

## 和黃醫藥在美國啟動呋喹替尼臨床試驗

**2017年12月15日：**和黃醫藥今日宣佈在美國啟動呋喹替尼 I 期橋接臨床試驗。呋喹替尼是一種高選擇性強效口服血管內皮生長因子受體 (VEGFR) 1,2 及 3 的抑制劑。呋喹替尼在中國以結直腸癌、肺癌或胃癌為適應症的多項 II 期和 III 期臨床研究均達到了主要終點。此次啟動的是一項多中心開放標籤的 I 期臨床試驗，旨在評估呋喹替尼在美國晚期實體瘤患者中的安全性、耐受性和藥代動力學特性。首位受試者已於 12 月初接受給藥治療。該研究詳情可登錄 [clinicaltrials.gov](http://clinicaltrials.gov)，檢索 [NCT03251378](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT03251378) 查看。

### 關於呋喹替尼在中國的研發

**結直腸癌：**2017 年 6 月，中國食品藥品監督管理總局 (CFDA) 受理呋喹替尼以晚期結直腸癌 (CRC) 為適應症的新藥上市申請；2017 年 9 月，CFDA 公佈因呋喹替尼具有明顯臨床價值而授予其優先審評的資格。呋喹替尼的新藥上市申請基於一項在中國成功完成的 III 期關鍵性註冊研究 FRESCO。該研究共計納入 416 名 CRC 患者，其結果於 2017 年 6 月 5 日在美國臨床腫瘤學會年會上以口頭報告的形式公佈 ([clinicaltrials.gov](http://clinicaltrials.gov) 註冊號 [NCT02314819](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT02314819))。呋喹替尼的 3 項早期臨床研究為 FRESCO 研究的開展奠定了基礎，這 3 項早期臨床研究包括：納入 40 名實體瘤患者的 I 期臨床研究、納入 62 名結直腸癌患者的 Ib 期臨床研究以及納入 71 名結直腸癌患者的 II 期臨床研究。

**肺癌：**呋喹替尼以三線治療非小細胞肺癌 (NSCLC) 為適應症的 III 期關鍵性臨床試驗 FALUCA ([clinicaltrials.gov](http://clinicaltrials.gov) 註冊號 [NCT02691299](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT02691299)) 目前也正在中國展開，預計將納入約 520 名患者。該研究基於一項納入 91 名三線 NSCLC 患者的 II 期臨床試驗。另有一項 II 期臨床試驗也正在進行中，該試驗以呋喹替尼聯合易瑞沙® (吉非替尼) 作為一線療法，治療晚期或轉移性 NSCLC ([clinicaltrials.gov](http://clinicaltrials.gov) 註冊號 [NCT02976116](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT02976116))。

**胃癌：**呋喹替尼聯合泰素® (紫杉醇) 以晚期胃癌或胃食管結合部 (GEJ) 腺癌為適應症的 III 期關鍵性臨床試驗 FRUTIGA ([clinicaltrials.gov](http://clinicaltrials.gov) 註冊號 [NCT03223376](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT03223376)) 已於 2017 年 10 月啟動，預計將納入超過 500 名患者。在中國範圍內，呋喹替尼由和黃醫藥和禮來合作開發。

### 關於呋喹替尼

呋喹替尼 (HMPL-013) 是一種新型的高選擇性小分子候選藥物。臨床研究證實：通過一日一次的口服劑量即可有效的抑制血管內皮生長因子受體 (VEGFR)，且脫靶毒性低於其他靶向療法。呋喹替尼良好的耐受性以及無藥物間相互作用的特性，為其與其他癌症療法相聯合提供了理論支持，例如當前正在進行的呋喹替尼聯合化療或其他靶向治療的臨床研究。

癌症進入到晚期，腫瘤會分泌大量 VEGFR 的配體蛋白-血管內皮生長因子(VEGF)，以促進腫瘤組織周圍形成大量的血管 (血管生成)，為腫瘤細胞的生長提供更多的血流、氧氣和營養。VEGF 和其受體 VEGFR 在腫瘤的血管生成中起到了至關重要的作用，而呋喹替尼可以抑制 VEGF/VEGFR 通路。對 VEGF/VEGFR 相關通路的抑制可以阻斷腫瘤新生血管形成，從而成為防止腫瘤增長和入侵的一種重要的治療策略。