

洛布替尼片（麓可达）

全球首个且唯一 共价兼非共价 第4代 BTK抑制剂



获批适应症：单药适用于既往接受过至少**两种系统性治疗**（含布鲁顿氏酪氨酸激酶[BTK]抑制剂）的复发或难治性套细胞淋巴瘤（MCL）成人患者

基本信息

- **洛布替尼**是全球首个且唯一 **共价兼非共价 第4代** BTK抑制剂，为业内首创
- 获批用于BTK抑制剂经治的复发/难治性（R/R）套细胞淋巴瘤（MCL）患者的靶向药

创新性

- **共价+非共价 双重抑制**：共价抑制野生型BTK，非共价抑制C481突变型BTK
- 独特结合口袋区别于1~3代BTK抑制剂，**填补耐药治疗空白**
- **全球&国内 两项III期头对头优效**注册研究已启动，多适应症有望全球超越或首个获批

有效性

- **高缓解率及缓解深度、长PFS、缓解持续时间持久**，获CSCO指南2026权威推荐
- 疗效覆盖全人群，高危人群疗效仍可观

安全性

- **总体耐受性良好**，注册研究表明大多AE为1/2级，无TRAE导致停药或死亡
- 超高激酶选择性，**脱靶风险低**，可为老年、体弱及基础病患者提供**长期、安全用药**

公平性

- 弥补目录短板，洛布替尼为BTKi经治MCL患者**提供更优治疗选择**
- 患者人群极小，**对医保基金影响有限**，可节约住院和不良反应管理成本
- 单药治疗、固定剂量口服，门诊管理便利

洛布替尼是全球首个且唯一共价兼非共价第4代BTK抑制剂，为业内首创



药品基本信息

通用名 (商品名)	洛布替尼片 (麓可达)
注册规格	100mg (主谈判规格) ; 25mg
适应症	单药适用于既往接受过至少两种系统性治疗 (含布鲁顿氏酪氨酸激酶[BTK]抑制剂) 的复发或难治性套细胞淋巴瘤 (MCL) 成人患者
用法用量	150mg (1片 100mg 和 2片 25mg 的片剂), 每日一次, 口服
作用机制	共价兼非共价BTK抑制剂
中国上市时间	2026年6月 优先审评
全球首个上市国家 (上市时间)	中国 (2026年6月)
目前中国大陆地区同通用名药品上市情况	独家药品
是否为OTC药物	否



建议参照药：匹妥布替尼

✓ 匹妥布替尼——建议作参照药

- **医保目录内唯一相同适应症：**匹妥布替尼适用于BTK抑制剂经治的R/R MCL患者，与洛布替尼的适应症人群表述一致
- **《CSCO淋巴瘤指南2026》明确指出**“对于免疫化疗及共价BTK抑制剂治疗后R/R MCL患者，还可以考虑**匹妥布替尼、洛布替尼**以及CAR-T或者双抗”

✗ 共价BTK抑制剂——不适宜作参照药

- **治疗人群不可比：**第1/2代共价BTKi仅用于**未经BTKi治疗的**R/R MCL患者；洛布替尼用于**BTKi经治进展**的高度难治人群
- **机制层面失效：**共价BTKi**耐药后继续使用共价BTKi基本无效；**洛布替尼针对共价BTKi**经治耐药人群**展现出显著的疗效
- **指南不推荐：**国内外主流指南**不推荐BTKi经治进展患者**继续使用共价BTKi，**不符合临床治疗路径**

洛布替尼双重抑制模式，可实现自动适配，攻克多重耐药失效难题，具备全球领先竞争力

疾病基本情况及人数

- 套细胞淋巴瘤 (MCL) 起源于成熟B细胞的非霍奇金淋巴瘤亚型，兼具侵袭性淋巴瘤病程**进展迅速**、惰性淋巴瘤**不可治愈**性特点^[1]
- 患者面临**耐药失效**或者**反复复发**的困境，BTKi经治停药后普遍预后较差 (**中位OS仅10个月**)^[2]
- MCL年新发约**1,500人**^[3]，BTKi经治**后线患者更少**且老年多发

BTKi经治人群的未满足临床需求突出

❌ 耐药失效难题

BTKi治疗后耐药失效的患者，患者后续治疗选择匮乏

❌ 肿瘤内存在异质性

前代BTKi为共价或非共价 (2选1)

