

和黄医药在美国启动呋喹替尼临床试验

2017年12月15日：和黄医药今日宣布在美国启动呋喹替尼 I 期桥接临床试验。呋喹替尼是一种高选择性强效口服血管内皮生长因子受体（VEGFR）1,2 及 3 的抑制剂。呋喹替尼在中国以结直肠癌、肺癌或胃癌为适应症的多项 II 期和 III 期临床研究均达到了主要终点。此次启动的是一项多中心开放标签的 I 期临床试验，旨在评估呋喹替尼在美国晚期实体瘤患者中的安全性、耐受性和药代动力学特性。首位受试者已于 12 月初接受给药治疗。该研究详情可登录 clinicaltrials.gov，检索 [NCT03251378](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT03251378) 查看。

关于呋喹替尼在中国的研发

结直肠癌：2017 年 6 月，中国食品药品监督管理局（CFDA）受理呋喹替尼以晚期结直肠癌（CRC）为适应症的新药上市申请；2017 年 9 月，CFDA 公布因呋喹替尼具有明显临床价值而授予其优先审评的资格。呋喹替尼的新药上市申请基于一项在中国成功完成的 III 期关键性注册研究 FRESCO。该研究共计纳入 416 名 CRC 患者，其结果于 2017 年 6 月 5 日在美国临床肿瘤学会年会上以[口头报告](#)的形式公布（clinicaltrials.gov 注册号 [NCT02314819](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT02314819)）。呋喹替尼的 3 项早期临床研究为 FRESCO 研究的开展奠定了基础，这 3 项早期临床研究包括：纳入 40 名实体瘤患者的 I 期临床研究、纳入 62 名结直肠癌患者的 Ib 期临床研究以及纳入 71 名结直肠癌患者的 II 期临床研究。

肺癌：呋喹替尼以三线治疗非小细胞肺癌（NSCLC）为适应症的 III 期关键性临床试验 FALUCA（clinicaltrials.gov 注册号 [NCT02691299](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT02691299)）目前也正在中国展开，预计将纳入约 520 名患者。该研究基于一项纳入 91 名三线 NSCLC 患者的 II 期临床试验。另有一项 II 期临床试验也正在进行中，该试验以呋喹替尼联合易瑞沙®（吉非替尼）作为一线疗法，治疗晚期或转移性 NSCLC（clinicaltrials.gov 注册号 [NCT02976116](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT02976116)）。

胃癌：呋喹替尼联合泰素®（紫杉醇）以晚期胃癌或胃食管结合部（GEJ）腺癌为适应症的 III 期关键性临床试验 FRUTIGA（clinicaltrials.gov 注册号 [NCT03223376](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT03223376)）已于 2017 年 10 月启动，预计将纳入超过 500 名患者。

在中国范围内，呋喹替尼由和黄医药和礼来合作开发。

关于呋喹替尼

呋喹替尼（HMPL-013）是一种新型的高选择性小分子候选药物。临床研究证实：通过一日一次的口服剂量即可有效的抑制血管内皮生长因子受体（VEGFR），且脱靶毒性低于其他靶向疗法。呋喹替尼良好的耐受性以及无药物间相互作用的特性，为其与其他癌症疗法相联合提供了理论支持，例如当前正在进行的呋喹替尼联合化疗或其他靶向治疗的临床研究。

癌症进入到晚期，肿瘤会分泌大量 VEGFR 的配体蛋白-血管内皮生长因子(VEGF)，以促进肿瘤组织周围形成大量的血管（血管生成），为肿瘤细胞的生长提供更多的血流、氧气和营养。VEGF 和其受体 VEGFR 在肿瘤的血

管生成中起到了至关重要的作用，而呋喹替尼可以抑制 VEGF/VEGFR 通路。对 VEGF/VEGFR 相关通路的抑制可以阻断肿瘤新生血管形成，从而成为防止肿瘤增长和入侵的一种重要的治疗策略。