

## 和黄医药启动表皮生长因子受体 (EGFR) 抑制剂依吡替尼 (Epirubicin) I 期临床试验

**2011 年 11 月 4 日:** 和黄医药今日宣布启动依吡替尼(HMPL-813) I 期临床试验。依吡替尼是和黄医药研发项目中第三个进入国内临床试验的靶向抗肿瘤候选药物。依吡替尼是作用于表皮生长因子受体(EGFR) 第二代小分子口服抑制剂, 可有效到达目标组织以起到抑制肿瘤的功效。2011 年 10 月 31 日对第一位临床试验者进行了给药治疗。

此次 I 期临床试验主要评估依吡替尼的安全性和耐受性, 以确定最大耐受剂量, 同时评估其抑制各种肿瘤的初步疗效, 如依吡替尼在抑制携带 EGFR 突变基因的非小细胞肺癌(NSCLC)转移至大脑的肿瘤时的疗效等。

临床前研究表明, 依吡替尼在原位脑瘤模型上表现出良好的渗透性和肿瘤抑制作用。且在给予远低于毒性剂量的药物后, 大脑组织中的药物浓度可以起到对脑瘤的抑制效果。在临床前研究中依吡替尼也表现出良好的药代动力学特性和安全性。若该结论在临床试验中得到证实, 依吡替尼将是治疗原发性脑瘤病患和携带 EGFR 突变基因的转移性脑瘤病患的突破性良药。

### 关于肿瘤的表皮生长因子受体 (EGFR)

表皮生长因子受体 (EGFR) 是细胞表皮生长因子 (EGFs) 的蛋白受体。激活 EGFR 可导致肿瘤细胞增殖, 迁移, 侵入身体的其他组织。。小分子酪氨酸激酶抑制剂如依吡替尼(HMPL-813)可有效抑制 EGFR 以达到治疗肿瘤的目的。

第一代小分子 EGFR 抑制剂, 如吉非替尼 (易瑞沙™) 和埃罗替尼 (特罗凯™), 主要用于治疗携带 EGFR 突变基因的非小细胞肺癌。2010 年, 特罗凯™的全球销售额达到了约 13 亿美元。非小细胞肺癌病患中约有 10 - 30%携带 EGFR 突变基因。除非小细胞肺癌病患外, 30%到 40%的成胶质细胞瘤患者也携带 EGFR 突变基因。目前可用的 EGFR 抑制剂, 由于入脑通透性较差以至于在治疗原发性脑瘤和癌症脑转移时效果欠佳。

### 关于肺癌和癌症脑转移

2008 年全球肺癌患者约超过 160 万例, 中国则超过 52 万例。在中国及全球范围内, 肺癌已成为发病最高的癌症之一。

8 - 10%的癌症患者中有癌细胞的脑转移现象发生。在全球范围内, 癌症脑转移是导致病患死亡的主要原因之一。肺癌, 乳腺癌, 皮肤和胃肠道原发癌均可以导致癌症的脑转移。其中, 原发性肺癌最容易引发癌症脑转移, 据估计, 50%的肺癌病患最终都会有脑转移。研究表明, 尽管吉非替尼和埃罗替尼没有起到多大作用, 但是 EGFR 抑制剂对于治疗癌症脑转移有着良好的疗效。