

申请纳入《基本医保目录》

# 伊那利塞片 (伊赫莱®)

从PIK3CA开启乳腺癌精准分子靶向治疗时代



**全新靶点填补治疗空白**

38年来中国首个且唯一精准靶向PIK3CA突变的药物



**首创“抑制+降解”机制实现疗效安全性双突破**

超双倍PFS获益 (17.2个月 vs 7.3个月)、OS延长至34个月、安全可控



**1类新药、中美两国“突破性疗法认定+优先审评”**

# 目录

## CONTENTS

### 1 基本信息

1类新药，唯一精准靶向PIK3CA突变的药物，建议**空白参照**

### 2 创新性

**三十八年**研发新突破，首创“抑制+降解”机制，**中美两国突破性疗法认定**

### 3 有效性

PFS**超双倍获益**，显著延长患者OS至**34个月**

### 4 安全性

无黑框警告，不良事件**可逆可管可控**

### 5 公平性

填补**PIK3CA突变**乳腺癌患者精准治疗空白，弥补目录短板

# 新靶点PIK3CA的发现及精准靶向药物伊那利塞的获批，彻底改变了乳腺癌传统治疗模式，引领乳腺癌步入精准分子靶向治疗新时代

## 原癌基因PIK3CA的临床意义重大<sup>1,2</sup>

### 引发耐药

- 内分泌/化疗治疗耐药的主要原因

### 预后标志

- PIK3CA突变的患者生存预后明显更差

### 常见突变

- 中国HR+乳腺癌PIK3CA突变率达**45.6%**

**PIK3CA获ESMO最高等级(IA级)推荐靶点<sup>2</sup>**

推荐级别与EGFR、ALK一致，高于AKT、PTEN

## PIK3CA开启乳腺癌精准分子靶向治疗时代<sup>3</sup>

因药物不可及，根据特定基因突变分类的精准分子靶向治疗策略尚未在乳腺癌领域获得广泛应用

随着重要靶点PIK3CA的精准分子靶向药物伊那利塞的获批，实现“**从0到1**”的突破，引领乳腺癌步入精准分子靶向治疗时代

精准分子靶向治疗药物目录内保障情况

精准分子靶向治疗时代

乳腺癌领域

**0种**药物保障

VS

肺癌领域

已有**>20种**药物保障  
(如赛沃替尼、舒沃替尼等)

