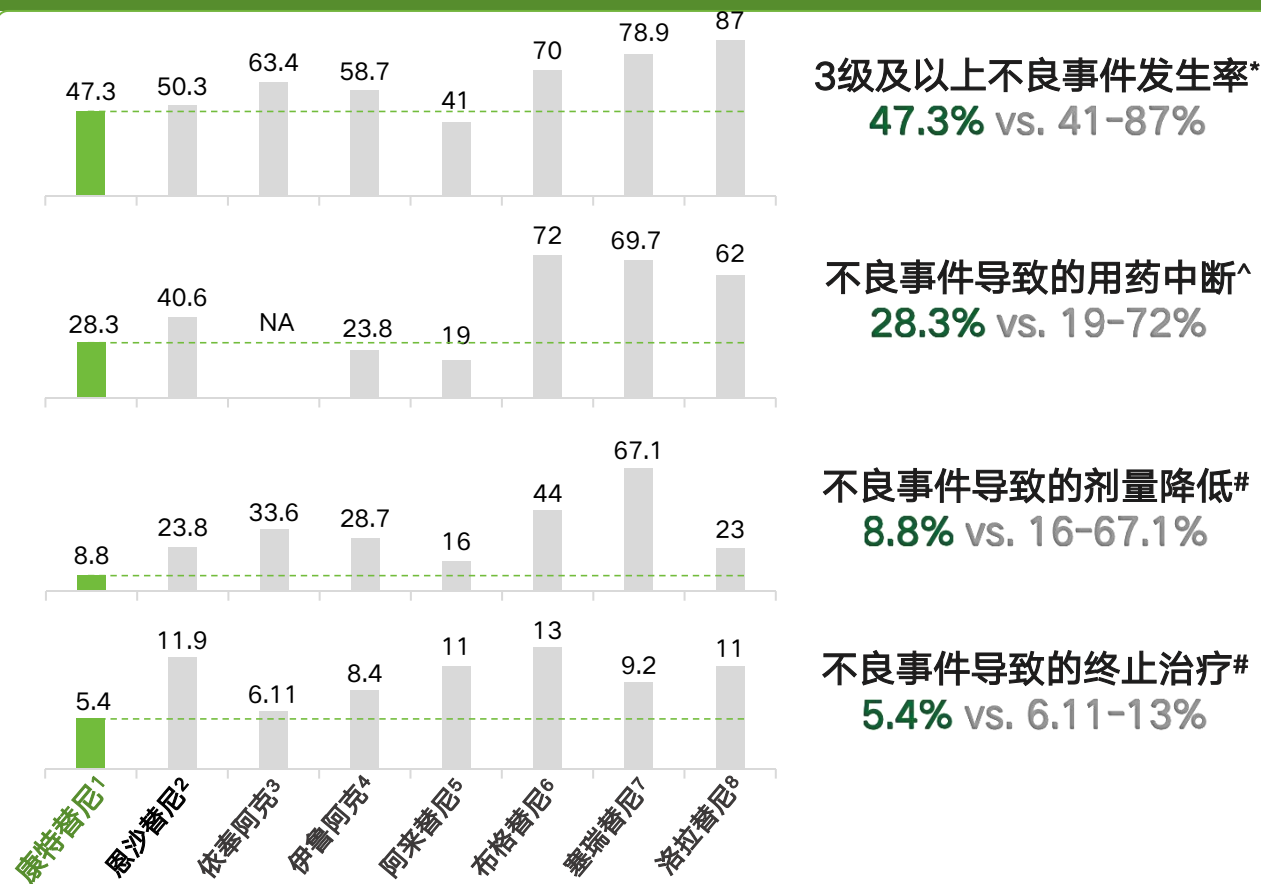
整体安全性好，不良反应发生率低

- 无安全性警告、无黑框警告、无撤市信息。
- 大多不良事件为轻中度且可通过标准治疗或剂量调整控制。
- 对于轻度肾功能不全、轻度肝功能不全患者，以及65岁及以上的老年患者**无需调整剂量**。
- 常见不良反应包括腹泻、呕吐、腹痛、恶心等。3-4级不良反应包括γ-谷氨酰转移酶升高、腹泻、丙氨酸氨基转移酶升高，多数经剂量调整或暂停给药后可恢复。
- **康特替尼颗粒整体耐受性良好，优于已上市第二、三代ALK抑制剂**，且用药中断、剂量降低及治疗终止发生率较低。