难以通杀不同BTK突变的癌细胞，患者生存获益受限

❌ 现有方案有限且存在不足

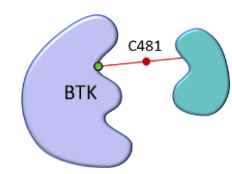
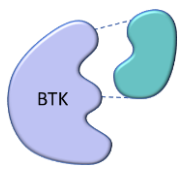
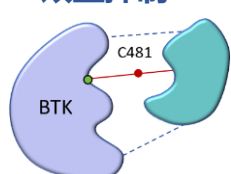
免疫化疗**耐受性差**

CAR-T **价高难可及**

BCL-2i 需**剂量爬坡**、血液毒性较大

非共价BTKi **疗效有待提升**

集前代优势于一体，解决多重耐药难题，实现迭代升级

对比维度	第1/2代 共价 BTKi	第3代 非共价 BTKi	第4代 共价兼非共价BTKi
代表药物	伊布替尼、泽布替尼 奥布替尼、阿可替尼	匹妥布替尼	洛布替尼
作用机制	仅共价 	仅非共价 	"共价+非共价" 双重抑制 
优势 VS 缺陷	<p>✅ 对野生型BTK 共价抑制</p> <p>3大优点 { 结合强, 疗效久, 对PK要求低</p> <p>❌ 易出现C481X突变</p> <p>❌ 第1代 脱靶毒性高</p>	<p>✅ 对C481X突变型 非共价抑制</p> <p>❌ 失去共价抑制的全部优点</p> <p>❌ 易出现T474X/L528W等非C481X突变</p>	<p>✅ 保留共价抑制的全部优点</p> <p>✅ 对C481X突变型 非共价抑制</p> <p>✅ 对非C481X突变型 共价抑制 (如T474X/L528W突变)</p>

第4代 洛布替尼——无论BTK怎么突变或不突变，都能实现强效抑制

洛布替尼三大创新机制，打破前代局限——共价兼非共价、独特结合口袋、bRo5设计^[1,2]

业界首创“共价兼非共价”双重抑制

B细胞恶性肿瘤患者内

无突变 野生型
已突变 可能是C481X突变
已突变 可能是非C481X突变
肿瘤异质性

洛布替尼分子 → 共价抑制 → BTK野生型及非C481X突变 (如T474X、L528W突变)

洛布替尼分子 → 非共价抑制 → BTK C481X突变

自动适配不同BTK突变类型的癌细胞，源头解决肿瘤内异质性难题

为实现泛耐药突变覆盖奠定基础

——完全区别于第1~3代BTKi的独特结合口袋

1/2/3代BTKi 与绿色口袋结合

4代BTKi 洛布替尼与紫色口袋结合

(前1~3代BTKi主要耐药机制)

全面抑制野生型及C481X/T474X/L528W等突变

超大空间位阻，提升前代BTKi的PK与安全性短板

——基于全球领先的“突破经典成药性五规则 (bRo5)”小分子靶向药物研发平台

PK优异

- 暴露量是前代共价BTKi的8~88倍
- 半衰期长达2~10倍
- 大空间位阻，人体代谢稳定性高

疗效强

- 分子满满占据BTK口袋
- 共价/非共价/氢键/范德华力等多重作用，抗肿瘤活性更强

疗效持久

- 单次给药24h内近100%抑制BTK
- 药效维持≥48h，如漏服超12h，无需补服，更便捷友好

安全性佳

- 大空间位阻，防止进入脱靶口袋
- 高激酶选择性，低脱靶风险

[1] 经典成药“5规则”：分子量小于500，氢键给体(包括羟基、氨基等)的数量不超过5个，氢键受体的数量不超过10个，化合物的油水分配系数的对数值(logP)不超过5。

[2] 突破经典成药性五规则 (Beyond Rule of Five, bRo5) 的小分子具备传统“5规则”小分子所不具备的新颖作用机制，或可靶向传统“5规则”小分子难以企及的“不可成药”靶点。

洛布替尼为国产自研 1 类新药，创新实力获高度认可，多适应症有望全球超越或首个获批

全球及国内III期头对头优效注册研究已启动

研究类型	国际多中心、随机、开放标签、阳性对照III期优效研究
研究人群	共价BTK经治的 R/R CLL/SLL 患者
研究设计	4代BTKi 洛布替尼 vs 3代BTKi 匹妥布替尼
证据等级	有望产出高质量证据支持全球准入

*以上临床设计已入选2026 ASCO壁报展示



研究类型	国内多中心、随机、开放标签、阳性对照III期优效研究
研究人群	R/R MCL患者
研究设计	4代BTKi 洛布替尼 vs 研究者选择的BTKi
证据等级	III期确证性研究 有望实现对前代BTKi的全面超越

创新价值获权威认可



2024被CDE纳入**突破性疗法品种**

(ROCK-2研究: R/R non-GCB DLBCL 适应症)