1. Jia M, et al. Breast Cancer . 2021 May;28(3):644-652.

2. Mosele MF, et al. Ann Oncol . 2024 Jul;35(7):588-606.

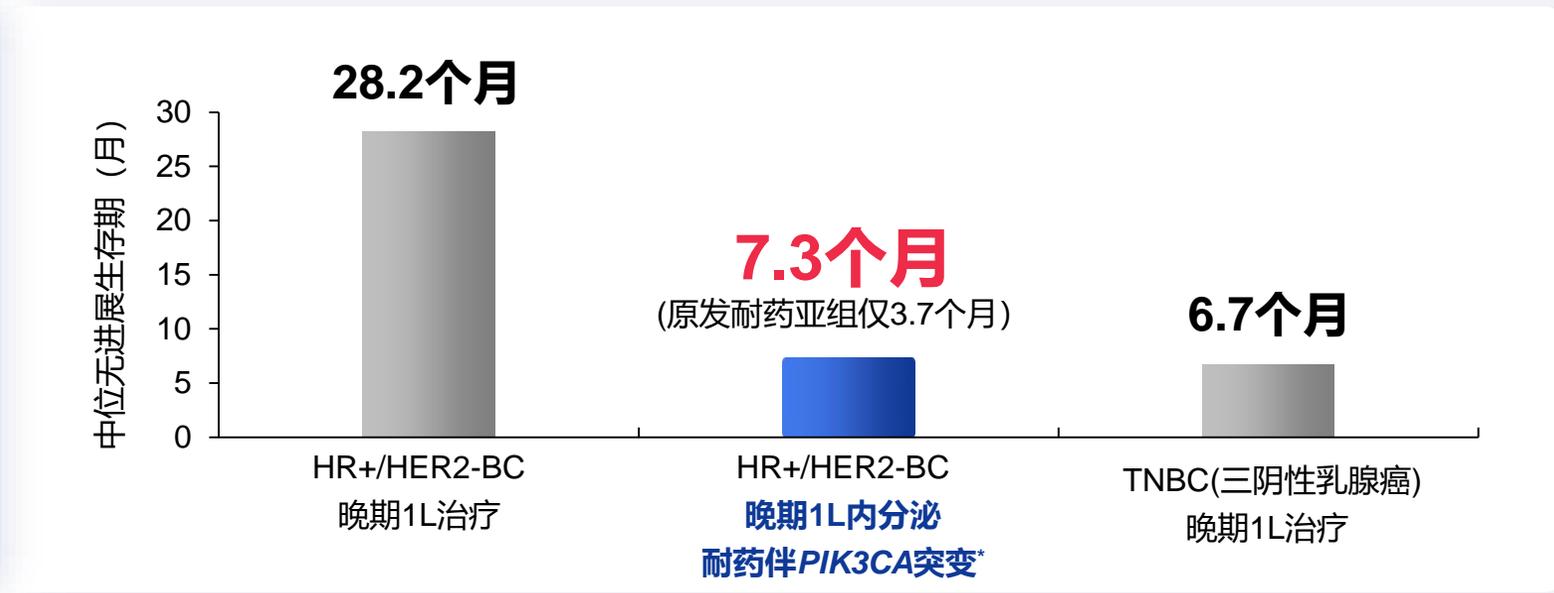
3. 2025CSCO非小细胞肺癌诊疗指南

# HR+/HER2-晚期乳腺癌5年生存仅34%，其中内分泌治疗耐药伴PIK3CA突变患者PFS仅7.3个月，目前无标准治疗方案，亟需有效、精准的靶向药物纳入医保

## HR+/HER2-晚期乳腺癌生存预后更差<sup>1</sup>



## 其中内分泌治疗耐药伴PIK3CA突变患者生存预后与三阴性乳腺癌接近<sup>2-4</sup>



## 临床针对PIK3CA突变患者**无标准治疗方案**

真实世界数据显示，目前临床实际使用的晚期一线方案超过15种，但疗效有限<sup>5</sup>

1. <https://seer.cancer.gov/>

2. Johnston S, et al. NPJ Breast Cancer. 2019;5: 1-8.

3. Liang Y, et al. Chin J Cancer Res . 2022 Apr 30;34(2): 117-130.

4. Turner NC, et al. N Engl J Med . 2024 Oct 31;391(17): 1584-1596.

5. 一项基于2018-2023年HLT数据库中9家医院中96位HR+/HER2-并携带PIK3CA突变的晚期乳腺癌患者真实世界研究

# 伊那利塞是中国唯一精准靶向PIK3CA突变的药物，填补治疗空白

## 1类新药，全球同步获批，目录内无合适参照，**建议空白参照**

### 基本信息

通用名：伊那利塞片
适应症：联合哌柏西利和氟维司群，用于内分泌治疗耐药（包括在辅助内分泌治疗期间或之后出现复发）、PIK3CA突变HR+/HER2-的局部晚期或转移性乳腺癌成人患者
注册规格： <b>9mg (临床常用规格)</b> ，3mg
用法用量： <b>9 mg</b> ，口服，每日一次
目前大陆地区同通用名药品上市情况：无
注册类别： <b>1类新药</b>
专利到期时间： <b>2036年</b>
是否为OTC药品：否

### 全球&中国同步获批

全球首次上市国家/地区及上市时间  
美国 **2024.10**

中国大陆首次上市时间  
**2025.3**获批

从递交上市申请到获批 仅6个月

从递交上市申请到获批仅9个月

### 参照药建议



## 建议空白参照

- 1 针对PIK3CA突变人群无标准疗法
- 2 无同适应症药物
- 3 无同作用机制药物
- 4 临床试验安慰剂对照<sup>#</sup>
- 5 中美两国授予突破性疗法认定

<sup>\*</sup>说明书推荐剂量9mg每日一次，临床试验剂量以9mg为主

<sup>#</sup>INAVO120临床试验试验组：伊那利塞+哌柏西利+氟维司群，对照组：安慰剂+哌柏西利+氟维司群

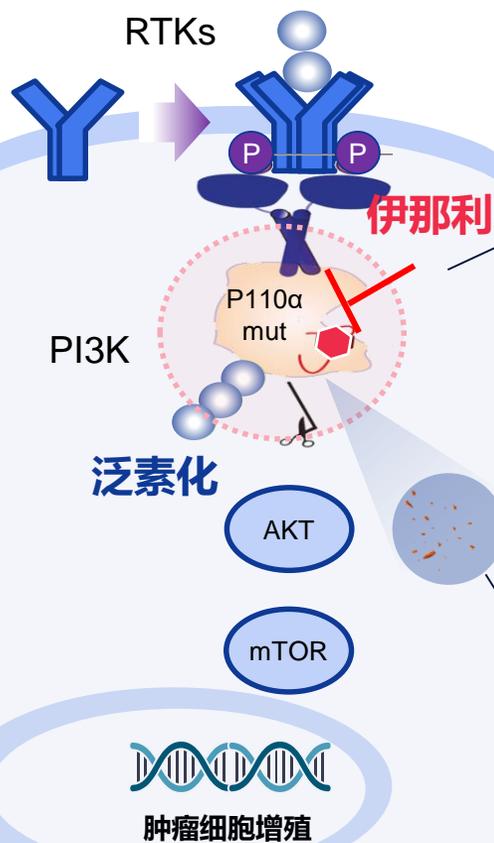
# 伊那利塞是全球唯一高选择性PI3K $\alpha$ 抑制剂及突变体降解剂，首创“抑制+降解”作用机制实现**疗效和安全性双突破**

