

和黄医药启动新型受体 (c-Met) 抑制剂沃利替尼 (Volitinib) I 期临床试验

2012 年 2 月 22 日： 和黄医药今日宣布在澳大利亚启动沃利替尼 (HMPL-504) I 期临床试验。沃利替尼是一种小分子新型靶向治疗药物，是 c-Met 受体酪氨酸激酶的高选择性抑制剂，用于癌症治疗。沃利替尼是和黄医药研发的众多肿瘤化合物之一，也是和黄医药第一个在澳大利亚开展临床试验的抗肿瘤药物。2011 年 12 月 21 日，阿斯利康与和黄医药签署了一项合作协议，共同致力于沃利替尼 (Volitinib) 在全球范围内的开发、注册和销售。

沃利替尼的 I 期临床已经通过澳大利亚 Bellberry 人体研究伦理委员会的批准。首先将在 Sir Charles Gairdner 医院 (简称“SCGH”) 进行，由 Michael Millward 教授监督指导，Michael Millward 教授是 SCGH 肿瘤内科主任以及西澳大学临床肿瘤研究教授。此项 I 期临床研究主要评估沃利替尼治疗晚期癌症患者的安全性和耐受性，确定其最大耐受剂量，同时评估沃利替尼治疗多种肿瘤，包括肺癌和胃癌的初步疗效。c-Met 的基因扩增和蛋白表达水平将会在后阶段的临床试验中作为筛选患者的指标。

Michael Millward 教授表示：“沃利替尼是一种高选择性地抑制 c-Met 的口服抗癌药物。我们非常荣幸其首次人体 I 期临床试验能够在澳大利亚开展，同时也非常高兴能够在这个很有潜力的个体化新药的全球开发中起到关键性的作用。

沃利替尼是经过对 274 个激酶的筛选而证实的一种高选择性 ATP 竞争性 c-Met 抑制剂。沃利替尼的临床前研究表明在一系列的人体肿瘤异体移植模型中，特别对于 c-Met 基因扩增或 c-Met 过度表达的情况有肿瘤抑制作用。

关于 c-Met 信号通道

c-Met (也称为 HGFR) 信号通道在哺乳类动物正常生长和发育过程中具有特殊作用。然而已有研究表明，这种通道在不同的癌症中表现异常。沃利替尼是有效的高选择性 c-Met 抑制剂，在一系列临床前疾病模型中已证明其可有效地抑制肿瘤生长，尤其是对于 c-Met 基因扩增或 c-Met 蛋白过度表达等 c-Met 信号传导异常的肿瘤具有明显的抑制作用。这些生物标志物可能在后期阶段临床试验中用于筛选有效临床试验受试患者。

关于和黄医药

和黄医药是中国领先的创新药物研发企业，主要研发治疗癌症和自身免疫性疾病的创新药物。和黄医药目前拥有约 200 位科学家和员工，其在研新型口服药物在北美、欧洲、澳大利亚和大中华区均有临床试验。