头豹 LeadLeo

www.leadleo.com

2020年
中国BTK抑制剂行业短报告

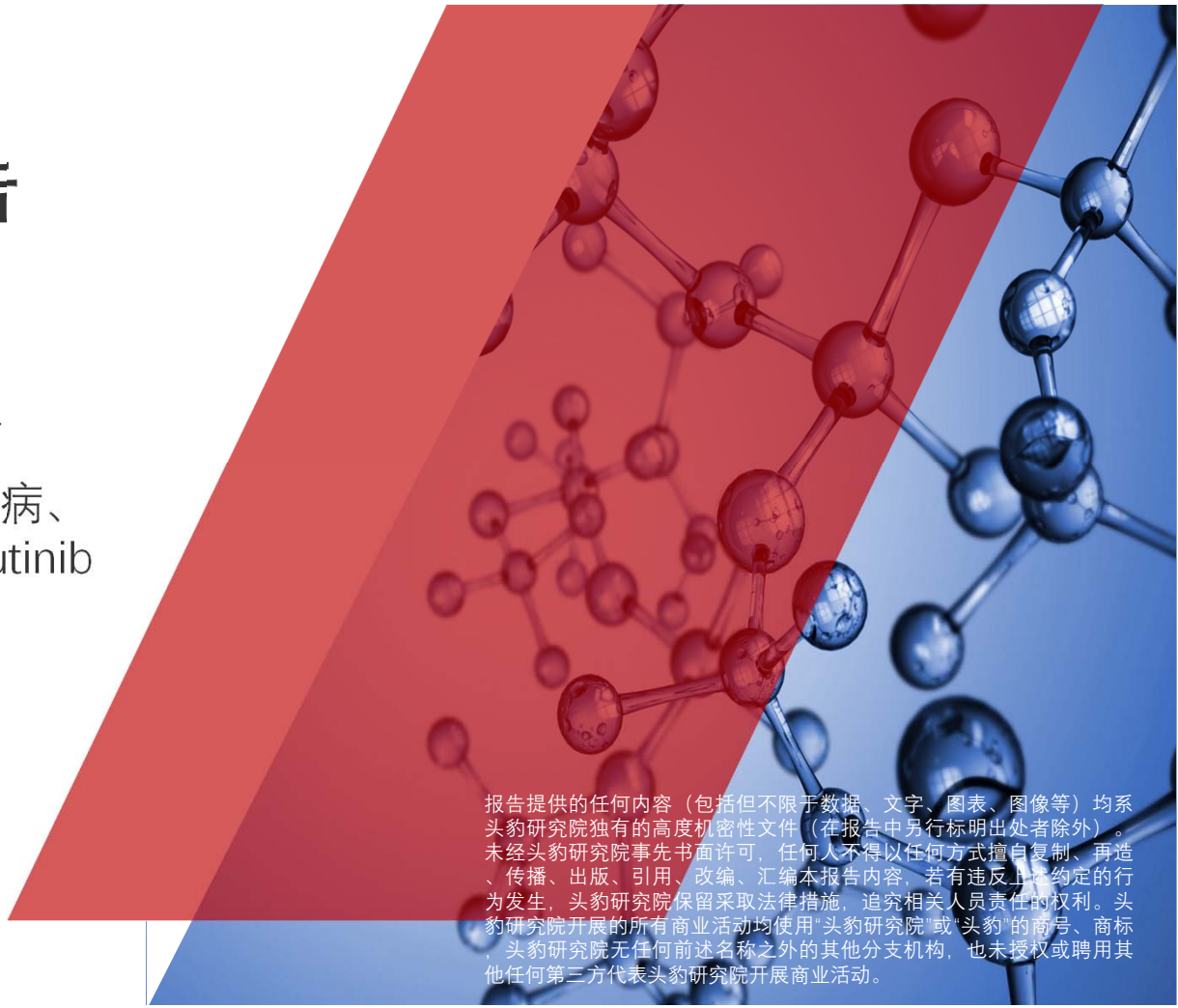
2020 China BTK Inhibitor Short Report

2020年中国BTK阻害剤業界のショートレポート

概览标签：BTK抑制剂、淋巴瘤、自身免疫性疾病、Ibrutinib、Acalabrutinib、Zanubrutinib、Tirabrutinib

报告主要作者：裴兰君

2020/07



报告提供的任何内容（包括但不限于数据、文字、图表、图像等）均系头豹研究院独有的高度机密性文件（在报告中另行标明出处者除外）。未经头豹研究院事先书面许可，任何人不得以任何方式擅自复制、再造、传播、出版、引用、改编、汇编本报告内容，若有违反上述约定的行为发生，头豹研究院保留采取法律措施，追究相关人员责任的权利。头豹研究院开展的所有商业活动均使用"头豹研究院"或"头豹"的商号、商标，头豹研究院无任何前述名称之外的其他分支机构，也未授权或聘用其他任何第三方代表头豹研究院开展商业活动。

概览摘要

BTK全称Bruton's tyrosine kinase，布鲁顿酪氨酸蛋白激酶，是胞浆内非受体型酪氨酸激酶TEC家族中的一员。BTK仅表达于分化阶段的B细胞，在T细胞或正常浆细胞中不表达，BTK是BCR（B细胞表面抗原受体）信号通路的关键激酶，在B细胞生长发育、增殖分化过程中起重要作用，BTK异常可能诱发癌症或自体免疫疾病。**BTK抑制剂是一类可与BTK共价结合的小分子化合物，通过与BTK结合并抑制其活性。**现阶段，全球范围内共获批了**4款BTK抑制剂**，分别为强生和艾伯维共同研发的Ibrutinib、阿斯利康的Acalabrutinib、百济神州的Zanubrutinib以及小野制药和吉列德合作开发的Tirabrutinib。**在中国上市的BTK抑制剂仅有Ibrutinib和Zanubrutinib**，预计中国BTK抑制剂行业市场规模将快速增长，**到2024年，行业市场规模将达到98.9亿元人民币**。