2025被CDE纳入**优先审评品种**

(ROCK-1研究: R/R MCL 适应症)

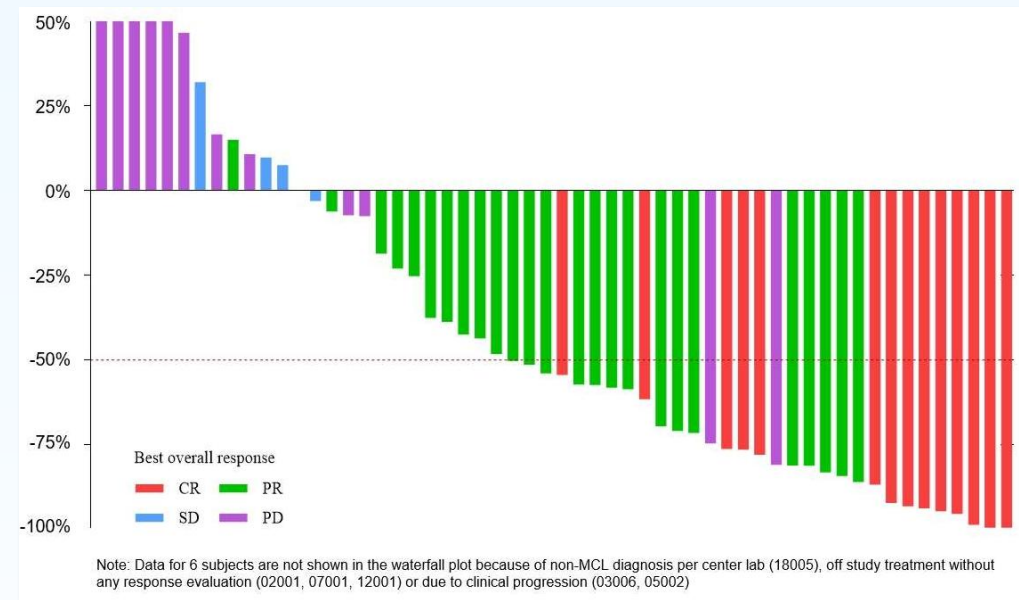
国际专利及多适应症布局

- ✓ **国产自主研发1类新药**: 核心化合物专利已获中、美、澳等多个国家授权
- ✓ **多适应症全面布局**: 多项适应症* 的优秀成果在CSCO、ASH、EHA、ASCO等国内外顶级学术会议口头报告及壁报展示
- ✓ **有望全球首个获批**: non-GCB DLBCL适应症

*包括 MCL、non-GCB DLBCL、MZL、PCNSL、CLL/SLL



洛布替尼针对BTKi经治的R/R MCL患者疗效优异——强缩瘤、深缓解、长PFS



IRC评估的病灶最佳变化百分比瀑布图

疗效指标	洛布替尼 ^[1] (II期 ROCK-1) (61例)	匹妥布替尼 ^[2] (I/II期 BRUIN) (152例)
ORR (%)	63.9	49.3
CR (%)	23.0	15.8
mPFS (月)	7.4	5.6

*非头对头研究



指南最新权威推荐

《CSCO淋巴瘤诊疗指南2026》
推荐 **洛布替尼** 用于R/R MCL治疗

“对于免疫化疗及共价BTK抑制剂
治疗后R/R MCL患者，还可考虑
匹妥布替尼、**洛布替尼**等”

——摘自CSCO淋巴瘤诊疗指南2026

总体缓解率 (ORR) 高

ORR 高达63.9%

(研究主要终点)

在BTKi经治的高度难治人群中，
仍显示出明确、高效的抗肿瘤活性

完全缓解率 (CR) 高

CR 高达23.0%

快速降低肿瘤负荷水平，
带来更深层次的缓解

无进展生存期 (PFS) 优

mPFS 长达7.4个月

更持久生存获益 (mOS尚未达到)