1988  
首次发现PI3K

泛PI3K抑制剂  
存在严重安全风险

亚型特异型PI3K抑制剂  
疗效有限、不耐受

2025  
高选择性PI3K $\alpha$ 抑制剂  
及突变体降解剂  
伊那利塞中国获批<sup>1,2</sup>



## 高选择性抑制：

经分子结构优化，对 $\alpha$ 亚基的抑制选择性提升**300倍以上**，有效降低脱靶毒性风险

## 突变体降解：

结合突变型p110 $\alpha$ 使其构象变化，招募泛素化酶打上“降解标签”，促使突变蛋白被蛋白酶体降解

抑制  
+  
降解

**更精准** 强效缩瘤

**更彻底** 逆转耐药

**更安全** 减少毒副作用

1. Li H, et al. Mol Cancer . 2024 Aug 10;23(1): 164.  
2. Vasan N, et al. Nat Rev Clin Oncol . 2022 Jul;19(7): 471-485.  
3. Song KW, et al. Cancer Discov. 2022 Jan;12(1): 204-219.

4. Vanhaesebroeck B, et al. Nat Rev Drug Discov. 2021 Oct;20(10): 741-769.  
5. Hanan EJ, et al. J Med Chem . 2022 Dec 22;65(24): 16589-16621.

# 伊那利塞疗效突破，是HR+乳腺癌中唯一获得中美两国突破性疗法认定的药物，建议综合创新机制、临床获益及国内外创新资格认定给予伊那利塞**突破型创新分级**

基于首创“抑制+降解”作用机制带来的突破性临床获益，伊那利塞创新性获得广泛认可

	卡匹色替 <sup>1</sup>	伊那利塞 <sup>2</sup>
<b>PIK3CA 突变疗效</b>		
mPFS	5.6个月	17.2个月
mOS	N/A	34.0个月
<b>指南推荐地位</b>	晚期二线	晚期一线



**中美两国优先审评<sup>3,4</sup>**



**中美两国突破性疗法认定<sup>3,4</sup>**

**乳腺癌领域被中美两国均授予BTD的药物  
仅伊那利塞和德曲妥珠单抗\***



## 建议综合创新机制、临床获益及国内外创新资格认定给予伊那利塞突破型创新分级

- 首创“抑制+降解”作用机制
- 突破性临床获益
- 创新性获广泛认可(1类新药、优先审评、突破性疗法认定)

1. Turner NC et al. N Engl J Med. 2023;388(22):2058-2070.  
2. Jhaveri KL, et al. N Engl J Med. 2025 May 31.

3. <https://www.fda.gov>  
4. <https://www.cde.org.cn/>

BTD: 突破性疗法认定 \*德曲妥珠单抗HER2阳性乳腺癌适应症获中美两国BTD

# 伊那利塞实现超双倍PFS获益，中国患者获益一致，国内外指南共同推荐

## 伊那利塞助力PIK3CA突变患者PFS跃升



## 获国内外权威指南共同推荐

2025.V1 NCCN指南  
I类推荐



2025 ESMO指南  
I, A级推荐



2025 CSCO指南  
II级推荐, 1B



2025 CBCS指南  
可选方案推荐\*



2024 ABCC指南  
可选方案推荐\*

中国晚期乳腺癌规范诊疗指南(2024版)



伊那利塞核心临床试验INAVO120两次登顶新英格兰医学杂志 (IF值: 74.699)

临床试验入组**超过1/3为亚洲患者**，获益与全球人群一致，对亚洲及中国患者意义重大

1. Jhaveri KL, et al. N Engl J Med. 2025 May 31.
2. NCCN. Clinical Practice Guidelines in Breast Cancer v1. 2025.
3. ESMO Living Guideline, v1.2 April 2025