- **自身免疫性疾病适应症将BTK抑制剂推向新的市场高度**

已上市的BTK抑制剂适应症集中于慢性淋巴细胞白血病、套细胞淋巴瘤与小淋巴细胞性淋巴瘤，第一代BTK抑制剂缺乏特异性，因此无法用于治疗自身免疫性疾病的治疗。第二代BTK抑制剂选择性更高，类风湿关节炎为第二代BTK抑制剂试验中最常检测的适应症，BTK抑制剂研发技术的发展与成熟将为多种自身免疫性疾病提供新的治疗选择。

- **淋巴瘤与自身免疫性疾病治疗需求持续增加**

目前，中国淋巴瘤发病率约为6.3/10万人，每年新发病例约为9万人，发病率年增长率为5%-7%。自身免疫性疾病如类风湿关节炎、强直性脊柱炎、银屑病的发病率均在0.1%-0.3%之间，预计到2024年，以上三种疾病的发病人数分别为612.0万、397.1万、676.3万人。**肿瘤与自身免疫性疾病发病人数的增加，将带来药物需求的增长。**

- **国产BTK抑制剂药物加速上市**

中国布局BTK抑制剂的企业数量较少，从研发进展来看，**进展最快的是百济神州的泽布替尼，2020年6月3日获NMPA批准上市**，用于既往至少接受过一种治疗的成人套细胞淋巴瘤（MCL）患者和既往至少接受过一种治疗的成人慢性淋巴细胞白血病（CLL）、小淋巴细胞淋巴瘤（SLL）患者。其次是**诺诚健华的奥布替尼**，用于治疗肿瘤及自身免疫性疾病，2019年12月，NMPA已受理奥布替尼用于治疗复发/难治慢性淋巴细胞白血病(CLL)、小淋巴细胞淋巴瘤(SLL)患者的新药上市申请。

企业推荐：

百济神州、诺诚健华

©2020 LeadLeo

目录

- 名词解释 ---------- 05
- BTK抑制剂定义与作用机制 ---------- 07
- 全球已上市BTK抑制剂简介 ---------- 08
  - 药物获批与销售概况 ---------- 08
  - 药物疗效与安全性对比 ---------- 09
- 全球在研BTK抑制剂简介 ---------- 10
- 中国企业BTK抑制剂布局 ---------- 11
- 中国BTK抑制剂行业市场规模 ---------- 12
- 中国双特异性抗体行业投资企业推荐 ---------- 13
  - 百济神州 ---------- 13
  - 诺诚健华 ---------- 15
- 方法论 ---------- 17
- 法律声明 ---------- 18

©2020 LeadLeo

目录

- Terms ---------- 05
- Mechanism of BTK Inhibitor ---------- 07
- Globally Listed BTK Inhibitor Overview ---------- 08
  - Overview of Approval and Sales ---------- 08
  - Comparison of BTK Inhibitor's Efficacy and Safety ---------- 09
- Overview of BTK Inhibitor in Clinical Stage Worldwide ---------- 10
- China BTK Inhibitor Industry Research Status ---------- 11
- China BTK Inhibitor Industry Market Size ---------- 12
- China BTK Inhibitor Valuable Enterprise Recommendation ---------- 13
  - BeiGene ---------- 13
  - INNOCARE ---------- 15
- Methodology ---------- 17
- Legal Statement ---------- 18

©2020 LeadLeo

名词解释（1/2）

- **靶点：**药物治疗针对的目标分子，通常在疾病的病理过程中扮演重要作用，药物通过抑制或激活该目标分子的生物活性产生临床药效。
- **分子靶向药物：**在细胞分子水平上，针对已经明确的致癌位点设计相应的治疗药物，主要针对恶性肿瘤病理生理发生、发展的关键靶点进行治疗干预。
- **B细胞：**也称为B淋巴细胞，是一种淋巴细胞亚型的白细胞，通过分泌抗体在适应性免疫系统的体液免疫成分中起作用。
- **PI3K：**Phosphatidylinositol 3-kinase，磷脂酰肌醇3-激酶，一种胞内磷脂酰肌醇激酶，与部分癌基因的产物相关，本身具有丝氨酸/苏氨酸激酶的活性，也具有磷脂酰肌醇激酶的活性。
- **PIP2：**Phosphatidylinositol（4,5）bisphosphate，磷脂酰肌醇二磷酸，可被激素或细胞因子受体介导活化的磷酸脂酶C（PLC）水解为第二信使分子肌醇三磷酸（IP3）和二酰基甘油（DAG）参与信号传递。
- **EGFR：**Epidermal Growth Factor Receptor，上皮生长因子受体，广泛分布于哺乳动物上皮细胞、成纤维细胞、胶质细胞、角质细胞等细胞表面，EGFR信号通路对细胞的生长、增殖和分化等生理过程发挥重要的作用。
- **MCL：**Mantle Cell Lymphoma，套细胞淋巴瘤，非霍奇金淋巴瘤的一种，最常见的表现是淋巴结肿大，经常伴随全身症状。
- **CLL：**Chronic Lymphocytic Leukemia，慢性淋巴细胞白血病，一种原发于造血组织的恶性肿瘤，肿瘤细胞为单克隆的B淋巴细胞，形态类似正常成熟的小淋巴细胞，蓄积于血液、骨髓及淋巴组织中。
- **SLL：**Small Lymphocytic Lymphoma，小淋巴细胞性淋巴瘤，原发于造血组织的恶性肿瘤，癌细胞在骨髓中呈现后会进入血细胞。
- **WM：**Waldenström's Macroglobulinemia，华氏巨球蛋白血症，由小B淋巴细胞、浆细胞样淋巴细胞和浆细胞组成的淋巴瘤，常常侵犯骨髓，也可侵犯淋巴结和脾脏。
- **MZI：**Marginal Zone Lymphomas，边缘区淋巴瘤，一种较为常见的B细胞非霍奇金淋巴瘤。
- **PCNSL：**Primary Central Nervous System Lymphoma，原发性中枢神经系统淋巴瘤，一种少见的高度恶性非霍奇金淋巴瘤，其在人免疫缺陷病毒感染人群中的发病率显著高于正常人群。该病病理上为浸润整个脑实质、脊髓及软脑膜等多个部位的弥漫性病变。
- **RA：**Rheumatoid Arthritis，类风湿关节炎，慢性自身免疫性疾病，以滑膜增生、炎性细胞浸润、血管翳形成及关节软骨和骨基质破坏为主要特征，病变呈对称性、破坏性发展，最终可导致关节畸形和功能丧失。
- **NMPA：**National Medical Products Administration，国家药品监督管理局。