mDOR 长达16.5个月

更稳定、更持久的临床缓解

洛布替尼高效抗肿瘤作用覆盖全人群，对高危人群疗效仍显著

不同患者亚组均保持稳定疗效

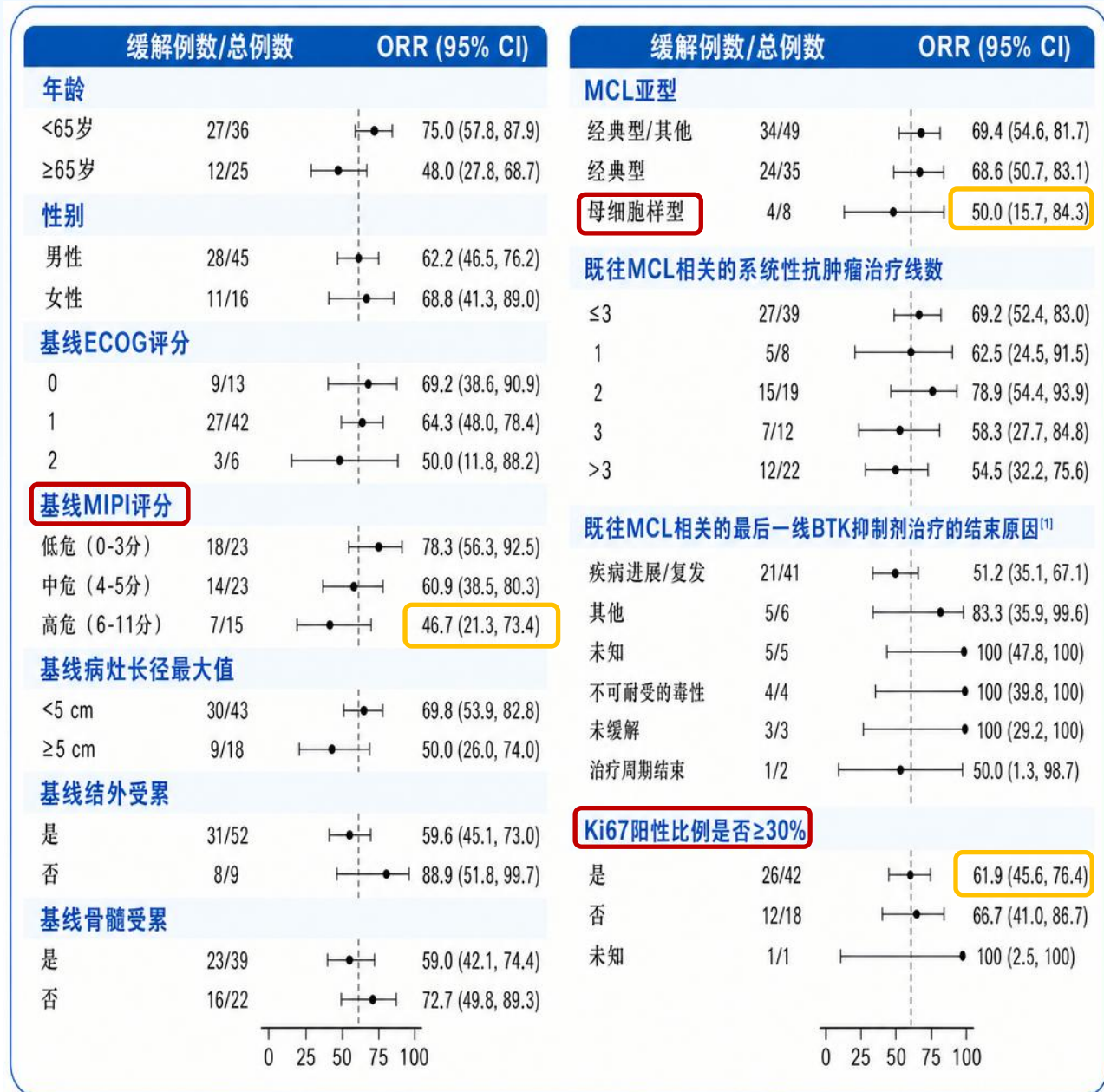
IRC评估的ORR亚组分析结果显示：**不同亚组均可获得高缓解**

亚组分类（如右图）包括：基线 ECOG 评分、**基线 MIPI 评分**、基线病灶长径最大值、有无结外受累、有无骨髓受累、**MCL 病理亚型**、既往治疗线数、**Ki67 阳性比例是否≥30%**等

针对高危人群的疗效仍可观

ORR (%)	洛布替尼 [1]	匹妥布替尼 [2]
MIPI评分高危	46.7	30.2
母细胞样型	50.0	40.0
Ki-67≥30%	61.9	44.4