参考文献：

1. 康特替尼颗粒III期临床研究CSR报告v0.4;
2. Horn, L., et al. JAMA Oncol 2021;
3. Yang, Y., et al. Signal Transduct Target Ther 2023;
4. Shi Y., et al. J Thorac Oncol 2024;
5. Peters, S., et al. N Engl J Med 2017;
6. Camidge, D. R., et al. J Thorac Oncol 2021;
7. Tan, D. S. W., et al. JTO Clin Res Rep 2020;
8. Solomon, B. J., et al. J Clin Oncol 2024.

≥3级不良事件发生率更低、耐受性更好



注：非头对头临床试验对比，不良反应不同统计维度可能影响结果解读；

*. 不良事件数据来源于各ALK抑制剂对应参考文献中报道的TEAE发生率；

^. 不良事件数据来源于各ALK抑制剂对应参考文献中报道的TEAE发生率；其中，依奉阿克参考文献未报道TEAE导致的用药中断发生率；

#. 除依奉阿克外，所有ALK抑制剂的不良事件数据来源于对应参考文献中报道的TEAE发生率；依奉阿克不良事件数据来源于参考文献中报道的TRAE发生率。

康特替尼颗粒 特定不良反应发生率低，无新增特异性不良反应

- 相较于其他第二、三代ALK抑制剂常见的不良反应，康特替尼颗粒在便秘、疲乏、皮疹、瘙痒、水肿、高血压、关节痛及认知与情绪异常等方面的**发生率较低**，具备**突出**的安全性优势。
- 与其他同类药品比，**无新增**特异性不良反应。

	康特替尼 ¹	恩沙替尼 ²	依奉阿克 ³	伊鲁阿克 ⁴	阿来替尼 ⁵	布格替尼 ⁶	塞瑞替尼 ⁷	洛拉替尼 ⁸
临床研究	CT-707-III-01	eXalt 3	TQ-B3139-III-01	INSPIRE	ALEX	ALTA 1L	ASCEND4亚洲人群	CROWN
统计患者数量	205	143	131	143	152	136	76	149
咳嗽	17.1%	30.8%	25.19%	/	/	36%	28.9%	20%
便秘	12.7%	31.5%	21.37%	12.6%	34%	20%	17.1%	19%
发热	14.1%	20.3%	/	9.1%	/	16%	26.3%	20%
皮疹	7.3%	70.6%	/	24.5%	11%	19%	21.1%	12%
瘙痒	/	30.1%	/	/	/	21%	/	/
血肌酸磷酸激酶升高	8.8%	/	29.01%	60.1%	/	50%	/	13%
窦性心动过缓	6.3%	/	52.67%	11.9%	/	/	/	4%
疲乏	/	11.2%	31.30%	/	19%	21%	36.8%	30%
味觉障碍	1.0%	10.5%	/	/	3%	4%	/	6%
关节痛	/	12.6%	/	12.6%	11%	20%	/	28%
高血压	/	/	/	22.4%	/	32%	/	26%
认知影响	/	/	/	/	/	/	/	28%
情绪影响	/	/	/	/	/	4%	/	21%

■ TEAE发生率 ≥ 20%
■ TEAE发生率 10-20%
■ TEAE发生率 < 10%或未报道

注：
 基于非头对头临床研究间比较；
 塞瑞替尼安全性数据中“/”代表TEAE发生率 < 20%或未报道；
 * 该临床研究统计指标为外周水肿发生率。

参考文献：
 1. 康特替尼颗粒III期临床研究CSR报告v0.4；
 2. Horn, L., et al. JAMA Oncol 2021；
 3. Yang, Y., et al. Signal Transduct Target Ther 2023；
 4. Shi Y., et al. J Thorac Oncol 2024；
 5. Peters, S., et al. N Engl J Med 2017；
 6. Camidge, D. R., et al. J Thorac Oncol 2021；
 7. Tan, D. S. W., et al. JTO Clin Res Rep 2020；
 8. Solomon, B. J., et al. J Clin Oncol 2024.