©2020 LeadLeo

名词解释（2/2）

- **SLE：**Systemic Lupus Erythematosus，系统性红斑狼疮，人类自身免疫系统失败引起的慢性炎症，身体组织被自身免疫系统攻击，可导致严重器官并发症甚至死亡。常见症状包括关节疼痛和肿胀、发烧、胸痛、脱发、口腔溃疡、淋巴结肿大、疲劳和皮疹。
- **MS：**Multiple Sclerosis，多发性硬化症，一种受免疫系统攻击，发生中枢神经系统白质脱髓鞘病变，使信号在大脑和身体之间传播变得困难的自身免疫性疾病。
- **PV：**Pemphigus Vulgaris，寻常型天疱疮，一组由表皮内棘层松解引起的自身免疫性大疱性皮肤病。
- **FDA：**Food and Drug Administration，美国食品药品监督管理局，由美国国会即联邦政府授权，是美国专门从事食品与药品管理的最高执法机关，亦是国际医疗审核权威机构。
- **EMA：**European Medicines Agency，欧洲药品管理局，欧盟医药产品的审评机构。
- **IND：**Investigational New Drug Application，新药研究申请，开始人体临床试验之前所需的申请及批准过程。
- **NDA：**New Drug Application，新药上市许可申请，临床试验结束之后，药物申请者可提交NDA，申请批准药物销售。
- **临床试验：**验证或发现试验药物的疗效及副作用以确定该药物治疗价值及安全性的调查研究。

©2020 LeadLeo

头豹 LeadLeo

FROST & SULLIVAN 沙利文

招聘 行业分析师

我们一起“创业”吧，开启一段独特的旅程!