*非头对头研究



[1] 洛布替尼2025 ASH 报告 [2] 匹妥布替尼2025 ASH 报告

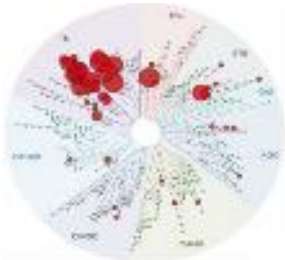
洛布替尼总体耐受性良好，大多AE为1/2级，超高激酶选择性，降低脱靶风险

激酶树状图对比

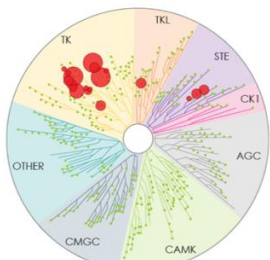
● 代表药物所靶向的激酶

红点越大，代表靶点作用越强

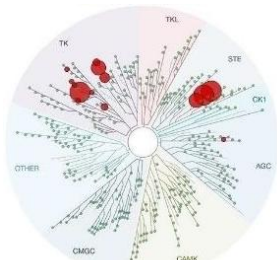
红点越分散，代表多种激酶抑制



1代 伊布替尼



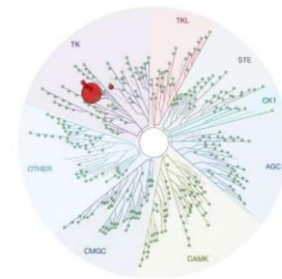
2代 泽布替尼



3代 匹妥布替尼

前3代BTK抑制剂

- 红点较分散
- 存在多种其他激酶抑制
- 脱靶效应更明显



第4代洛布替尼

红点高度集中于BTK激酶
(仅BTK一个大红点●)

证明脱靶效应小，安全性高

II期注册研究ROCK-1 [1]

基于II期研究ROCK-1中 62例 MCL患者接受150mg剂量的发生率≥20%的不良反应 (TRAE) :

血小板减少、中性粒细胞减少、贫血、白细胞/淋巴细胞升高

- **高选择性、低脱靶风险**: 洛布替尼红点高度集中于BTK (见上图)，对EGFR、ITK、TEC等激酶无明显抑制，为老年、体弱及合并心血管基础疾病患者提供更安全长期的治疗选择
- **多为1-2级血液学毒性**，整体特征与BTKi类药物相符；**严重感染、出血发生率较低，无房颤**
- **无TRAE导致停药或死亡**，TRAE导致的给药暂停和减量发生率较低

关键安全性指标 (%)	洛布替尼	匹妥布替尼 [3]
TRAE导致永久停药	0	9.0
TRAE导致死亡	0	7.0
≥3级药物相关感染性肺炎	6.5	14.8 (1例死亡)
≥3级药物相关出血 (合并)	1.6	3.9 (1例死亡)
TRAE导致暂停给药	21.0	32.0
TRAE导致剂量下调	3.2	4.7

*非头对头研究

说明书收载的安全性信息 [2]

基于302例 B 细胞恶性肿瘤* 患者接受≥150mg剂量的最常见不良反应 (TRAE) :

中性粒细胞减少症、血小板计数降低、青肿、贫血

- 大多数患者可通过**暂停用药、对症治疗**等措施得到缓解、恢复及继续治疗
- 仅**0.7%**患者因不良反应永久停药
- 仅**3.3%**患者因不良反应需下调剂量

* 302例B细胞淋巴瘤患者包括: MCL、CLL/SLL、non-GCB DLBCL、MZL、FL、WM等



洛布替尼实现机制创新，弥补目录短板，为BTKi经治MCL患者提供更优治疗选择



公共健康影响显著

- **BTKi经治进展后患者治疗选择有限且存在不足**，如耐药后无有效药物、后线疗效不佳、可及性或耐受性差等
- **洛布替尼独特双重机制，可显著改善患者治疗结局**
 - ① 对BTKi经治的MCL后线患者疗效突出，改善预后
 - ② 实现泛耐药突变覆盖，延长患者生存获益
 - ③ 脱靶效应小，尤其适用于老年体弱及合并心血管基础病患者



符合保基本原则

- **基金影响有限**：中国MCL新发约1,500例/年，BTKi经治的三线及以上MCL患者人数更少，对医保基金影响有限
- **成本优势明显**：单药口服，无需联合用药，安全性更优，可节省住院及不良反应管理成本



弥补目录短板

- **创新机制优势**：全球首个且唯一共价兼非共价第4代BTK抑制剂，有效应对肿瘤内异质性难题，提供更优临床选择
- **填补耐药治疗空白**：全面覆盖BTK野生型及多重耐药突变，满足BTKi经治人群的临床迫切需求



临床管理难度低

- **便捷给药**：每日1次口服，固定剂量，无需剂量爬坡，门诊管理便利，适合医疗机构和双通道管理
- **无滥用风险**：适应症范围明确，诊疗路径清晰，处方依据确凿，无需额外检测手段

MCL患者两线治疗失败（含BTK抑制剂） >>> 第4代BTKi洛布替尼，双重抑制、实现迭代升级，开创MCL治疗新格局