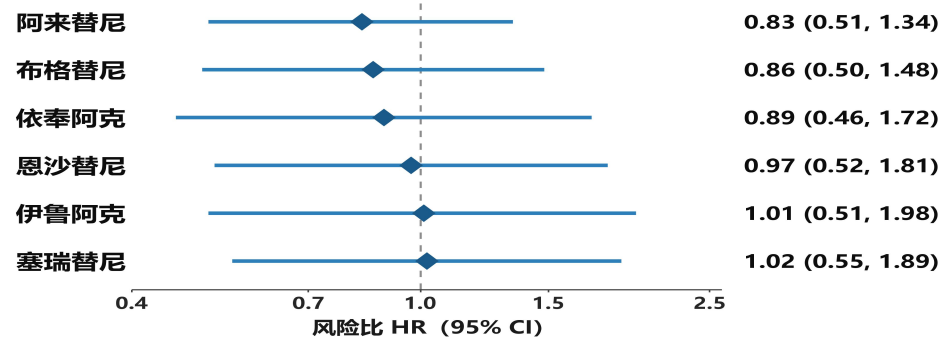
康特替尼颗粒 PFS/OS持续获益, 特殊人群表现突出

- 康特替尼一线治疗ALK阳性NSCLC患者中位生存时间超36个月（未达到），对照恩沙替尼经患者基线特征匹配调整后，显现生存获益优势（HR=0.997）*
- 康特替尼对照所有目录内二代TKI抑制剂均无OS获益显著差异。
- 康特替尼首次期中分析mPFS达到16.6个月 (HR=0.63, 95% CI 0.50-0.80)、mDoR达到17.1个月、客观缓解率为78.4%。
- 康特替尼颗粒在**基线脑转移及体能状态较差 (ECOG PS 2)** 等临床治疗难度较高人群及**女性患者**中均展现出**突出的PFS获益**。