邮箱：fs.recruitment@frostchina.com

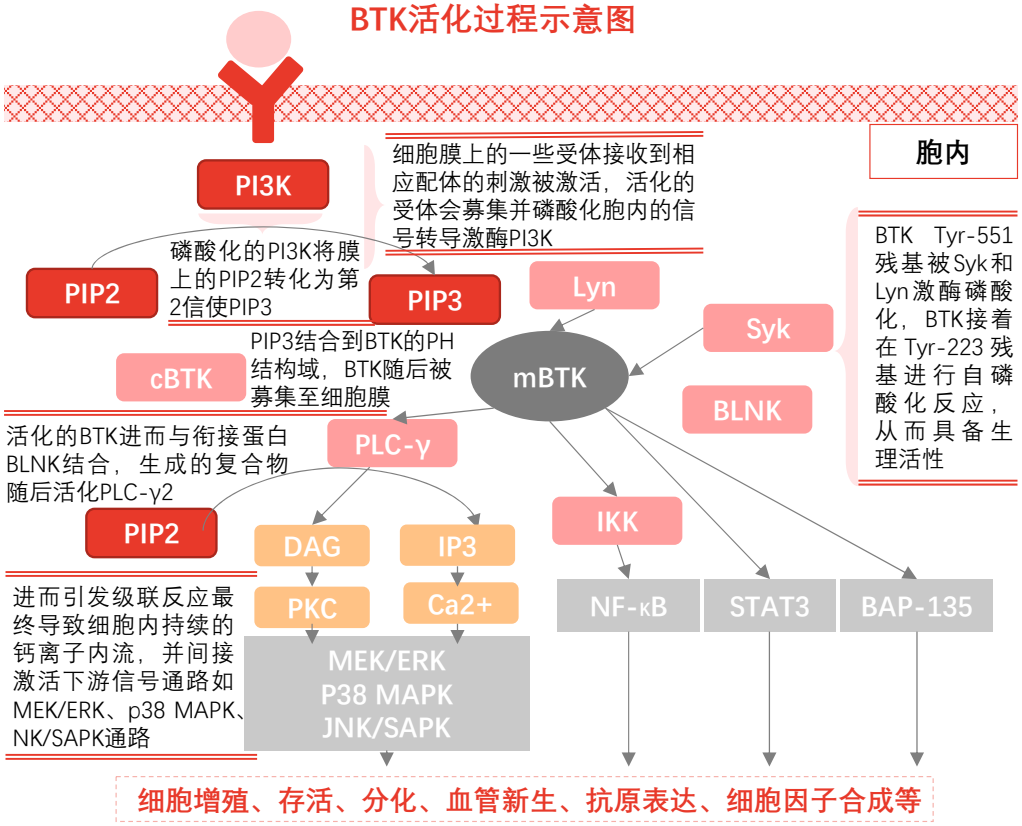
工作地点：北京、上海、深圳、香港、南京、成都

BTK抑制剂定义与作用机制

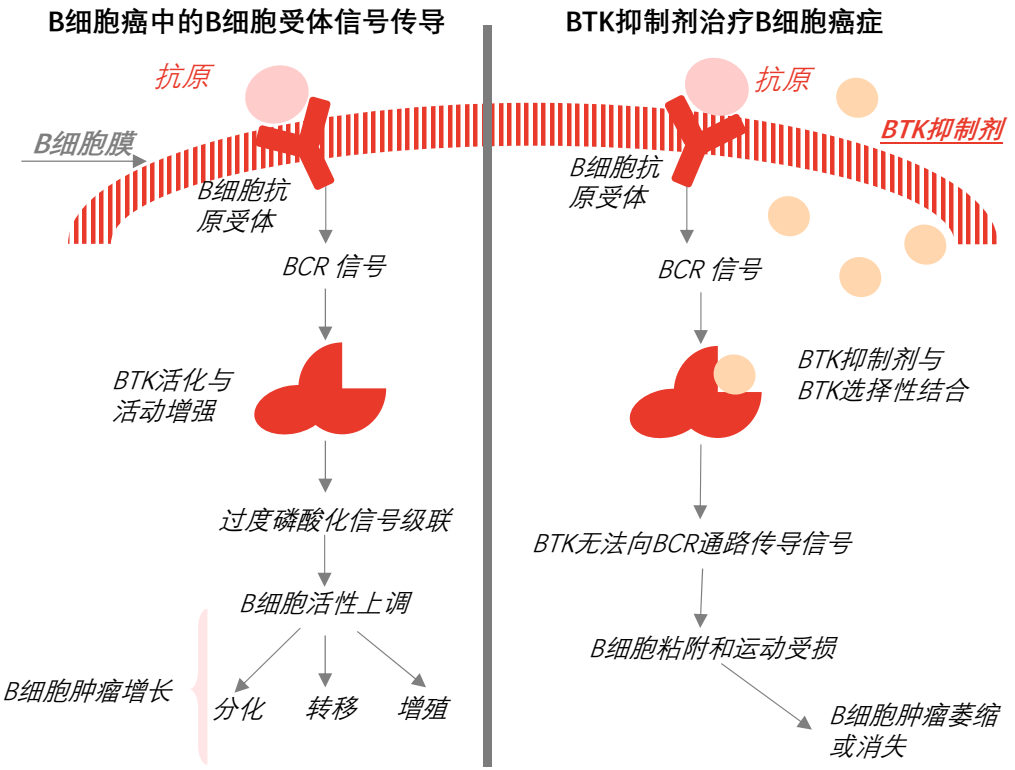
BTK异常可能诱发癌症或自体免疫疾病，BTK抑制剂是一类可与BTK共价结合的小分子化合物，通过与BTK结合并抑制其活性

BTK全称Bruton's tyrosine kinase，布鲁顿酪氨酸蛋白激酶，是胞浆内非受体型酪氨酸激酶TEC家族中的一员。BTK仅表达于分化阶段的B细胞，在T细胞或正常浆细胞中不表达，BTK是BCR（B细胞表面抗原受体）信号通路的关键激酶，在B细胞生长发育、增殖分化过程中起重要作用。BCR信号通路是B细胞发育的关键，也与多种B细胞相关肿瘤与实体肿瘤的发生发展密切相关，**BTK异常可能诱发癌症或自体免疫疾病。BTK抑制剂是一类可与BTK共价结合的小分子化合物，通过与BTK结合并抑制其活性。**

BTK活化过程示意图



BTK抑制剂在B细胞癌症中的作用机制



来源：CNKI，头豹研究院编辑整理

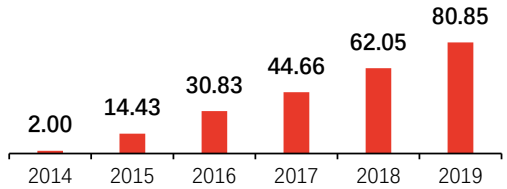
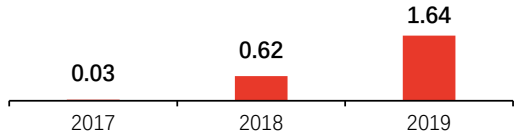
©2020 LeadLeo

全球已上市BTK抑制剂简介（1/2）——药物获批与销售概况

全球范围内共获批了4款BTK抑制剂，分别为强生和艾伯维共同研发的Ibrutinib、阿斯利康的Acalabrutinib、百济神州的Zanubrutinib以及小野制药的Tirabrutinib

截至2020年6月，**全球范围内共获批了4款BTK抑制剂**，分别为**强生和艾伯维共同研发的Ibrutinib（伊布替尼）、阿斯利康的Acalabrutinib（阿卡替尼）、百济神州的Zanubrutinib（泽布替尼）**以及**小野制药和吉列德合作开发的Tirabrutinib**。

全球已上市4款BTK抑制剂概况

药品名称	公司	获批上市日期	获批适应症	月用药费用	全球销售额（亿美元）
Ibrutinib	Johnson&Johnson + abbvie	美国：2013.11	MCL, CLL/SLL, WM, MZI, cGVHD	• 14,,918美元	
		中国：2017.08	MCL, CLL/SLL, WM	• 医保报销前：22,680元人民币 • 医保报销后：8,000元人民币	
Acalabrutinib	AstraZeneca	美国：2017.10	MCL	• 14,896美元	
		美国：2019.11	CLL/SLL	• 14,896美元	
Zanubrutinib	BeiGene	美国：2019.11	MCL	• 13,114美元	2019年美国市场销售额*72万美元*
		中国：2020.06	MCL, CLL/SLL	• 赠药前：22,600元人民币 • 赠药后：8,000元人民币	
Tirabrutinib	ONO GILEAD	日本： 2020.03	PCNSL	-	-

来源：诺诚健华招股书，头豹研究院编辑整理

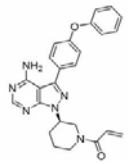
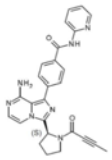
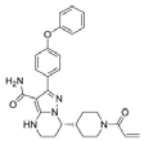
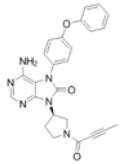
©2020 LeadLeo

