

和黃醫藥啟動表皮生長因子受體 (EGFR) 抑製劑依吡替尼 (Epirubicin) I 期臨床試驗

2011 年 11 月 4 日：和黃醫藥今日宣布啟動依吡替尼 (HMPL-813) I 期臨床試驗。依吡替尼是和黃醫藥研發項目中第三個進入國內臨床試驗的替代抗腫瘤抗體藥物。依吡替尼是作用於表皮生長因子受體 (EGFR) 第二代小分子口服抑製劑，可有效到達目標組織以抑制腫瘤的功效。2011 年 10 月 31 日對第一位臨床試驗者進行了針對治療。

即將開展的 I 期臨床試驗主要評估依吡替尼的安全性和耐受性，克服最大耐受劑量，同時評估其抑制各種腫瘤的初步療效，如依吡替尼在抑制攜帶 EGFR 突變基因的非小細胞肺癌 (NSCLC) 轉移至大腦的腫瘤時的療效等。

臨床前研究表明，依吡替尼在原位腦瘤模型上表現出良好的滲透性和腫瘤抑製作用。並且在給予遠距離毒性劑量的藥物後，大腦組織中的藥物濃度可以對準對腦在臨床前研究中依吡替尼也表現出良好的藥代動力學特性和安全性。若該疾病在臨床試驗中得到證實，依吡替尼將是治療原發性腦瘤病患和攜帶 EGFR 突變基因的轉移性腦瘤病患的突破性良藥。

關於腫瘤的表皮生長因子受體 (EGFR)

表皮生長因子受體 (EGFR) 是細胞表皮生長因子 (EGFs) 的蛋白受體。激活 EGFR 可導致腫瘤細胞增殖，遷移，侵入身體的其他組織。小分子酪氨酸激酶抑製劑如依吡替尼 (HMPL-813) 可有效抑制 EGFR 以達到治療腫瘤的目的。

第一代小分子 EGFR 抑製劑，如吉非替尼 (易瑞沙™) 和埃羅替尼 (特羅凱™)，主要用於治療攜帶 EGFR 突變基因的非小細胞肺癌。2010 年，特羅凱™ 的全球癌症達到了約 13 億美元。非小細胞肺癌病患中約有 10 - 30% 攜帶 EGFR 突變基因。除非小細胞肺癌病患外，30% 到 40% 的成膠質細胞瘤患者也攜帶 EGFR 突變基因。目前可用的 EGFR 抑製劑，由於入腦通透性較差以至於在治療原發性腦癌和癌症腦轉移時效果欠佳。

關於肺癌和癌症腦轉移

2008 年全球肺癌患者約超過 160 萬例，中國則超過 52 萬例。在中國及全球範圍內，癌症已成為發病的最高的癌症之一。

8 - 10% 的癌症患者中有癌細胞的腦轉移現象發生。在全球範圍內，癌症腦轉移是導致病患死亡的首要原因之一。肺癌，癌症，皮膚和吸入道原發癌均可以導致癌症的腦轉移。其中，原發性肺癌最容易引發癌症腦轉移，據估計，50% 的癌症病最終最終都會有腦轉移。研究表明，儘管吉非替尼和埃羅替尼沒有起到多大作用，但是 EGFR 抑製劑對於治療癌症腦轉移和良好的療效。