对比所有二代ALK抑制剂OS均无显著差异#

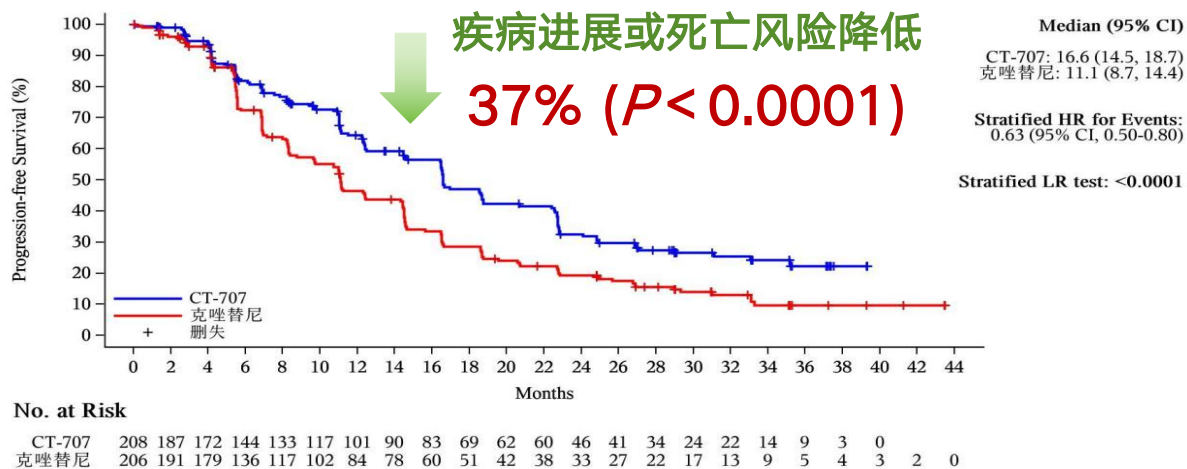
总生存期 (OS) 森林图

对照:康特替尼

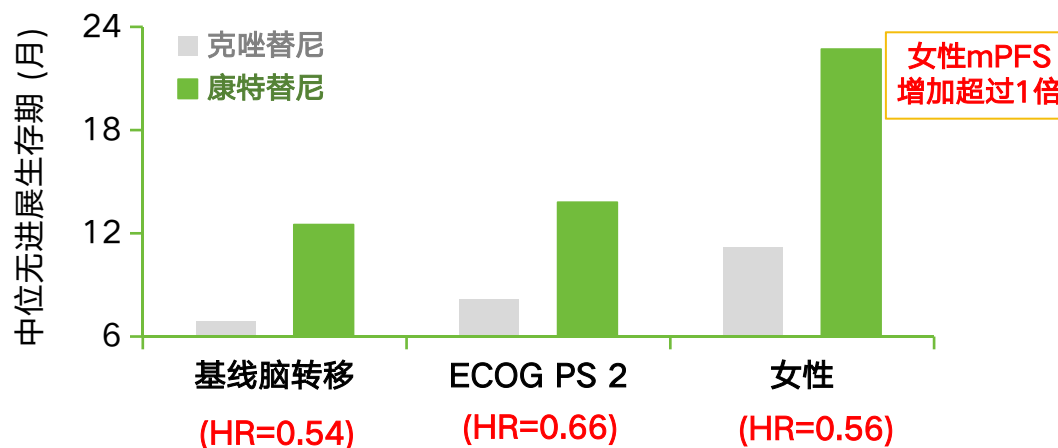


*采用贝叶斯NMA估计, 95%可信区间"

康特替尼显著延长患者无进展生存期



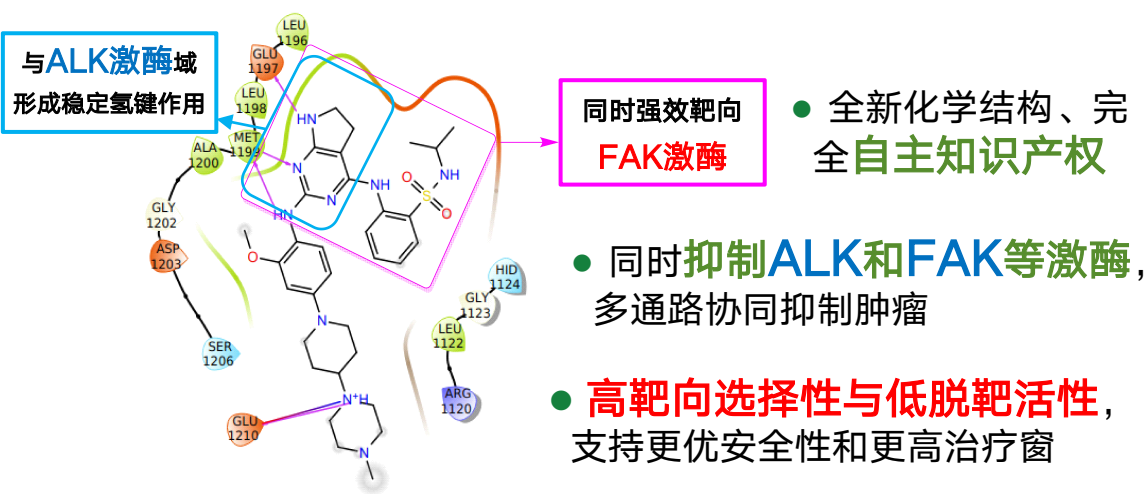
康特替尼在特殊人群中PFS获益突出



* 采用康特替尼个体水平数据进行匹配间接调整 (Matching Adjusted Indirect Comparison), 恩沙替尼基线人群IV占比显著低于康特替尼、脑转移占比显著高于康特替尼
采用Bucher间接比较。间接比较结果见《间变性淋巴瘤激酶 (ALK) 融合阳性转移性非小细胞肺癌成人一线治疗TKI抑制剂循证医学报告》, 已投稿ISPOR 亚太年会