全球已上市BTK抑制剂简介（2/2）——药物疗效与安全性对比

从作用机制来看，BTK抑制剂可分为两类：不可逆抑制剂和可逆抑制剂，不可逆抑制剂可提高药物利用效率，可逆抑制剂相较于不可逆抑制剂副作用可能较小

从作用机制来看，BTK抑制剂可分为两类：不可逆抑制剂和可逆抑制剂，不可逆抑制剂理论上可彻底阻断信号通路，提高药物利用效率，可逆抑制剂对靶点蛋白不会造成永久破坏，副作用相较于不可逆抑制剂可能较小。Ibrutinib作为第一个上市的BTK抑制剂，销量强劲，但其不足在于是多激酶靶点抑制剂，易脱靶到其他靶点，容易引起出血、皮疹、腹泻及房颤等副作用，后续BTK抑制剂基于更优选择性的思路设计。**已上市4款BTK抑制剂均为不可逆共价抑制剂。**

全球已上市4款BTK抑制剂疗效与安全性对比

分类		Ibrutinib	Acalabrutinib	Zanubrutinib	Tirabrutinib
分子式					
主要脱靶靶标		ITK、EGFR、TEC、BMX	Minimal	ITK（弱）	TEC（弱）
ORR	二线MCL	65.8%	81.0%	84.0%	-
	一线CLL/SLL	85.0%	86.0%	96.7%	-
副作用	出血（%）（所有级别）	50%	31%	25%	-
	腹泻（%）（所有级别）	54%		23%	21%
	疲劳（%）（所有级别）	50%	27%	18%	
	恶心（%）（所有级别）	33%	18%	-	15%
	头疼（%）（所有级别）	-	38%	-	-

来源：头豹研究院编辑整理

©2020 LeadLeo

全球在研BTK抑制剂简介

第一代BTK抑制剂缺乏特异性，因此无法用于治疗自身免疫性疾病，第二代BTK抑制剂将为多种自身免疫性疾病的治疗提供新的选择

BTK异常可能诱发癌症或自身免疫性疾病，BTK抑制剂可通过与BTK结合抑制其活性，因此，**BTK抑制剂适应症范围广，可用于治疗B细胞癌症以及B细胞介导的自身免疫性疾病**，包括慢性淋巴细胞白血病、套细胞淋巴瘤、小淋巴细胞性淋巴瘤、原发性中枢神经系统淋巴瘤、类风湿性关节炎、多发性硬化、系统性红斑狼疮、天疱疮等。

全球企业BTK抑制剂布局



免费扫码查看高清图片

https://www.leadleo.com/pdfcore/show?id=5fe9709a20410ee6c8952cbd

来源：头豹研究院编辑整理

©2020 LeadLeo

中国企业BTK抑制剂布局

中国布局BTK抑制剂的企业数量较少，从研发进展来看，进展最快的是百济神州的泽布替尼，其次是诺诚健华的奥布替尼

中国布局BTK抑制剂的企业数量较少，**从研发进展来看，进展最快的是百济神州的泽布替尼**，2020年6月3日获NMPA批准上市，用于既往至少接受过一种治疗的成人套细胞淋巴瘤（MCL）患者和既往至少接受过一种治疗的成人慢性淋巴细胞白血病（CLL）、小淋巴细胞淋巴瘤（SLL）患者。**其次是诺诚健华的奥布替尼**，用于治疗肿瘤及自身免疫性疾病，2019年12月，NMPA已受理奥布替尼用于治疗复发/难治慢性淋巴细胞白血病（CLL）、小淋巴细胞淋巴瘤（SLL）患者的新药上市申请。

中国企业BTK抑制剂临床阶段与竞争力分析

	华氏巨球蛋白血症（WM）	慢性淋巴细胞白血病（CLL）	套细胞淋巴瘤（MCL）	小淋巴细胞性淋巴瘤（SLL）	滤泡性淋巴瘤（FL）	类风湿关节炎（RA）	系统性红斑狼疮（SLE）	竞争力
百济神州	申请上市	已上市	已上市	已上市	申请上市			
诺诚健华		申请上市		申请上市		II期	II期	
赛林泰	I/II期	I/II期		I/II期				
艾森生物							I期	
导明医药		I期	I期	I期				
恒瑞医药	临床前	I期	I期	I期		I期		
人福医药						I期		
亨利医药						临床前		
迈度医药	临床前							
必贝特	临床前	临床前				临床前		