4. 中国抗癌协会乳腺癌诊治指南与规范 (2025年精要版)
5. 中国晚期乳腺癌规范诊疗指南 (2024版)
6. 伊那利塞说明书

\*指南更新时伊那利塞尚未获批

# 伊那利塞OS延长至34个月、ORR提升超两倍，临床获益显著

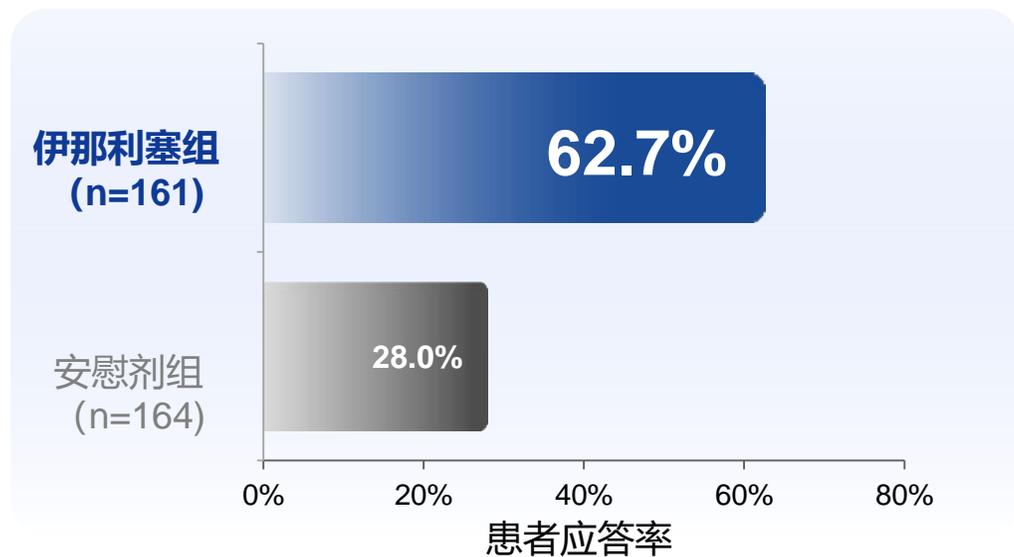
## OS延长至34个月

最佳疗效终点，“金标准”



## ORR提升超2倍

抗肿瘤活性的直接测量



1. Jhaveri KL, et al. N Engl J Med . 2025 May 31.  
2. Turner, N, et al. 2025 ASCO Annual Meeting Abstract 1003.

OS: 总生存期; ORR: 客观缓解率

# 伊那利塞说明书无黑框警告，安全性整体可逆可控

## 药品说明书刊载的安全性信息<sup>1</sup>

- 说明书**无黑框警告**
- 不良事件多数为**轻中度**（1-2级），整体安全性**可管可控、易处理且可逆**，相较安慰剂组未发现新的安全信号
- 因不良反应调整剂量/终止治疗的比例较低

## 特殊人群用药信息<sup>1</sup>

- 年龄≥65岁的患者**无需**调整剂量
- 轻度肾功能、肝功能损害患者**无需**调整剂量

## 常见不良反应可管可控<sup>2-4</sup>

高血糖症是PI3Kα抑制剂的常见不良反应：PI3Kα是参与脂肪细胞和肌管中胰岛素应答的主要亚基，当PI3Kα活性受到抑制时，易出现高血糖现象<sup>2,3</sup>

**伊那利塞引起的高血糖可预测、易识别、易管理**

**3-4级发生率仅6.8%<sup>4</sup>**



至首次出现高血糖的中位时间为  
**7天**

非胰岛素抵抗引发，发病时间短，可通过**调整剂量和使用降糖药物控制**

**96%**高血糖发生患者至少有1级的改善，改善中位时间为**8天**

\* 来源于INAVO120研究，该研究不良反应评价标准采用CTCAE分级5.0版；说明书中采用CTCAE第4.03版

1. 伊那利塞说明书

2. Tankova T, et al. Cancers (Basel) 2022; 14: 1598;

3. Goncalves MD & Farooki A. Int Cancer Ther 2022

4. Nicholas C, et al. 2025 ASCO Abs 1003

# 伊那利塞填补PIK3CA突变乳腺癌患者精准治疗空白，口服使用助力降低住院率



## 符合“保基本”原则

- PIK3CA突变、内分泌治疗耐药HR+/HER2-晚期乳腺癌的**临床必需且唯一**精准靶向用药
- 开启乳腺癌精准分子靶向治疗时代，**助力晚期乳腺癌进一步规范化诊疗**



## 弥补目录短板

- **填补**PIK3CA突变乳腺癌患者精准靶向治疗**长期空白**
- **超双倍突破临床获益**



填补空白  
突破创新



## 对公共健康的影响

- 伊那利塞可在不影响生活质量的前提下，有效延长晚期乳腺癌PIK3CA突变患者总生存，降低疾病复发或死亡风险，帮助女性更好地回归社会和家庭



## 便于临床管理

- 精准分子靶向用药，依据**精准基因检测**诊断，获批适应症及联合用药明确，内分泌治疗耐药定义清晰，便于医保经办机构审核执行
- 口服用药，**每日一次一片**，便于临床管理
- 门诊使用，助力**降低**晚期乳腺癌治疗**住院率**