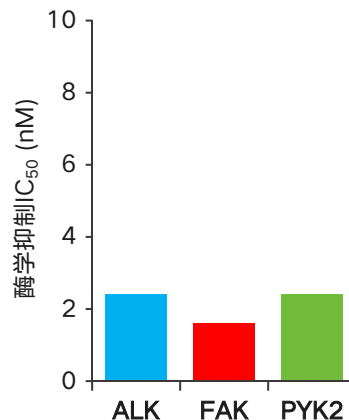
康特替尼颗粒 ALK/FAK协同抑制，激酶谱选择性更高，安全性好，特殊患者获益突出

化药1类创新药、独特化合物结构与作用机制

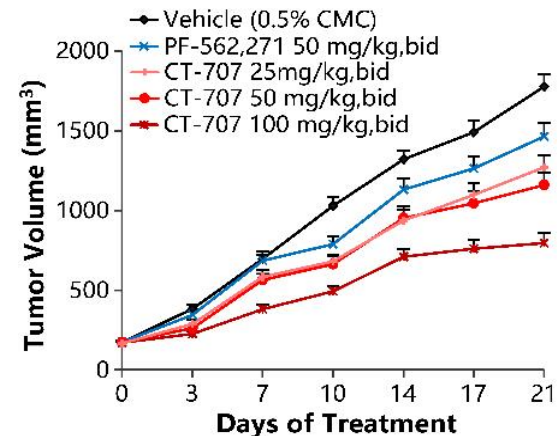


康特替尼强效阻断FAK信号轴激活¹

强效抑制FAK酶活



显著抑制FAK驱动的肿瘤生长和转移



全新化学结构、对ALK和FAK激酶的协同抑制，是特殊人群PFS获益突出的重要分子基础

- FAK在NSCLC中显著高表达，促进肿瘤细胞存活、侵袭及远端转移，是**明确的促癌与转移驱动轴**²。
- **FAK与雌激素/ERβ信号存在明确交叉**³，可能与康特替尼临床试验中女性NSCLC获益相关。
- 康特替尼具备**明确的FAK抑制活性**，并在临床前研究中显著抑制FAK高表达驱动的肿瘤生长和转移⁴。

注：“CT-707”同“康特替尼”；

参考文献：1. CT-707 IND申报研究报告，未公开；2. Sulzmaier, F. J., et al. Nat Rev Cancer 2014; 3. Rigracciolo, D. C., et al. J Exp Clin Cancer Res. 2019; 4. Liu, P., et al. Acta Biochim Biophys Sin (Shanghai). 2022.

康特替尼颗粒 颗粒剂型满足吞咽困难及老年患者特殊给药需求

独特颗粒剂型设计满足特定人群用药需求

1 吞咽困难患者用药选择匮乏，可及性不足

- 肺癌患者**全病程**中吞咽困难发生率达**12 - 68%**，且与不良生存预后显著相关 (总生存期 HR=1.34)¹。
- 该类患者对**片剂/胶囊剂型依从性较差**，存在未满足给药需求。

2 老年患者用药管理复杂、便捷性受限

- 晚期非小细胞肺癌患者中约**65 - 70%**在诊断时年龄**≥65岁**²，**复杂给药流程及剂量调整**增加临床管理难度。
- 老年患者对**更简化、更便捷的给药方式**存在明确临床需求。

颗粒剂型	温水冲服，适合 吞咽困难患者 选择
-------------	--------------------------

一日一次一袋口服 单步剂量调整	给药途径简便， 不易出错 ，适合 老年患者 选择
----------------------------	--

参考文献：
1. Marmor, S., et al. J Geriatr Oncol 2020; 2. Ganti, A. K., et al. JAMA Oncol 2021.