来源：头豹研究院编辑整理

©2020 LeadLeo

推广

innovation 创新地图 map

前哨 2020 科技特训营

掌握创新武器　抓住科技红利



王煜全

海银资本创始合伙人
Frost&Sullivan，中国区首席顾问

扫码报名

咨询微信：innovationmapSM
电话：157-1284-6605

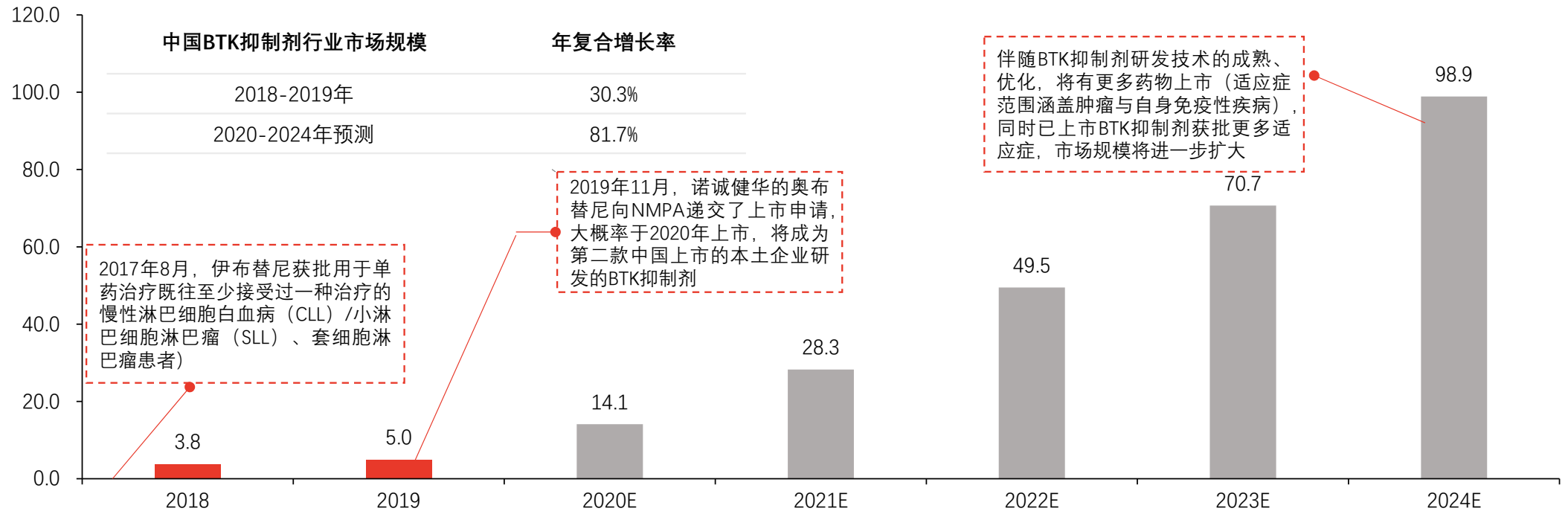
中国BTK抑制剂行业市场规模

根据销售端预测，2020年-2024年，中国BTK抑制剂行业市场规模将由14.1亿元人民币增长至98.9亿元人民币，年复合增长率高达81.7%

截至目前，在中国上市的BTK抑制剂**仅有2017年8月获批的伊布替尼**（用于单药治疗既往至少接受过一种治疗的慢性淋巴细胞白血病（CLL）/小淋巴细胞淋巴瘤（SLL）、套细胞淋巴瘤患者）和**2020年6月获批的泽布替尼**，2019年伊布替尼中国样本公立医院和连锁药店销售额合计3亿人民币，加入未被收录统计的中小医院和私立医院，预计全国销售额**不超过5亿人民币**，不足全球销售额的1%。诺诚健华的奥布替尼于2019年11月向NMPA递交了上市申请，2020年有望获批上市，进一步拓宽中国BTK抑制剂市场规模。根据销售端预测，2020年-2024年，中国BTK抑制剂行业市场规模将由14.1亿元人民币增长至98.9亿元人民币，年复合增长率高达81.7%。

亿人民币

中国BTK抑制剂行业市场规模（按销售额预测），2018-2024年预测



来源：头豹研究院编辑整理

©2020 LeadLeo

头豹 LeadLeo

中国BTK抑制剂行业投资企业推荐——百济神州（1/2）

百济神州主要研发及商业化用于治疗癌症的创新型分子靶向及肿瘤免疫治疗药物，产品泽布替尼成为中国首个获得FDA批准的自主研发的抗癌新药

公司名称：百济神州有限公司　　**成立时间：2010年**　　**中国公司总部：中国北京**

百济神州是处于商业阶段的生物技术公司，主要研发及商业化用于治疗癌症的创新型分子靶向及肿瘤免疫治疗药物，多个候选药物已处于后期临床试验阶段，现今已发展成全方位一体化的全球生物技术公司，其产品维达莎于2018年实现在中国的商业化供应，瑞复美于2018年获批用于治疗新诊断多发性骨髓瘤患者，二者均被纳入国家医保目录。2019年，**替雷丽珠单抗**在中国获批上市，**泽布替尼成为中国首个获得FDA批准的自主研发的抗癌新药**。

百济神州BTK抑制剂（泽布替尼）在研状况例举

用法	主要适应症	临床申请	Ia期临床	Ib期临床	II期临床*	II期临床**	III期临床	上市
单药	复发/难治性套细胞淋巴瘤							
	复发/难治性慢性淋巴细胞白血病/小淋巴细胞淋巴瘤							
	华氏巨球蛋白血症，zanubrutinib对比伊布替尼							
	初治的慢性淋巴细胞白血病/小淋巴细胞淋巴瘤：zanubrutinib对比BR							
	复发/难治性慢性淋巴细胞性白血病/小淋巴细胞淋巴瘤：zanubrutinib对比伊布替尼							
	肺部窘迫新冠肺炎							
联合用药+GAZYVA	复发/难治性滤泡性淋巴瘤							
联合用药+TISLELIZUMAB	胶质母细胞瘤							

来源：百济神州公司官网，头豹研究院编辑整理

©2020 LeadLeo

中国BTK抑制剂行业投资企业推荐——百济神州（2/2）

百济神州开发了癌症生物学自由平台，整合先进药物研发模式和过程，研发出分子靶向药物、免疫肿瘤学疗法以及联合疗法

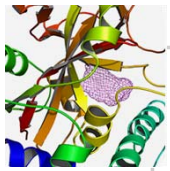
百济神州产品线丰富

分子靶向药物



Zanubrutinib

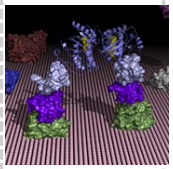
在研的布鲁顿氏酪氨酸激酶（BTK）小分子抑制剂。Zanubrutinib由百济神州自主研发，目前正在全球及中国进行广泛的关键性临床试验项目，作为单药和与其他疗法进行联合用药治疗**多种B细胞恶性肿瘤**



