**诺诚健华奥布替尼**

奥布替尼（商品名：宜诺凯®）是诺诚健华研发的1类创新药，是具高度选择性的新型布鲁顿酪氨酸激酶（BTK）抑制剂，用于治疗血液瘤及自身免疫性疾病，具有全球知识产权。

BTK抑制剂能阻断B细胞受体（BCR）诱导的BTK活化及下游信号通路，从而抑制B细胞肿瘤的生长和促进细胞凋亡。目前已有的BTK抑制剂中，由于药物靶点选择的不够精准，尚存在BTK靶点占有率个体间差异较大、脱靶效应等问题，仍迫切需要更有效安全的BTK抑制剂来满足患者治疗需求。

**奥布替尼的先进性和前沿性——更精准的靶点选择性，更高的完全缓解率**

作为新型不可逆共价结合的BTK抑制剂，奥布替尼具有创新的化合物结构，其更小的空间夹角，三维结构与BTK活性中心更匹配，提高了BTK的激酶抑制活性和选择性；其采用单环母核，减少了铰链区H键结合位点，降低与其他激酶结合的可能，去除手性中心，减少空间构象，从而避免与其他激酶的相互结合，提高了激酶选择性。结构的优化保证了奥布替尼具有高选择性，降低了脱靶效应，使奥布替尼拥有更好的疗效和安全性。

例如，奥布替尼对BTK靶点的占有率近100%，创新剂型固体分散体提高生物利用度，在治疗复发/难治慢性淋巴细胞白血病（CLL）/小细胞白血病（SLL）中，总缓解率高达93.8%，完全缓解率（CR/CRi）高达26.3%。；个体间差异小，对其他激酶无明显抑制作用，在确保疗效的同时又有效避免了由于脱靶效应造成的不良反应；实现了一天一次150毫克口服给药，为患者持续治疗带来了方便。

凭借在创新性方面的出色表现，奥布替尼获得多项荣誉：

* 北京市新技术新产品（服务）证书
* 2021年“健康中国·21癌症关注”年度10大优秀创新性抗癌药物案例
* 2021西普会“2020年度新药”
* 2021 中国国际服务贸易交易会“科技创新服务示范案例”
* 《证券时报》2020药物创新济世奖“年度十大药物创新成就奖”
* 创世技“2020颠覆性潜力榜”

**奥布替尼的应用前景**

**（1）中国获批上市，并获得美国FDA突破性疗法认定**

淋巴瘤是增长率最快的恶性肿瘤之一，也是中国死亡率最高的十大恶性肿瘤之一，每年新增约9.3万人被诊断为淋巴瘤，超过5万人死于这种癌症且仍逐年升高。BTK抑制剂已成为B细胞恶性肿瘤的重要方法。根据弗若斯特沙利文分析，预计到2025年，全球BTK抑制剂市场规模将以22.7%的复合年增长率达到200亿美元，并以5.5%的复合年增长率扩大到 2030年的261亿美元。

奥布替尼于2020年12月25日在中国附条件获批用于治疗复发/难治性慢性淋巴细胞白血病(CLL)/小淋巴细胞淋巴瘤(SLL)、以及复发/难治性套细胞淋巴瘤(MCL) 两项适应症。2021年底，奥布替尼被纳入国家医保以惠及更多患者。2022年11月22日，奥布替尼在新加坡获批用于治疗复发/难治性套细胞淋巴瘤患者。2023年4月20日，奥布替尼在中国获批用于治疗复发/难治性边缘区淋巴瘤（MZL）患者。

除此之外，正在中国和美国开展以奥布替尼作为单独用药或联合用药的多中心、多适应症临床试验，如一线治疗弥漫性大B细胞淋巴瘤(DLBCL) MCD 亚型等适应症。

奥布替尼获得美国食品药品监督管理局（FDA）授予突破性疗法认定（Breakthrough Therapy Designation），用于治疗复发/难治性套细胞淋巴瘤（R/R MCL），目前已完成患者入组。

奥布替尼治疗多发性硬化（MS）的全球II期临床研究，以及在中国治疗系统性红斑狼疮（SLE）、原发免疫性血小板减少症（ITP）II期研究都已获得概念验证（PoC），奥布替尼治疗视神经脊髓炎谱系疾病（NMOSD）的临床试验正在进行中。

**（2）加速全球市场化布局，市场前景广阔**

奥布替尼正在以中美两地为主的全球市场快速推进在研产品的临床试验与注册申报工作，以实现产品管线中的候选药物早日造福全球患者。

* 奥布替尼已经分别获得中国、美国等国家和地区的专利授权；
* 基于优异的靶点选择性及临床安全性，奥布替尼得到了临床专家的广泛认可，已被纳入中国临床肿瘤学会（CSCO）《2021年恶性淋巴瘤诊疗指南》，并被列为治疗复发/难治慢性淋巴细胞白血病和小淋巴细胞淋巴瘤（R/R CLL/SLL）及复发难治套细胞淋巴瘤（R/R MCL）的一级推荐方案。
* 奥布替尼的开发还获得“十三五”国家新药创制重大专项支持，也成为十三五专项的收官之作。
* 由于可穿透血脑屏障，奥布替尼有望成为治疗多发性硬化这种自身免疫性疾病的新选择。目前，全球尚无针对BTK这个靶点的用于治疗自身免疫性疾病领域的获批药物。