康特替尼颗粒获权威指南关注

中华肿瘤杂志 2025年4月第47卷第4期 Chin J Oncol, April 2025, Vol. 47, No. 4 · 283 ·
·指南与共识·
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版)
中国医师协会肿瘤医师分会 中国医疗保健国际交流促进会肿瘤内科学分会
通信作者:石远凯,国家癌症中心 国家肿瘤临床医学研究中心 中国医学科学院北京协和医学院肿瘤医院内科 重大疾病创新药早期临床试验评价关键技术北京市重点实验室,北京 100021, Email:syuankai@cicams.ac.cn

NCCN、ESMO、CSCO等国内外权威指南均明确推荐ALK抑制剂作为ALK阳性NSCLC一线标准治疗，并**优选第二、三代ALK抑制剂**；康特替尼作为新型第二代ALK抑制剂，其临床定位与指南推荐治疗策略高度一致！

国家鼓励研发
【注册分类】化药1类
**国家“十二五”重大
新药创制专项**

国家科技重大专项课题任务合同书

专项名称:	重大新药创制
主题:	
课题编号:	2015ZX09101001
课题名称:	ALK/FAK/Pyk2 抑制剂 CT-707 的临床研究
课题责任单位:	北京赛林泰医药技术有限公司
课题组长:	罗鸿
起止年限:	2015年1月至2018年12月

注：“CT-707”同“康特替尼”、“康太替尼”

康特替尼颗粒 定价较低、节省医保基金，本土企业、保证临床供应

对公共健康的影响

- 肺癌死亡率居肿瘤之首。其中ALK阳性患者占5%-7%，身体状态差的患者需要更安全有效的治疗药物
- 康特替尼的总生存获益与参照药品总体相当，可显著降低疾病死亡风险；与同类药物相比，**安全性**和**耐受性**更**优**，利于提升依从性、提高患者生存质量

弥补目录短板

- 目录内**唯一**的二代ALK抑制剂**颗粒剂**，满足晚期肿瘤**吞咽困难**患者的迫切临床需求
- **安全性**好，更适用于身体状态不佳的患者治疗
- 为ALK阳性晚期NSCLC患者提供**新**的治疗**选择**

符合“保基本”原则

- 康特替尼颗粒**性价比高**，可替代目录内ALK抑制剂，提升患者用药可及性，**节省**医保基金
- 康特替尼**定价较低**，减轻**低收入**患者负担，**防范**患者**因病致贫返贫**

便于临床管理

- 每次**一袋**，每日**一次**，服用方便，**依从性**好
- 适应症表述明确，检测方法成熟可靠，**无**临床滥用风险和超说明书使用风险
- **1类新药**，**本土**企业，国内供应链，**保证**供应

康特替尼颗粒

未满足治疗需求	<ul style="list-style-type: none">• 现有ALK抑制剂耐受性不足，剂量调整及治疗中断发生率较高• 晚期肿瘤吞咽困难发生率较高，患者需要颗粒剂型
安全性	<ul style="list-style-type: none">• 与同类品种相比，≥3级不良事件发生率更低、耐受性更好• 减量/停药发生率低，且在特定不良反应发生率具有差异化优势
有效性	<ul style="list-style-type: none">• 一线治疗显著提升患者获益，降低疾病进展或死亡风险• 低体能状态、女性患者PFS获益明显，总生存持续获益
创新性	<ul style="list-style-type: none">• ALK与FAK协同抑制，选择性高，安全性好，特殊人群获益• 颗粒剂型适合吞咽困难患者口服给药，提高依从性
公平性	<ul style="list-style-type: none">• 化药1类创新药，本土企业，国内供应链，保证稳定供应，常温贮藏• 康特替尼定价较低，减轻低收入患者负担，节省医保基金