Pamiparib

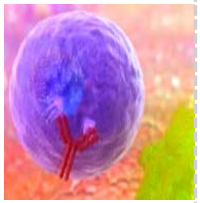
在研**PARP1和PARP2小分子抑制剂**，目前在中国开展作为单药治疗铂敏感**卵巢癌**维持疗法和BRCA胚系突变卵巢癌的关键临床试验。同时，正在就单药和与替雷利珠单抗联合治疗**多种实体恶性肿瘤**进行全球临床开发

Lifirafenib



在研新型具有**RAF单体和二聚体抑制活性的小分子激酶抑制剂**。其作为单药或联合用药治疗**MAPK通路**有突变的癌症的一期临床试验正在进行中，适应症包括第一代BRAF抑制剂无效的BRAF基因突变型和KRAS/NRAS基因突变型癌症

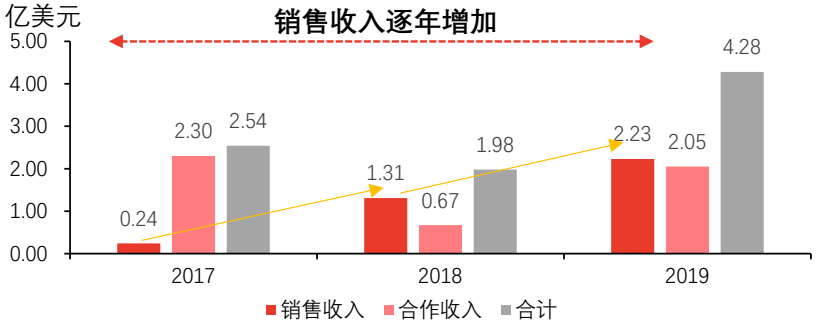
免疫肿瘤学疗法



替雷丽珠单抗

人源性单克隆抗体，属于一类被称为免疫检查点抑制剂的肿瘤免疫药物。替雷利珠单抗是**第一款由百济神州的免疫肿瘤生物平台研发的候选药物**，正作为单药疗法及联合疗法开发针对一系列**实体瘤和血液肿瘤治疗适应症**

百济神州收入状况



强大的生产能力

- **苏州生产基地：**苏州生产基地设有研发中心以及生产工厂，能够实现小分子药物的研发、中试和大规模商业化生产，以及单克隆抗体药物的工艺研发、小试和中试等功能。
- **广州生产基地：**与广州市政府共建，采用全球领先的现代化生产设备KUBio™整体解决方案，支持抗体药物在中国的临床研究及产业化。
- **与勃林格殷格翰合作生产：**替雷利珠单抗由勃林格殷格翰位于上海的世界级生物制药生产基地生产。
- **与康泰伦特合作生产：**与康泰伦特达成了泽布替尼的生产协议。

来源：百济神州公司官网，头豹研究院编辑整理

©2020 LeadLeo

中国BTK抑制剂行业投资企业推荐——诺诚健华（1/2）

诺诚健华是一家处于临床阶段的生物医药公司，拥有一体化生物医药平台，开发用于治疗癌症和自身免疫性疾病的同类最佳或同类首创药物

公司名称：北京诺诚健华医药科技有限公司　　**成立时间：2015年**　　**中国公司总部：中国北京**

北京诺诚健华医药科技有限公司（以下简称"诺诚健华"）是一家处于临床阶段的生物医药公司，拥有一体化生物医药平台，开发用于治疗癌症和自身免疫性疾病的同类最佳或同类首创药物，并最终实现商业化。自主研发的一体化生物医药平台功能包括药物靶目标识别和验证、临床前评估、临床试验设计和执行、药物制造和质量控制，以及商业化生产及销售。诺诚健华已拥有均衡的管线组合，候选药物均是针对经过验证的或新颖的生物通路，重点研发治疗癌症和自身免疫性疾病的两个治疗领域，其中BTK抑制剂奥布替尼（ICP-022）的新药上市申请（NDA）已获NMPA受理。

产品	适应症	全球权力	临床前	I期临床	II期临床	III期临床	新药申请日期
BTK抑制剂	复发难治CLL/SLL	✓					2020年1月进入优先审评
	复发难治MCL	✓					2020年3月进入优先审评
	复发难治MZL	✓					
	复发难治CNSL	✓					
	复发难治WM	✓					
	复发难治非GCB DLBCL（双重突变）	✓					
	FL（联合用药）	✓					
	B细胞恶性肿瘤	✓	美国研发状态				
	SLE	✓					

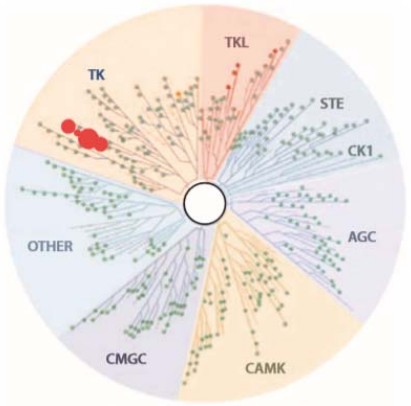
来源：诺诚健华公司官网，头豹研究院编辑整理

©2020 LeadLeo

中国BTK抑制剂行业投资企业推荐——诺诚健华（2/2）

施一公博士是诺诚健华的科学顾问委员会主席与联合创始人，诺诚健华科学顾问团队涵盖结构生物学家、癌症基因组专家、风湿免疫疾病专家与肿瘤学家

Pan-FGFR抑制剂：ICP-192



ICP-192的**目标选择性**比Erdafitinib的报告数据**更高**

诺诚健华核心技术产品优势

ICP-192是目前**中国领先的pan-FGFR抑制剂之一**，具有独特的结构，以有限的体内药物暴露量取得高抗肿瘤疗效。

临床进展

✓ **进行中的临床试验：***I/IIa期研究以确定实体瘤患者的MTD和/或OBD与PK/PD*

- 耐受性良好，无治疗相关的剂量限制性毒性
- 暴露量的增加与剂量成正比
- 8毫克剂量（每天一次）治疗时血浆浓度超过治疗性浓度
- 8毫克或以上剂量（每天一次）治疗时可观察到PD指标

✓ **计划中的试验**

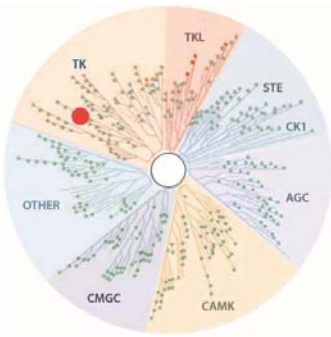
- 具有FGFR融洽的胆管癌患者
- 具有FGFR 2/3 基因突变的尿道上皮癌患者
- 对具有FGFR突变的其他实体瘤在美国进行扩展试验

ICP-105是一种**高选择性的FGFR4抑制剂**，能有效地与FGFR4结合，抑制肝癌中FGF19过表达介导的FGFR4信号激活，通过阻断下游ERK信号通路的激活发挥抗肿瘤作用。ICP-105主要用于**治疗FGFR4通路过度激活的晚期肝癌（HCC）**。

临床进展：

目前正在中国进行一项临床I期的剂量递增试验，以评估ICP-105在实体瘤病人中的MTD和/或OBD。诺诚健华计划启动一项开放的**临床IIa研究**，以评估**ICP-105在具有FGFR4通路过度激活的HCC患者中的安全性和有效性**并探索ICP-105和**免疫检查点抑制剂的联合用药**来治疗具有FGFR4通路过度激活的晚期HCC

FGFR4抑制剂：ICP-105



ICP-105**对FGFR家族其他亚型抑制作用**比对FGFR4的抑制作用**弱几千倍**

投资亮点

- **科研与管理团队优势：施一公博士**是诺诚健华的**科学顾问委员会主席与联合创始人**。施一公博士是**著名结构生物学家**，主要运用结构生物学和生物化学的手段进行**肿瘤发生和细胞调亡的分子机制、与重大疾病相关膜蛋白的结构与功能、细胞内生物大分子机器的结构与功能**三个领域的研究。施一公博士任西湖大学校长、清华大学教授、中国科学院院士、美国艺术与科学院外籍院士、美国国家科学院外籍院士与欧洲分子生物学组织外籍成员。科学顾问委员会委员**张泽民博士**是著名**癌症基因组专家**，前美国**GENENTECH、ROCHE公司生物信息首席科学家**，拥有60项美国专利以及众多欧洲专利。委员**栗占国博士**是**知名风湿免疫疾病专家**，亚太风湿病联盟（APLAR）主席、中国免疫学会临床免疫分会主任委员。**Arnold J. Levine博士**是**著名肿瘤学家**，**肿瘤抑制蛋白分子p53首次发现者**，普林斯顿高等研究院终身荣誉教授、美国科学院院士、美国国家医学院院士。

来源：诺诚健华官网，头豹研究院编辑整理

©2020 LeadLeo

方法论

- 头豹研究院布局中国市场，深入研究10大行业，54个垂直行业的市场变化，已经积累了近50万行业研究样本，完成近10,000多个独立的研究咨询项目。
- 研究院依托中国活跃的经济环境，从医疗服务、生物医药、医疗器械等领域着手，研究内容覆盖整个行业的发展周期，伴随着行业中企业的创立，发展，扩张，到企业走向上市及上市后的成熟期，研究院的各行业研究员探索和评估行业中多变的产业模式，企业的商业模式和运营模式，以专业的视野解读行业的沿革。
- 研究院融合传统与新型的研究方法，采用自主研发的算法，结合行业交叉的大数据，以多元化的调研方法，挖掘定量数据背后的逻辑，分析定性内容背后的观点，客观和真实地阐述行业的现状，前瞻性地预测行业未来的发展趋势，在研究院的每一份研究报告中，完整地呈现行业的过去，现在和未来。
- 研究院密切关注行业发展最新动向，报告内容及数据会随着行业发展、技术革新、竞争格局变化、政策法规颁布、市场调研深入，保持不断更新与优化。
- 研究院秉承匠心研究，砥砺前行的宗旨，从战略的角度分析行业，从执行的层面阅读行业，为每一个行业的报告阅读者提供值得品鉴的研究报告。

©2020 LeadLeo

法律声明

- 本报告著作权归头豹所有，未经书面许可，任何机构或个人不得以任何形式翻版、复刻、发表或引用。若征得头豹同意进行引用、刊发的，需在允许的范围内使用，并注明出处为“头豹研究院”，且不得对本报告进行任何有悖原意的引用、删节或修改。
- 本报告分析师具有专业研究能力，保证报告数据均来自合法合规渠道，观点产出及数据分析基于分析师对行业的客观理解，本报告不受任何第三方授意或影响。
- 本报告所涉及的观点或信息仅供参考，不构成任何投资建议。本报告仅在相关法律许可的情况下发放，并仅为提供信息而发放，概不构成任何广告。在法律许可的情况下，头豹可能会为报告中提及的企业提供或争取提供投融资或咨询等相关服务。本报告所指的公司或投资标的的价值、价格及投资收入可升可跌。
- 本报告的部分信息来源于公开资料，头豹对该等信息的准确性、完整性或可靠性不做任何保证。本文所载的资料、意见及推测仅反映头豹于发布本报告当日的判断，过往报告中的描述不应作为日后的表现依据。在不同时期，头豹可发出与本文所载资料、意见及推测不一致的报告和文章。头豹不保证本报告所含信息保持在最新状态。同时，头豹对本报告所含信息可在不发出通知的情形下做出修改，读者应当自行关注相应的更新或修改。任何机构或个人应对其利用本报告的数据、分析、研究、部分或者全部内容所进行的一切活动负责并承担该等活动所导致的任何损失或伤害。